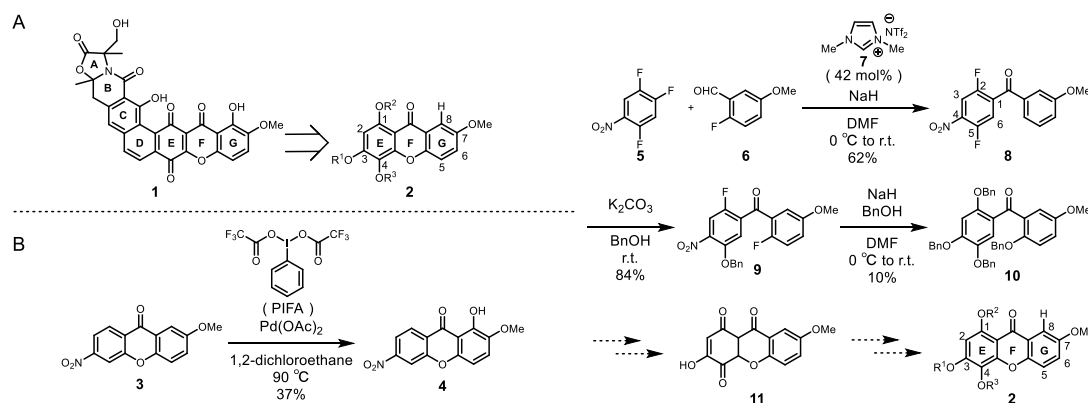


Citreamicin δ の EFG 環前駆体の合成研究(上智大学¹) ○室井 麻緒¹・小澤 洸太¹・鈴木 由美子¹Synthetic Study of an EFG-ring Precursor of Citreamicin δ (¹Sophia University) ○Maoto Muroi,¹ Kota Ozawa,¹ Yumiko Suzuki,¹

Citreamicin δ is a natural product that possesses antibacterial activities. As a part of the total synthesis, the core skeleton of the EFG ring containing the tricyclic quinone was planned to be constructed via a xanthone intermediate derived from a benzophenone derivative. The reaction conditions for the introduction of the hydroxy group at position 8 of the xanthone intermediate **2** was examined using the model compound **3**. When **3** was reacted with PIFA in 1,2-dichloroethane at 90 °C in the presence of 20 mol% palladium acetate, the hydroxy group was regioselectively introduced through the directing effect of the carbonyl group of the substrate. The synthesis of the EFG ring precursor **2** commenced with the preparation of benzophenone intermediate **8** by NHC-catalyzed arylation followed by other transformations and functionalizations.

Keywords : Xanthone; Synthesis of Natural Product; NHC-Catalyzed Arylation

抗菌活性天然物である citreamicin δ ¹⁾ (**1**) の EFG 環前駆体 **2** の合成研究を行った (Scheme 1A)。ベゾフェノン中間体からキサントン骨格を構築し、その後 EFG 環の基本骨格である 3 環系キノン型構造へと変換することとした。キサントン中間体 **2** の 8 位にヒドロキシ基を導入する反応について、モデル基質 **3** を用いて検討した (Scheme 1B)。1,2-ジクロロエタン溶媒中、20 mol% の酢酸パラジウム存在下で PIFA と 90 °C で反応させる²⁾ とカルボニル基を配向基としたヒドロキシ基導入に成功し、**4** を得た。合成中間体 **2** の合成では NHC 触媒を用いた求核的アロイル化反応を用いてベンゾフェノン中間体 **8** を合成し、その後位置選択的 S_NAr 反応などを経て **10** を合成した (Scheme 2)。現在、**10** から **2** への合成を検討している。



- 1) D. C. Hopp, D. J. Milanowski, J. Rhea, D. Jacobsen, J. Rabenstein, C. Smith, K. Romari, M. Clarke, L. Francis, M. Irigoyen, M. Luche, G. J. Carr, U. Mocek, *J. Nat. Prod.* **2008**, *71*, 2032-2035.
- 2) G. Dong, M. Fanyang, J. T. Louis, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2012**, *51*, 13075-13079.