

ビスホスホリルコリン構造を持つ天然物 Gentianaline B の全合成研究

(東理大理¹・千葉大²) 村田 貴嗣¹・福西 希梨¹・○平賀 駿星¹・内田 健太¹
 ・関 里亜²・大楠 美佐子²・亀井 克彦²・渡辺 哲²・石和田 稔彦²・殿井 貴之¹
 ・椎名 勇¹

Total Synthesis of Gentianaline B Bearing Bis-phosphocholine Moiety

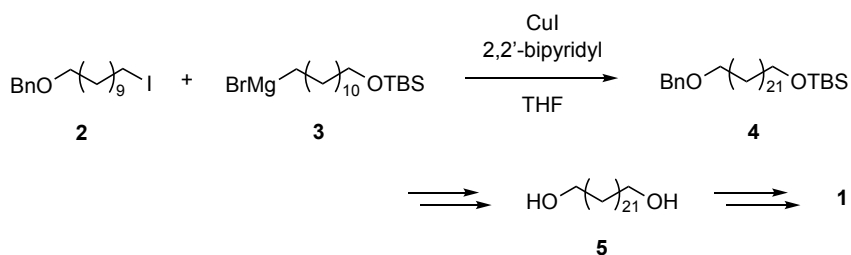
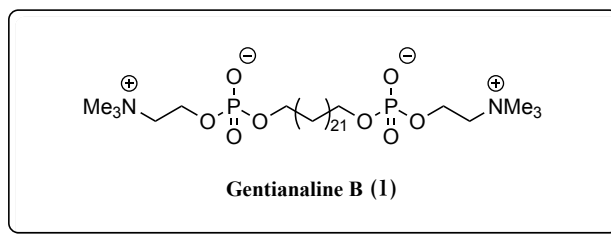
(¹*Faculty of Science, Tokyo University of Science*, ²*Chiba University*) Takatsugu Murata,¹
 Kiri Fukunishi,¹○Shunsei Hiraga,¹ Kenta Uchida,¹ Rio Seki,² Misako Ohkusu,²
 Katsuhiko Kamei,² Akira Watanabe,² Naruhiko Ishiwada,² Takayuki Tonoi,¹ Isamu Shiina¹

Gentianaline B, which bears a long fatty chain moiety and bisphosphocholine moiety, has antifungal activity. We established the method of a tricosane-1,23-diol preventing the contamination of the other symmetric 1,ω-diols. Using the method, we accomplished the first total synthesis of Gentianaline B.

Gentianaline B (**1**)は2020年にリンドウ科の植物 *Gentiana crassicaulis* より単離された天然物である¹⁾。

1 は 23 炭素の長鎖脂肪鎖とビスホスホリルコリン構造を持ち、その他の炭素数の長鎖脂肪族ビスホスホリルコリンの知見から、抗真菌活性を持つことが期待されている²⁾。今回我々は**1**の抗真菌活性の調査を目的に全合成研究に着手した。

予め調製したヨウ素化合物(**2**)とグリニャール試薬(**3**)のカップリング反応により望みの炭素骨格を構築したのち、保護基を除去することでトリコサン-1,23-ジオール(**5**)を合成した。これにより、望まない炭素数の 1,ω-ジオールが混入しない純粋な 1,ω-ジオールの調製法を確立した。その後、**5**に構造修飾を施すことで**1**の全合成を達成した。本講演では、**5**の合成法ならびにその後のホスホリルコリンへの誘導検討の詳細について報告する。



- 1) S. Ren, K. Deng, S. Qiu, M. Wang, B. Avula, S. K. Tripathi, M. R. Jacob, L. Gong, W. Wang, I. A. Khan, X.-C. Li, *J. Nat. Prod.*, **2020**, 83, 3207–3211.
- 2) Q. Lu, R. P. Ubillas, Y. Zhou, L. G. Dubenko, J. M. Dener, J. Litvak, P.-W. Phuan, M. Flores, Z. Ye, R. E. Gerber, T. Truong, D. E. Bierer, *J. Nat. Prod.*, **1999**, 62, 824–828.