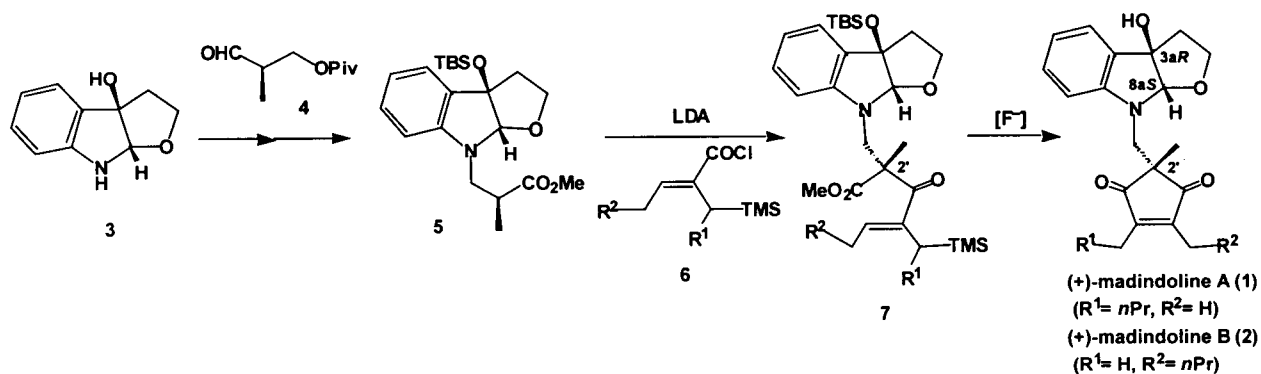


(北里大薬・北里研) 砂塚 敏明・○廣瀬 友靖・白畑 辰弥・針谷 義弘・桑嶋 功・大村 智

北里研究所において *Streptomyces nitrosporeus* K93-0711 株の培養液より単離された新規 IL-6 活性阻害物質マジンドリン A (1) 及び B (2) は高官能基化されたジケトシクロペンテン骨格に 3a-ヒドロキシフロインドリン骨格がメチレン鎖を介して結合したユニークな構造を有し、両者は互いに 2' 位の立体異性体である。我々は、これまでに、マジンドリン類の不斉合成、及び絶対配置の決定について報告している<sup>1)</sup>。今回は、より短行程かつ高立体選択的な不斉合成ルートの確立に成功したので報告する。1、2 の合成上、特に問題となる点は高官能基化されたシクロペンテン部分の構築と環上の 4 級炭素の構築であるが、以下の方法によりそれらを解決した。すなわち、光学活性な 3a-ヒドロキシフロインドリン 3 とアルデヒド 4 を出発物質として、還元的 *N*-アルキル化反応を経て 5 を合成した。続いて、5 とアリルシランの酸クロライド 6 との C-アシル化反応を行ったところ、3a-ヒドロキシフロインドリン部分の立体構造に起因して高選択的に 2' 位の 4 級炭素が制御された 7 を得ることが出来た。最後にアリルシランを利用した分子内アシル化反応を行ったところ一挙にシクロペンテン部分が構築でき 1、2 の全合成を達成した。



文献：1) T. Sunazuka, T. Hirose, T. Shirahata, Y. Harigaya, M. Hayashi, K. Komiyama, S. Omura, A. B. Smith III,  
*J. Am. Chem. Soc.*, **122**, 2122 (2000).