

アセチレンスピロアセタールエノールエーテル化合物群の合成研究

著者	宮腰 直樹
著者別表示	Miyakoshi Naoki
雑誌名	平成16(2004)年度 科学研究費補助金 若手研究(B) 研究概要
巻	2003 2004
ページ	1p.
発行年	2016-04-21
URL	http://doi.org/10.24517/00061121

[◀ Back to previous page](#)

アセチレンスピロアセタールエノールエーテル化合物群の合成研究

Research Project

Project/Area Number	15790007
Research Category	Grant-in-Aid for Young Scientists (B)
Allocation Type	Single-year Grants
Research Field	Chemical pharmacy
Research Institution	Kanazawa University
Principal Investigator	宮腰 直樹 金沢大学, 自然科学研究科, 助手 (00345597)
Project Period (FY)	2003 - 2004
Project Status	Completed (Fiscal Year 2004)
Budget Amount *help	¥3,000,000 (Direct Cost: ¥3,000,000) Fiscal Year 2004: ¥1,400,000 (Direct Cost: ¥1,400,000) Fiscal Year 2003: ¥1,600,000 (Direct Cost: ¥1,600,000)

All ▾

Keywords ジオキサスピロ骨格 / 共役エンジイン構造 / PD(II)触媒 / 酒石酸 / 抗腫瘍活性 / Pd(II)触媒**Research Abstract**

キク科植物は民間薬として古くより活用されてきた植物である。同植物から生理活性成分が数多く報告されているが、中でもスピロアセタール構造、エノールエーテル構造及び(E)-エンジイン構造を有する一連の化合物群は、僅かな構造の差異により脳、消炎、鎮癌作用から抗腫瘍活性と、幅広い生理作用を有することが知られている。しかしながら、これら化合物は天然から得られる量が僅かなため、十分な活性評価がなされていない。研究者は、これら天然物の化学合成による大量供給を目的として本研究を遂行し以下の結果を得た。

一連の化合物群の合成を行うにあたり、まず抗腫瘍活性を有し、スピロアセタール構造上にエボキシ環を有するAL-2を初期標的化合物に設定し、効率的合成法の開発を検討した。AL-2のエボキシ部分が酒石酸由来の二つの水酸基から誘導可能であることに着目し、市販品として容易に入手可能なL-酒石酸ジエチルを出発物質として、数工程で環化反応前駆体である三重結合を有するδケトアルコール体を合成した。環化反応前駆体をMeOH中、CO気流下、触媒量のPd₂(dba)₃と処理したところ、スピロ環構築とメチルエステル部の形成が進行し、ジオキサスピロ化合物の合成に成功した。続いて、メチルエステル部をジイン体へと誘導し、L-酒石酸由来の水酸基をエボキシ構造へ変換し、AL-2の最初の全合成を達成した。加えて、開発した合成経路を基盤とし、4種の類縁化合物の合成も達成した。

Report (2 results)

2004 Annual Research Report

2003 Annual Research Report

Research Products (1 results)

All Other

All Publications

[Publications] 宮腰 直樹: "First Total Synthesis of (-)-AL-2"Organic Letters. 5. 2335 (2003) ▾

URL: <https://kaken.nii.ac.jp/grant/KAKENHI-PROJECT-15790007/>

Published: 2003-03-31 Modified: 2016-04-21