

## ネオダイシハーベイン A の合成を指向した $\alpha$ -アミノ酸側鎖の構築法の研究

(青山学院大学理工<sup>1</sup>) ○湊 翔一<sup>1</sup>、五味田 翔太<sup>1</sup>、佐々木 郁雄<sup>1</sup>、杉村 秀幸<sup>1</sup>

Studies on construction of the  $\alpha$ -amino acid side chain towards the synthesis of

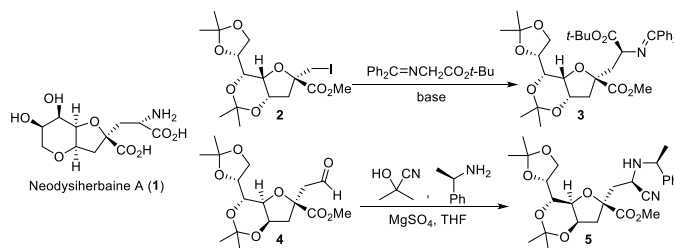
Neodysisierbaine A (<sup>1</sup>College of Science and Engineering, Aoyama Gakuin University)

○Shoichi Minato,<sup>1</sup> Shota Gomita,<sup>1</sup> Ikuo Sasaki,<sup>1</sup> Hideyuki Sugimura<sup>1</sup>

Neodysisierbaine A(**1**) was isolated from the Micronesian sponge *Dysidea herbacea*, which exhibits selective agonistic activity on glutamate receptors in the central nervous system. Its structural features include a cis-fused furofuran ring containing six chiral centers and a glutamic acid substructure. These chemical structures and pharmacological features make it an attractive natural product. Although the furofuran moiety has been successfully synthesized in a stereoselective manner using the [3+2] annulation reaction of *aldehydo*-D-ribose derivative with 2-substituted allylsilane in the presence of  $\text{BF}_3 \cdot \text{OEt}_2$  in our laboratory<sup>1)</sup>, the introduction of the glutamate side chain has not been achieved. In this study, stereoselective construction of the glutamate side chain was examined using model compounds **2** and **4** by two approaches; alkylation of *N*-(diphenylmethylene) glycine ester in the presence of asymmetric catalyst, and asymmetric Strecker reaction using chiral amines.

**Keywords** : Neodysisierbaine A; Strecker reaction; *N*-(diphenylmethylene) glycine ester; glutamate side chain

ネオダイシハーベイン A(**1**)はミクロネシア産海綿 *Dysidea herbacea* から単離され、中枢神経系のグルタミン酸受容体に選択的な作動活性を示す。その構造的特徴として、6つの不斉中心を含むシス縮環型フロピラン環にグルタミン酸の部分構造を有している。これらの化学構造と薬理学的特徴により、魅力的な天然物である。当研究室では三フッ化ホウ素存在下におけるアルデヒド-D-リボース誘導体と 2-置換アリルシランの[3+2]環化反応を用いて立体選択的にフロピラン環部の合成に成功しているが<sup>1)</sup>、グルタミン側鎖の導入に関しては未達成である。本研究では、モデル化合物 **2**、**4** を用いて不斉触媒存在下における *N*-(ジフェニルメチレン)グリシンエステルのアルキル化反応やキラルアミンを用いた不斉 Strecker 反応による立体選択的なグルタミン側鎖の構築を目指した。



1) 保戸田, 野崎, 浅井, 佐々木, 杉村, 日本化学会第 98 春季年会・講演番号 4D1-39