

## キラルリン酸触媒による不斉アリル化反応を用いた Bastimolide A の合成研究

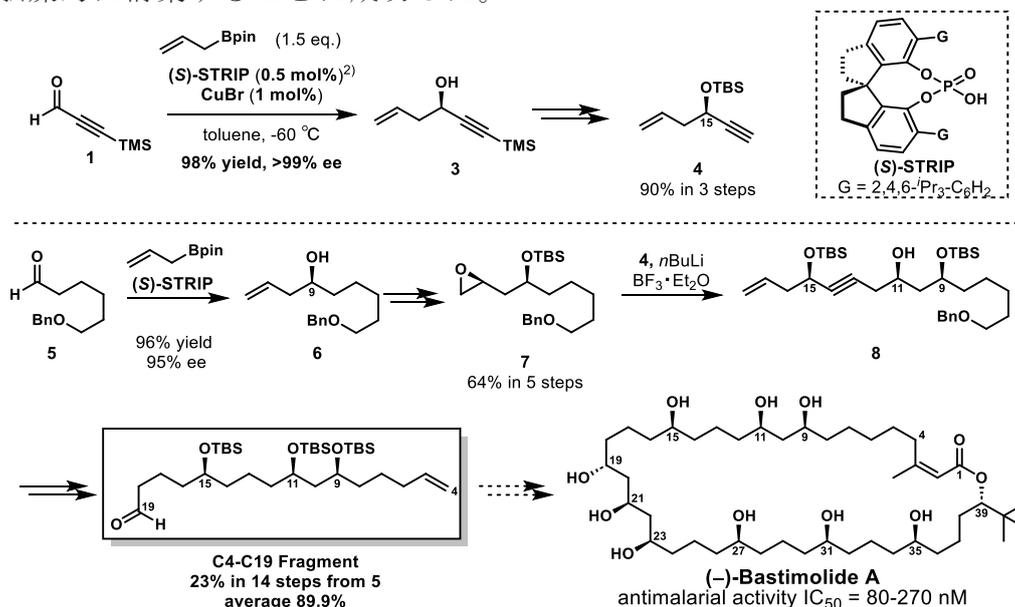
(東北大院理) ○品川尚弥・梅宮茂伸・寺田眞浩

Synthetic Study of Bastimolide A Using Chiral Phosphoric Acid Catalyzed Asymmetric Allylation (*Graduate School of Science, Tohoku University*) ○Naoya Shinagawa, Shigenobu Umemiya, Masahiro Terada

Bastimolide A is a 40-membered polyhydroxy macrolide possessing potent antimalarial activity.<sup>1)</sup> We established an efficient synthetic route toward the key C4-C19 fragment of bastimolide A in a total of 23% yield with a longest liner sequence of 14 steps from simple starting materials. The key steps in the present synthesis are the enantioselective allylation reaction by chiral phosphoric acid/transition metal cooperative catalysis,<sup>2)</sup> and the epoxide opening reaction by enantioenriched alkyne **4**. Our synthetic route can efficiently afford a 1, 3, 7-*syn* triol structure in highly stereoselective and catalytic manner.

**Keywords** : Organocatalyst, Chiral Phosphoric Acid, Total Synthesis, Macrolide

Bastimolide A は 2015 年に Gerwick らによって単離・構造決定された強力な抗マラリア活性を有する 40 員環ポリヒドロキシマクロリドである<sup>1)</sup>。我々は、特徴的なポリオール構造を有する本化合物並びにその類縁体を網羅的に合成可能な合成戦略の確立を目指し研究を行った。その結果、キラルリン酸/遷移金属共触媒を用いた不斉アリル化<sup>2)</sup>を鍵反応として用いることで、Bastimolide A の C4-C19 フラグメントを 14 工程、総収率 23% で合成することに成功した。本合成ルートでは、キラルリン酸触媒を用いた不斉アリル化によって得られる末端アルキン **4** とエポキシド **7** を連結することで 1, 3, 7-*syn* トリオール構造を触媒的に構築することに成功した。



1) W. H. Gerwick *et al.*, *J. Org. Chem.* **2015**, *80*, 7849. For the total synthesis of bastimolide A, see: A. B. Smith *et al.*, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2022**, *61*, e202204884.

2) S. Umemiya and M. Terada, *Org. Lett.* **2021**, *23*, 3767.