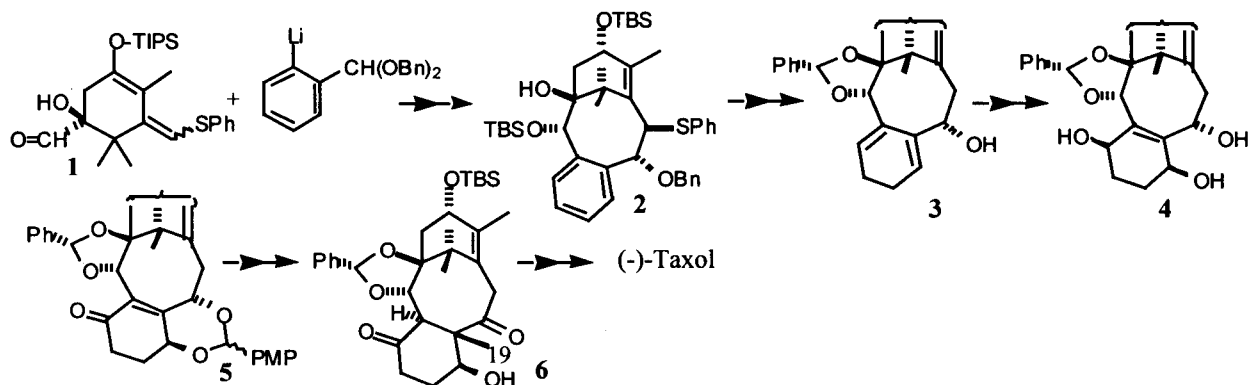


(東工大院理工・北里研) 草間 博之・原 亮磨・河原 滋・西森 俊之・加島 宗・中村 信人・森平 浩一郎・  
○桑嶋 功

タキソールは高度に歪んだ8員環を含む4環性炭素骨格からなる特異な構造と制癌活性等の生理活性を示すことから最も注目を集めている化合物の一つである。我々は、これまでに分子内アルドール反応を利用する3環性タキサン骨格の効率的な構築法<sup>1)</sup>を開発し、これを基盤として光学活性A環部 $1^{2)}$ とシクロヘキサジエンC環部を出発物質とするタキソールの全合成を達成したが、<sup>3)</sup>後者が不安定であることを考慮して、C環部として芳香族化合物を用いるより効率的な全合成について検討した。 $1$ とC環部を連結した後、タキサン骨格構築法を適用して3環性中間体 $2$ を構築し、ベンジル基の除去と酸化により得られる9-ケト体のBirch還元とカルボニル基の還元により $3$ とした。次いで、一重項酸素酸化により水酸基を導入し、この $4$ を経てC環エノン $5$ を合成した。ここで $5$ へのC19-メチル基の効率的導入法を開発して重要中間体 $6$ へと導いた。引き続き、立体選択的な官能基の導入、オキセン骨格の構築およびC13位へのアシル基の導入を経て、新規ルートによるタキソールの不斉全合成を達成した。<sup>4)</sup>



文献：1) I. Kuwajima et al, *J. Am. Chem. Soc.*, **111**, 8277 (1989). 2) I. Kuwajima et al, *Tetrahedron Lett.*, **35**, 7813 (1994).  
3) K. Morihira, H. Kusama, I. Kuwajima et al, *J. Am. Chem. Soc.*, **120**, 12980 (1989). 4) H. Kusama, K. Morihira,  
I. Kuwajima et al, *J. Am. Chem. Soc.*, **122**, 3811 (2000).