

## Protoaculeine B の合成研究 (1) 提唱構造の全合成

(<sup>1</sup>横浜市大院生命ナノ、<sup>2</sup>北大院水)

○入江 樂<sup>1</sup>、宮原 正義<sup>1</sup>、酒井 隆一<sup>2</sup>、及川 雅人<sup>1</sup>

Aculeine B (ACU-B) は西表島産のカイメン *Axinyssa aculeata* から単離された 45 アミノ酸残基からなる細胞毒性ペプチドである。ACU-B は、その N 末端に protoaculeine B (pACU-B) と命名された、1,3-propanediamine の 12-15 量体ポリマーが tryptophan 由来のヘテロ三環性骨格に縮合したユニークな構造を含んでいる<sup>1</sup>。

当研究室では ACU-B の活性発現に重要なモチーフであると考えられる pACU-B の合成研究に取り組んでおり、これまでに完全保護体 **1** (12 量体、図 1) の合成を第 76 回の本会にて報告している<sup>2</sup>。その後 **1** を順次脱保護していくに際し、生成物の不安定性とポリカチオン性に由来する取り扱い上の問題が生じることが判明したが、今回これを解決し提唱構造 **4** の全合成を達成することができた<sup>3,4</sup>。しかしながら、**4** の各種 NMR、MS/MS スペクトルは天然物のものと一致しなかった<sup>4</sup>。類縁体 (3 量体) およびジアステレオマーの合成とあわせ、得られた結果を報告する。

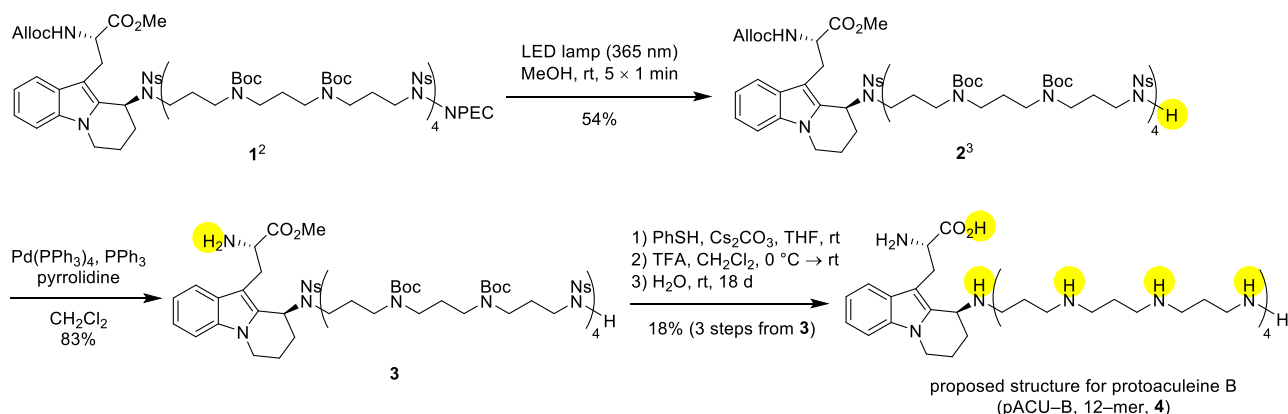


図 1. pACU-B の提唱構造の全合成

- [1] S. Matsunaga, R. Kishi, K. Otsuka, M. Fujita, M. Oikawa, R. Sakai, *Org. Lett.* **2014**, *16*, 3090–3093.
- [2] (a) 宮原正義、塩崎宏樹、石川裕一、入江 樂、及川雅人、protoaculeine B の合成研究、第 76 回 有機合成化学協会関東支部シンポジウム、長岡、2018 年 12 月  
(b) H. Shiozaki, M. Miyahara, K. Otsuka, K. Miyako, A. Honda, Y. Takasaki, S. Takamizawa, H. Tukada, Y. Ishikawa, R. Sakai, M. Oikawa, *Org. Lett.* **2018**, *20*, 3403–3407.
- [3] M. Miyahara, H. Shiozaki, H. Tukada, Y. Ishikawa, M. Oikawa, *Tetrahedron Lett.* **2018**, *59*, 4197–4278.
- [4] R. Irie, M. Miyahara, S. Nakamura, A. Honda, R. Sakai and M. Oikawa, *J. Nat. Prod.* **2020**, *83*, 2769–2775.