(±)-Eburnamonine の 4 工程全合成

（慶大理工）○杉山 靖和・岡村 俊孝・佐藤 隆章

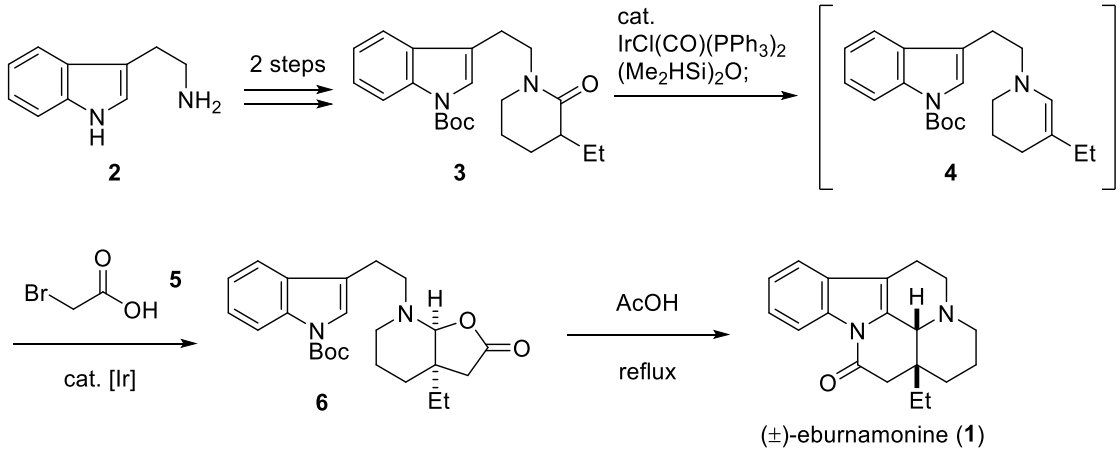
Four-step Total Synthesis of (±)-Eburnamonine (*Keio Univ.*) ○ Yasukazu Sugiyama, Toshitaka Okamura, Takaaki Sato

The *Eburnan* alkaloids consists of one of the largest family of monoterpene indole alkaloids. In this talk, we report a four-step total synthesis of eburnamonine (**1**), which has the basic skeleton of *Eburnan* alkaloids. Our synthesis features an iridium-catalyzed reductive formation of cyclic enamine **4** from lactam **3**, and iridium-catalyzed reaction with bromoacetic acid **5** in a one-pot process to give *N*,*O*-acetal **7**.

Keywords : lactam; alkaloids; indole; iridium; total synthesis

Eburnamonine (**1**)は、1959 年にキョウチクトウ科の植物 *Hunteria eburnea* Pichon より単離されたモノテルペンインドールアルカロイドである [1]。本天然物の構造を基本骨格として持つ *Eburnan* 類は、抗腫瘍活性を有する二量体天然物の構造中に見られるため、医薬品のリード化合物として注目されている。本研究では、イリジウム触媒を用いたラクタムに対する還元的エナミン合成を基盤とした(±)-eburnamonine (**1**)の短工程全合成に取り組んだ。

購入可能なトリプタミン **2** から 2 工程にて合成可能なラクタム **3** のカルボニル基を、触媒量の $IrCl(CO)(PPh_3)_2$ と$(Me_2HSi)_2O$ で還元し、環状エナミン **4** とした [2]。続いて、ワンポット反応にてイリジウム触媒による **4** とブロモ酢酸 **5** との分子間反応を試みると、*N*,*O*-アセタール **6** が得られた。**6** を酢酸で処理して加熱すると、Boc 基の除去とともに連続的な分子内環化反応が進行した。以上により、市販の出発原料より 4 工程にて(±)-eburnamonine (**1**)の全合成を達成した。



1) Raymond-Hamet *et al*., *Compt. rend*. **1959**, *249*, 1259. 2) H. Nagashima *et al., Chem. Commun*. **2009**, 1574.

© The Chemical Society of Japan