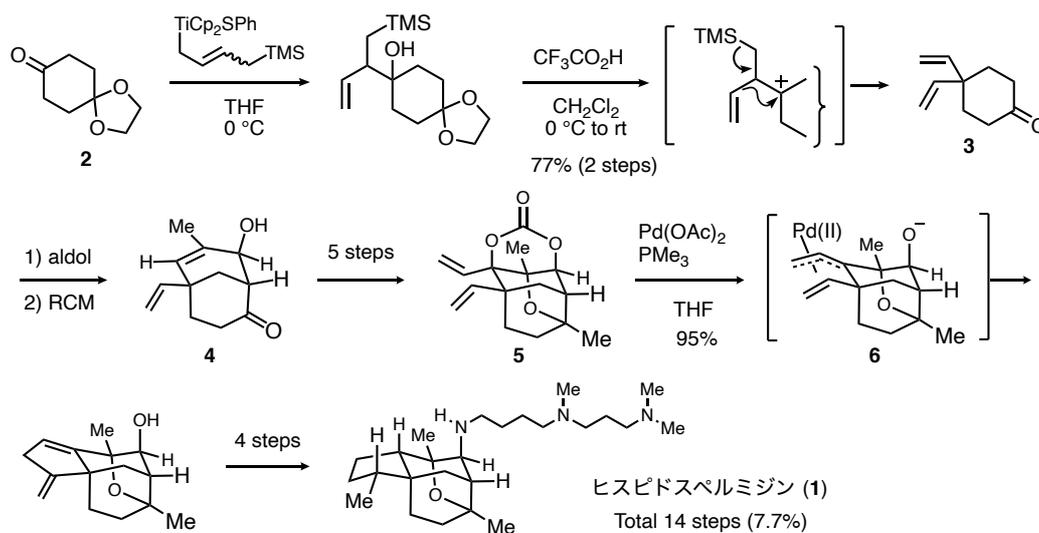




ヒスピドスペルミジンの全合成 Total Synthesis of Hispidospermidin

齋藤 優輝¹、谷野 圭持² (北大院総化¹、北大院理²)

生物活性天然物には多環性骨格を有するものが多数存在し、特にオルト縮環と架橋環を併せ持つカゴ型骨格は構築の困難さから合成化学者の興味を集めてきた。ヒスピドスペルミジン(1)は日本ロシユの研究者により真菌の一種から単離された天然物であり、架橋エーテル環と三つの炭素環を含む多環性カゴ型コア骨格を有する。^{1a,b} その生物活性としてはホスホリパーゼCに対する阻害活性を示すことが知られている。^{1a} 今回我々は、新規カゴ型骨格構築法に基づく1の効率的全合成(総工程数14工程、総収率7.7%)を達成した。最初に、独自に開発したgem-ジビニル構造の短段階構築法²を市販のケトン2に適用し、4,4-ジビニルシクロヘキサノン(3)を合成した。続いて、アルドール反応と閉環メタセシス反応を経て架橋骨格を有するケトール4へと導いた。次に、5工程の変換で1,5-ジエン部位を有する環状カーボネート基質5に変換後、 π -アリルパラジウム中間体6を経由する新規な触媒的環化反応に付して5員環部を構築した。最後に、二重結合の立体選択的な接触水素化およびトリアミン側鎖の導入を経て1の全合成を完了した。



<参考文献>

1) a) Yanagisawa, M.; Sakai, A.; Adachi, K.; Sano, T.; Watanabe, K.; Tanaka, Y.; Okuda, T. *J. Antibiot.* **1994**, *47*, 1. b) Ohtsuka, T.; Itezono, Y.; Nakayama, N.; Sakai, A.; Shimma, N.; Yokose, K.; Seto, H. *J. Antibiot.* **1994**, *47*, 6.

2) 小倉綾太、佐藤和都、谷野圭持 日本化学会第98春季年会 2018, 4H5-01, 船橋.

発表者紹介

氏名 齋藤 優輝 (さいとう ひろき)
所属 北海道大学大学院総合化学院
学年 D2
研究室 有機化学第二研究室

