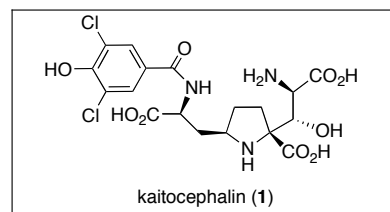


Rh(II)触媒 C-H アミノ化を鍵とするカイトセファリンの全合成

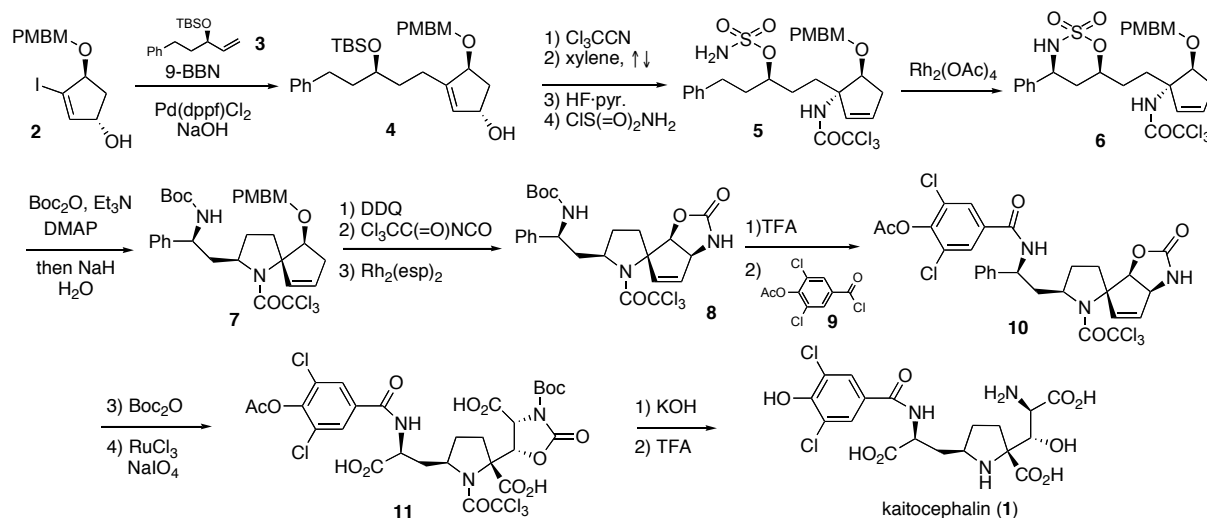
Total Synthesis of Kaitocephalin Based on Rh-catalyzed C-H Amination

山口大介、高橋圭介、石原 淳、畑山 範
(長崎大学大学院医歯薬学総合研究科)

カイトセファリン(**1**)は 1997 年、瀬戸、新家らによって真菌 *Eupenicillium sherii* PF1191 より単離された天然アミノ酸である。本化合物は中枢におけるグルタミン酸受容体 NMDA 型サブタイプに対してアンタゴニスト活性を示すことが明らかにされ、脳神経疾患治療薬のリード化合物として注目されている。最近、我々は、C-H アミノ化反応を活用する新たなピロリジン環合成法を見出し、その方法論に基づく **1** の全合成を達成したので、本発表ではその経緯について報告する。



2 と **3** を鈴木カップリングにより連結し、**4** からの Overman 転位とスルファメート化により含窒素 4 置換炭素を有する **5** を得、Du Bois の条件下、C-H アミノ化により **6** へと導いた。このものを Boc 化の条件に付し、原料消失後、NaH と水を系中に加えると、速やかな環化が起り、**1** のピロリジンコア構造を有する **7** が得られた。続いて、アリル位の C-H アミノ化により **8** を得、**9** とのアミド化、**10** のカルバメート部の Boc 化とそれに続くオレフィンとフェニル基の酸化的開裂、**11** の脱保護を経て **1** の全合成を達成した。



<参考文献>

1) 高橋圭介、山口大介、Lu Shenlei、石原淳、畑山範 第 5 3 回天然有機化合物討論会講演要旨集 p175. 論文投稿準備中

発表者紹介

氏名 山口大介 (やまぐちだいすけ)
所属 長崎大学大学院医歯薬学総合研究科

学年 修士課程 2 年
研究室 薬品製造化学研究室 (畑山範教授)

