

Protoaculeine B および aculeine 類の固相全合成による構造の確定

(横浜市立大学¹・静岡県大塚・函館高専³・北大院水⁴)

○入江 楽¹、高木 紗羅¹、若林 稜也¹、谷 知恵²、松永 智子³、稲井 誠²、
大内 仁志²、酒井 隆一⁴、菅 敏幸²、及川 雅人¹

Structure elucidation of protoaculeine B and aculeines by solid-phase total synthesis

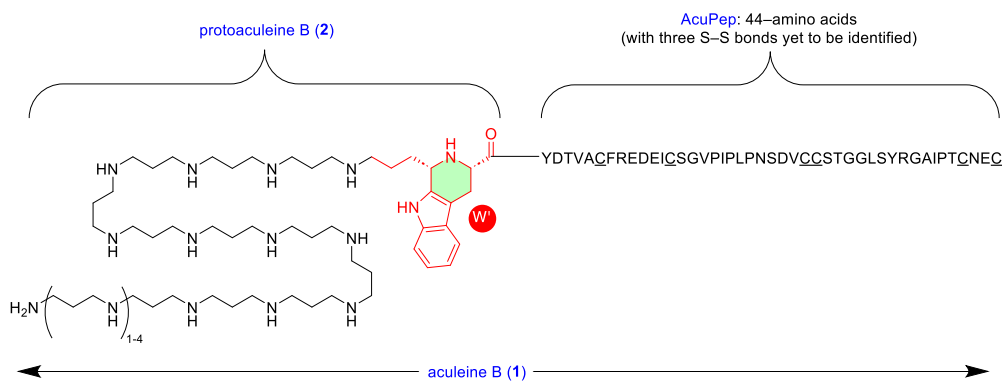
(¹Yokohama City University, ²University of Shizuoka, ³National Institute of Technology, Hakodate College, ⁴Hokkaido University)

○Raku Irie¹, Sara Takaki¹, Ryoya Wakabayashi¹, Chisato Tani², Satoko Matsunaga³,
Makoto Inai², Hitoshi Ouchi², Ryuchi Sakai⁴, Toshiyuki Kan², Masato Oikawa¹

Aculeines are polyamine-peptide conjugated marine toxins that show toxicity by disrupting cell membranes.¹ The highly hydrophilic and polycationic properties of the polyamine moiety had hampered the solution phase synthesis.² Herein we report solid-phase total synthesis of protoaculeine B that is an N-terminal residue of aculeine B, and other aculeines, the structures of which differ in the peptide moiety.

Keywords : polyamine; peptide; solid-phase synthesis; total synthesis; marine natural product

Aculeine 類は生体膜のかく乱による毒性を示す、ポリアミン-ペプチド複合型海洋天然物である¹。演者らは aculeine B (1) の N 末端アミノ酸である protoaculeine B (2) の提唱構造の液相による全合成²、および簡略化体の合成による構造訂正³をおこない、過去の本年会で報告している。その際、目的物の高親水性、ポリカチオン性に由来する取り扱い上の課題が明らかとなったため、訂正構造の合成は固相でおこなうこととした。今回、演者らは protoaculeine B、およびペプチド部分と縮合した各種 aculeine 類の初の全合成を達成し、その構造を確定したので報告する。



[1] (a) Matsunaga, S.; Jimbo, M.; Gill, M. B.; Lash-Van Wyhe, L. L.; Murata, M.; Nonomura, K.-i.; Swanson, G. T.; Sakai, R. *ChemBioChem* **2011**, *12*, 2191–2200.

(b) Matsunaga, S.; Kishi, R.; Otsuka, K.; Fujita, M. J.; Oikawa, M.; Sakai, R. *Org. Lett.* **2014**, *16*, 3090–3093.

[2] Irie, R.; Miyahara, M.; Nakamura, S.; Honda, A.; Sakai, R.; Oikawa, M.; *J. Nat. Prod.* **2020**, *83*, 2769–2775.

[3] Irie, R.; Miyako, K.; Matsunaga, S.; Sakai, R.; Oikawa, M.; *J. Nat. Prod.* **2021**, *84*, 1203–1209.