

酸化環化反応による KB343 の三環性グアニジン部位の合成研究

(東農工大院工¹) ○大澤 瞳生、石塚 颯、小田木 陽、長澤和夫

Synthetic studies on tricyclic guanidine in KB343 via oxidative cyclization

(¹Graduate School of Engineering, Tokyo University of Agriculture and Technology)

○Toma Osawa¹, Hayate Ishizuka¹, Minami Odagi¹, Kazuo, Nagasawa¹

KB343 (**1**) is a tris-guanidine alkaloid isolated from a Palauan zoantharian by Sakai and co-workers in 2018. To construct the tricyclic guanidine moiety, which is a structural feature of KB343 (**1**), we firstly investigated the oxidative cyclization by utilizing a model compound **2** as a substrate, and found that the reaction proceeded with 4-chloro-diacetoxyiodobenzene (4-Cl-PIDA) to give spiroguanidine **3** in 50 % yield (Scheme 1). Then we further investigated the oxidative cyclization of bicyclic guanidine **4** with PIDA to give tricyclic guanidine **5** (Scheme 2).

Keywords : KB343; Guanidine alkaloid; Hypervalent iodine reagent; Spiroguanidine; Oxidative cyclization

【目的】 KB343 (**1**) は、2018 年に酒井らによりパラオ産スナギンチャクより単離されたトリスグアニジンアルカロイドである。本研究では、KB343 (**1**) の構造的特徴である三環性グアニジン部位の構築を目的として、超原子価ヨウ素試薬によるグアニジンを求核種とした酸化環化反応について検討を行った。

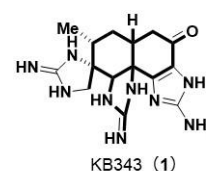
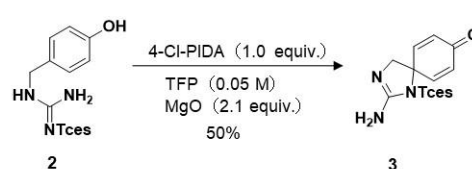
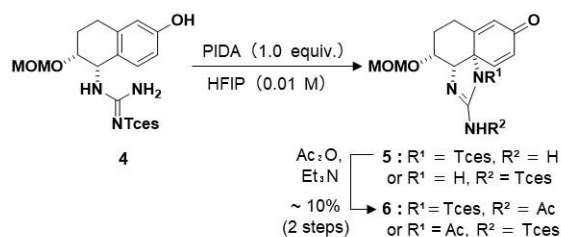


Figure KB343 (**1**) の構造

【実験・結果】 グアニジンの酸化環化反応について、モデル化合物 **2** を用いて検討を行った。その結果、**2** に対し、テトラフルオロプロパノール (TFP) 溶媒中、MgO (2.1 equiv.) 存在下、超原子価ヨウ素試薬として 4-クロロジアセトキシベンゼン (4-Cl-PIDA, 1.0 equiv.) を作用させたところ、スピログアニジン **3** が収率 50%で得られることを見出した (Scheme 1)²⁾。さらに二環性のグアニジン **4** に対し、同様の酸化環化反応を検討したところ、三環性グアニジン **5** が得られることを見出した (Scheme 2)。



Scheme 1 スピログアニジン **3** の合成



Scheme 2 三環性グアニジン **5** の合成

【参考文献】 1) R. Sakai, *et al.*, *Org. Lett.* **2018**, *20*, 3039; 2) K. Nagasawa, *et al.*, *Asian. J. Org. Chem.* **2020**, *9*, 218.