

Synthetic studies of protoaculeine B

(Graduate School of Nanobioscience, Yokohama City Univ) ○SUGAHARA, Hajime;
OIKAWA, Masato

Keywords: tryptophane; aculeine; protoaculeine; aza-Michael reaction; polyamine

Abstract: Protoaculeine B (**1**, pACU-B, Figure 1) is the *N*-terminal fragment amino acid of aculeine B, a cytotoxic peptide isolated from marine sponge *Axinyssa aculeata* collected at Iriomote, Okinawa, Japan. We have started our synthetic studies

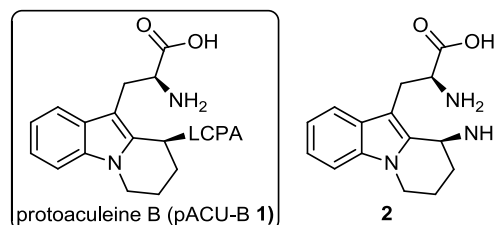


Figure 1

of pACU-B to establish the novel structure and to implement evaluation of the biological activity. Herein, we report 13 steps-synthesis of tryptophane-derived heterocyclic moiety of pACU-B and our successful effort toward introduction of polyamine.

プロトアーキュレイン B の合成研究

(横浜市大院生命ナノ) ○菅原 啓・及川 雅人

沖縄県八重山群西表島に棲息する海綿 *Axinyssa aculeata* には細胞毒性を有するペプチドが含まれており、aculeine B と命名された。最近になり、aculeine B の *N* 末端アミノ酸として protoaculeine B (**1**, pACU-B, Figure 1) が単離された。pACU-B は、L-tryptophane 由来と考えられるインドール骨格に対し、ピペリジン環が結合した三環性骨格を有し、さらにそのピペリジン環にポリアミンが縮合した構造を特徴としていることが化学分解及び NMR や HRMS などのスペクトル解析により解明された。我々は、pACU-B の生物活性評価の実施を目的として合成研究を開始した。これまでに、L-tryptophane を出発原料として三環性アミノ酸 **2** の合成を 13 段階で達成しているが、今回、ポリアミン鎖の導入法をモデル実験にて確立することに成功した。現在は、pACU-B の合成に向け検討を進めており、得られた結果を報告する。