金触媒によるアザスピロ環化の開発とファシクラリン全合成への応用

（中大理工）○高取祐希・半澤凌平・不破春彦
Development of Au-catalyzed azaspirocyclization: Total synthesis of fasicularin
(*Department of Applied Chemistry, Faculty of Science and Engineering, Chuo University*) ○ Yuki Takatori, Ryohei Hanzawa, Haruhiko Fuwa

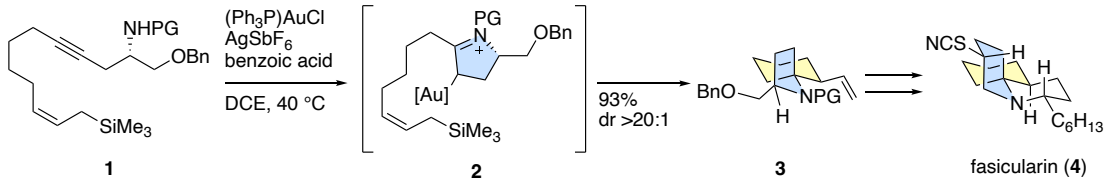
There are many natural products containing a spirocyclic pyrrolidine/piperidine skeleton. Development of a new and efficient method for the synthesis of spirocyclic pyrrolidine/piperidines is significant because of their attractive three-dimensional skeletal structure and biological activities.

Earlier, we reported that intramolecular hydroamination of alkynes **1** with cationic Au(I) complex in the presence of allyltrimethylsilane provided spirocyclic pyrrolidine derivatives **3** in a single step with excellent diastereoselectivity. In this presentation, we will report on the application of our tandem azaspirocyclization reaction to the total synthesis of fasicularin.

Keywords : tricyclic marine alkaloids; tandem reaction; azaspirocycles

スピロ環状ピロリジン/ピペリジン骨格を有する天然物は多く存在し、その三次元的な骨格構造と興味深い生物活性から、効率的な構築法の開発が求められる。

これまでに我々は、鎖式のアミノアルキン **1** をカチオン性 Au 触媒で処理することで、分子内ヒドロアミノ化と生じたイミニウムイオンへの求核付加反応により、スピロ環状ピロリジン誘導体 **3** へ一工程で高立体選択的に変換できるタンデム反応を報告した[1]。今回、本タンデム反応を応用してファシクラリン (**4**) の全合成を達成したので、その詳細を報告する。



1) Fuwa, H. *et al*., *Org. Lett*. **2022**, *24*, 6237−6241.

© The Chemical Society of Japan