

## ガラギン酸誘導体を鍵中間体とするポリフェノール性天然物の合成

(富大院工) ○勘坂 悠太・加藤 由泰・阿部 仁

Gallagic Acid Derivatives as Key Intermediates to Synthesize Polyphenolic Natural Products  
(Faculty of Engineering, University of Toyama) ○Yuta Kanzaka, Yoshiyasu Kato, Hitoshi, Abe

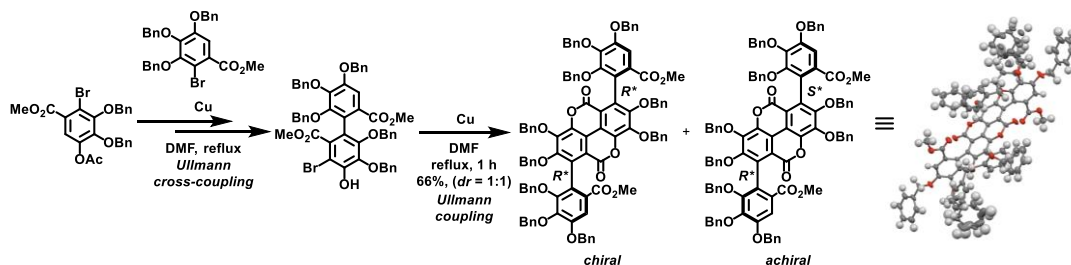
The natural products, punicalin and punicalagin, exhibit various biological activities such as antioxidant and antifungal effects, thus they are attracting attention as pharmaceutical resources. The gallagyl unit, which consists of four aromatic rings, could be constructed by coupling reactions, and we have achieved the synthesis of gallagic acid derivatives from methyl gallate.

To obtain the gallagic acid derivatives, two types of gallic acid derivatives were first converted into a biaryl compound by Ullmann cross-coupling. After functional group transformations, the obtained biaryl compound was further converted into gallagic acid derivatives by Ullmann coupling reaction and concomitant lactonization. The product was generated as a mixture of diastereomers. Subsequently, a chiral gallagic acid derivative with the desired (*S,S*) axis is going to be synthesized with the aid of a chiral template obtained from L-tartaric acid.

**Keywords :** Punicalin; Punicalagin; Gallagic acid; Ullmann coupling

ポリフェノール性天然物であるプニカリンとプニカラジンは多様な生理活性を示し、医薬品資源として注目されている<sup>1)</sup>。本研究では、これらが有する 4 つのベンゼン環が連なったガラギルユニットを Ullmann カップリングによって構築できると考え、ガラギン酸誘導体の合成を行った。

ガラギン酸誘導体を得るために、2 種類の没食子酸誘導体を Ullmann クロスカップリングによってビアリール体へと変換した。得られたビアリール体は官能基変換された後、ラクトン化を伴った Ullmann カップリングによってガラギン酸誘導体をジアステレオマー比 1:1 の混合物で合成した。アキラルなガラギン酸誘導体の構造決定は単結晶 X 線構造解析により行った。また、目的の (*S,S*) 配置の軸不斉を有するキラルなガラギン酸誘導体の不斉合成では、L-酒石酸から得られるキラルテンプレートを利用した合成を検討した。



- 1) Lin, C. C.; Hsu, Y. F.; Lin, T. C.; Hsu, F. L.; Hsu, H. Y. *J. Pharm. Pharmacol.* **1998**, *50*, 789-794.