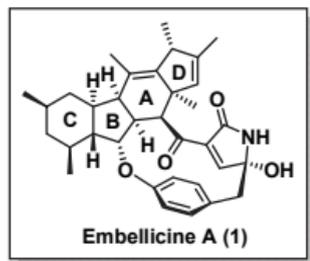


22L-am06S

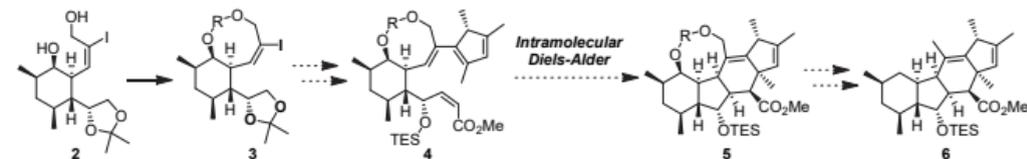
NF- κ B 阻害活性物質 Embellicine A の全合成研究

○平川 明啓¹, 坪郷 哲^{1,2}, 内呂 拓実^{1,2} (¹東京理大薬, ²東京理大戦略的物理製剤学研セ)

【背景】Embellicine A (**1**)¹⁾は2013年に Prokshらにより、真菌 *Embellisia eureka* から見出された天然有機化合物であり、NF- κ B による転写活性を強く阻害すること知られている。本化合物は *cis* 型に縮環した AB 環部を含む四環性骨格を有しているものの、その全合成については、未だ報告されていない。そこで、筆者らは架橋構造をもつ前駆体の分子内 Diels-Alder 反応により、**1** の四環性骨格を構築する方法を確立することを目的として研究を行った。



【方法・結果】C 環部位とジエン部位とが架橋された前駆体 **3** に対して、立体規制型の分子内 Diels-Alder 反応を行うことにより ABD 環部位を一挙に構築した後、架橋構造の除去を通じて、Embellicine A の四環性骨格を構築することができるものと考えた。そこで、まず、L-アスコルビン酸を出発原料として用い 8 段階の反応を経てビニルヨード **2** を合成した後、シリレン架橋体 **3** を合成した。現在、IMDA 反応前駆体 **4** への誘導について検討している。



1) A. Debbab, P. Proksch *et al.*, *J. Med. Chem.*, **2013**, *56*, 2991.