

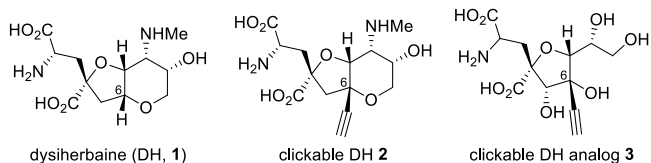
# Synthetic Study of Clickable Dysiherbaine

(Grad. Sch. NanoBioSci., Yokohama City Univ.)

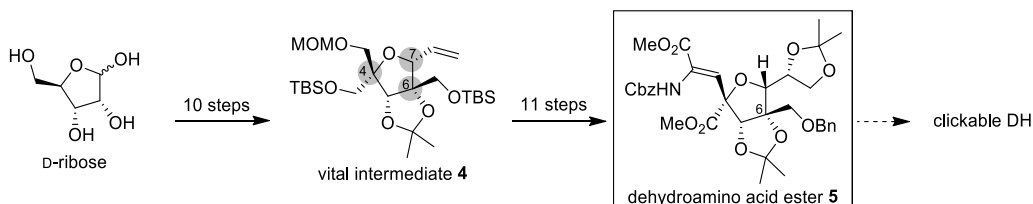
○FUKUSHIMA Koichi; OIKAWA Masato

**Keywords:** chemical probes; ionotropic glutamate receptors (iGluRs); dysiherbaine

**Abstract:** Ionotropic glutamate receptors (iGluRs) play an important role in excitatory neurotransmission in the central nervous system. In this study,



we planned to synthesize clickable DH **2** (Fig. 1) which has ethynyl group at the C6 position of dysiherbaine (DH, **1**, a potent agonist selective to GluK1 and GluK2) as a precursor for the chemical probe to investigate iGluRs' pharmacological functions. Herein we report stereoselective synthesis of the vital intermediate **4**, which has four stereocenters, performed in 10 steps starting from D-ribose (Scheme 1). Furthermore, we have successfully synthesized dehydroamino acid ester **5** as a precursor to analog **3**.



Scheme 1

## クリックブル ダイシハーベインの合成研究

(横浜市大院生命ナノ) ○福島 孝一・及川 雅人

神経細胞のシナプスに存在するイオンチャネル型グルタミン酸受容体 (iGluRs) は、哺乳類の神経伝達に関わる重要な役割を担っている。本研究では、iGluRs の機能を調べるためにケミカルプローブを作成することを考え、その前駆体となるクリックブル ダイシハーベイン **2** (Fig. 1) の合成を目的としている。現在までに、出発原料 D-リボースから 10 段階で 4 つの不斉炭素を制御した重要中間体 **4** の合成に成功した。そして、特徴的な二環性骨格の構築の検討と必要な官能基の導入を試みたのでそれらについて報告する。