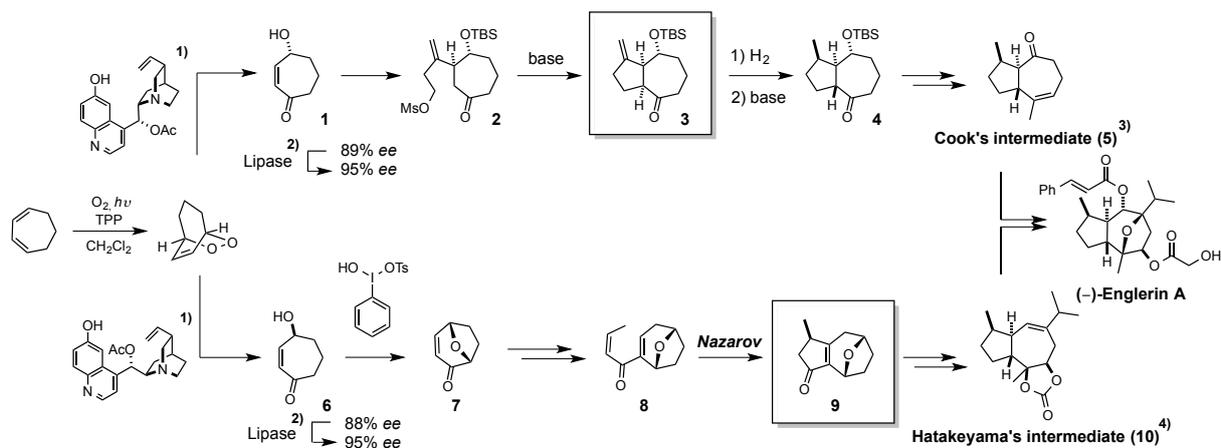


## ビスクロ[5.3.0]デカン型キラル合成素子の開発と 天然物合成への応用 Development of Bicyclo[5.3.0]decane-type Chiral Building Blocks and Application to Natural Product Synthesis

森崎敬介・小関尊弘・澁田拓郎・濱直人・笹野裕介・叶直樹・岩渕好治（東北大院薬）

ビスクロ[5.3.0]デカン型骨格 (ヒドロアズレン骨格) は興味深い生物活性を発現する天然物にしばしば見いだされることから、創薬化学的に魅力的な構造単位として注目を集めている。これまでビスクロ[5.3.0]デカン型化合物の多くは、化学・位置・立体選択的反応を駆使して単環性、あるいは鎖状化合物を合成し、合成終盤にビスクロ環骨格を構築する戦略に基づいて合成されてきた。一方で、合成序盤にビスクロ[5.3.0]デカン骨格を構築し、このものを合成素子として順次官能基を導入していく合成法は、誘導体合成等の拡張性という観点での優位性が期待される。しかしながら、ビスクロ環化合物は鎖状化合物や単環性化合物とは異なる反応性を有するためか、このような合成研究は前例に乏しい。

当研究室では、キナアルカロイド由来の有機触媒を用いた Toste-Kornblum-DeLaMare 転位反応<sup>1)</sup> とリパーゼ PS による光学精製を鍵として、光学活性 $\gamma$ -ヒドロキシシクロヘプテノンの両対掌体 **1**, **6** を 95% ee 以上の光学純度で調製する手法を確立している。<sup>2)</sup> 今回我々は、これらの化合物を起点としてビスクロ[5.3.0]デカン型キラル合成素子 **3**, **9** を設計、合成した。続いて、これらのキラル合成素子の有用性を実証するため、抗腫瘍活性天然物 englerin A の合成研究を行った。本発表ではその詳細について報告する。



### <参考文献>

- 1) Toste, F. D. *et al. J. Am. Chem. Soc.* **2006**, *128*, 12658.
- 2) Iwabuchi, Y. *et al. Org. Lett.* **2011**, *13*, 3620.
- 3) Cook, S. P. *et al. Org. Lett.* **2012**, *14*, 3340.
- 4) Hatakeyama, S. *et al. J. Org. Chem.* **2012**, *77*, 7364.

### 発表者紹介

氏名 森崎敬介 (もりさきけいすけ)  
 所属 東北大学 大学院薬学研究科  
 学年 博士課程後期 2 年  
 研究室 合成制御化学分野 (岩渕好治教授)

