

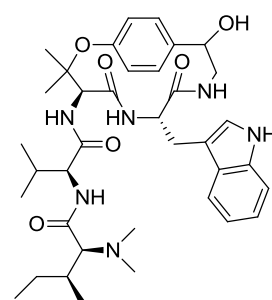
抗マラリア活性を持つ天然物 ヒメノカルジノールの全合成研究

(茨大院理工) ○池水 祐・羽入 加奈子・佐藤 格

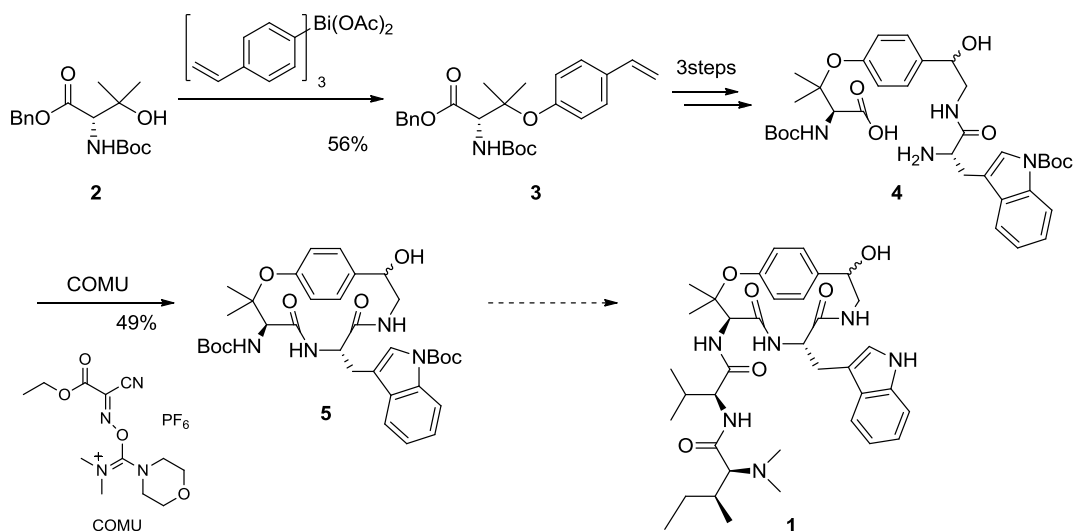
Synthetic Study of Hymenocardinol (*Graduate School of Science and Engineering, Ibaraki University*) ○Yu Ikemizu, Kanako Hanyu, Itaru Sato

Hymenocardinol (**1**), isolated from *Hymenocardia acida* in 2016, shows moderate antiplasmodial activity. This natural product has a 14-membered cyclopeptide and an *tert*-alkyl aryl ether linkage. In this study, we investigated an arylation of a *tert*-alcohol and a following macrocycle construction.

Keywords: Hymenocardinol; Cyclopeptide Alkaloids; *tert*-Alkyl Aryl Ether; Macrocyclization; Antimalaria;

Hymenocardinol (**1**)

ヒメノカルジノール (**1**)は2016年にアフリカ原産植物 *Hymenocardia acida* より単離された抗マラリア活性を有する天然物であり¹⁾、14員環のマクロ環状構造と環内の第三級アルキル-アリールエーテル部位を特徴とするシクロペプチドアルカロイドである。我々は合成上の鍵となる第三級アルコールのアリールエーテル化と中員環状ペプチドの構築に成功したので報告する。D-セリンより5工程で合成した第三級アルコール **2** に対してトリアリールビスマスを用いた *O*-アリール化反応を行い、アリールエーテル **3** を合成した。スチレン部の位置選択的アミノヒドロキシ化の後、L-トリプトファン誘導体との縮合によって環化前駆体 **4** を得た。縮合剤に COMU²⁾を用いた分子内アミド縮合によってヒメノカルジノールの環状骨格の形成に成功した。現在はこれに続く側鎖の縮合を検討中である。



1) Tuentner, E.; Exarchou, V.; Balde, A.; Cos, P.; Maes, L.; Apers, S.; Pieters, L. *J. Nat. Prod.* **2016**, 79, 1746. 2) El-Faham, A.; Funosas, S. R.; Rohens, R.; Albericio, F. *Chem. Eur. J.* **2009**, 15, 9404.