

Desprenyl-carquinostatin A および descycloavandulyl-lavanduquinocin の リパーゼ触媒による不斉合成に関する研究

町支臣成、内田佳成、久保田幸子、延廣順子、
竹下光弘*、秦野琢之**、日比野俐

Chemical Pharmaceutical Bulletin, **55** (7), 1060-1064 (2007).

Lipase-catalyzed Asymmetric Synthesis of Desprenyl-carquinostatin A and Descycloavandulyl-lavanduquinocin

Tominari Choshi, Yoshinari Uchida, Yukiko Kubota, Junko Nobuhiro,
Mitsuhiro Takeshita*, Takushi Hatano**, and Satoshi Hibino

ABSTRACT: A synthesis of the functionalized core carbazole, (*R*)-(-)-6-desprenyl-carquinostatin A [(*R*)-(-)-6-descycloavandulyl-lavanduquinocin] together with its enantiomer (*S*)-(+)-6-desprenyl-carquinostatin [(*S*)-(+)-6-descycloavandulyl-lavanduquinocin] have been completed by the Lipase-catalyzed enantioselective esterification, followed by the determination of the absolute stereochemistry based on the advanced Mosher method. Finally, (-)-ester was converted into the 3,4-quinone, and then hydrolysis of ester provided the title compound.

抄録 神経細胞保護作用を有する carquinostatin A (*Streptomyces exfoliates* 2419-SVT2) および lavanduquinocin (*Streptomyces viridochromogenes*) は、6位の置換基を除けば共通のコア構造となる。前駆体 3-ethoxy-2-methyl-1-(trifluoromethylsulfonyloxy)carbazole の合成はアレン中間体を組み込んだ電子環状反応で行い、カルバゾールの1位に2工程で acetyl基を導入後、ラセミの alcohol 体として Lipase QLM によるエナンチオ選択的エステル化を行った。(-)-ester を (-)-alcohol へ導き、(+)-alcohol はそのまま 2-methoxy-2-(1-naphthyl)propionic acid を利用の改良 Mosher 法により絶対配置を、それぞれ *R*-(-)-alcohol とおよび *S*-(+)-alcohol と決定できた。最後に *R*-(-)-ester から2工程でコア構造の 6-desprenyl-carquinostatin A および 6-descycloavandulyl-lavanduquinocin の不斉合成を達成できた。

* Tohoku Pharmaceutical University

東北薬科大学

** Faculty of life Science and Biotechnology, Fukuyama University

福山大学生命工学部生物工学科