

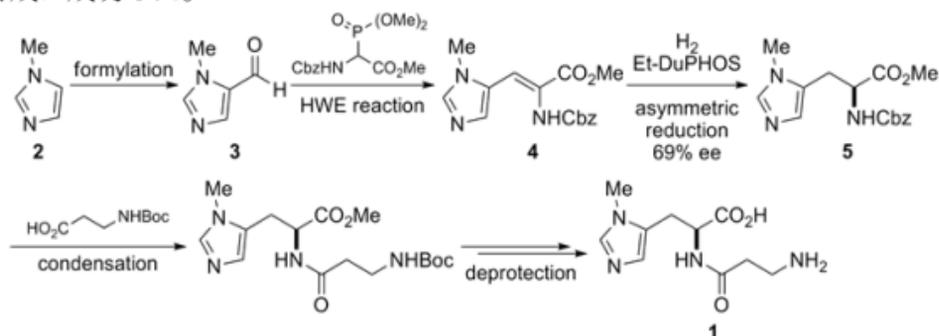
27P-am161

(+)-Anserine の合成研究

○清水 啓太¹, 小泉 靖明¹, 脇本 敏幸¹, 古田 巧², 菅 敏幸¹ (¹静岡県大薬,
²京大化研)

【目的】アンセリン (**1**) は、回遊性大型魚類 (カツオ、マグロなど) に多く含まれている化合物であり、タウリンの 10 倍以上の抗疲労効果を有することが知られている。**1** は 1-メチルヒスチジンとβアラニンからなるジペプチドであり、イミダゾール環のより立体障害の大きい窒素原子がメチル化されている点が特徴的である。近年、**1** は健康食品としても注目されており、我々はβアラニン残基を修飾した誘導体合成を視野に入れた効率的合成法の確立を試みた。

【方法・結果】メチルイミダゾール (**2**) を出発物質として、5 位選択的にホルミル化することによりアルデヒド (**3**) を合成した。**3** を容易に合成可能な HWE 試薬と反応させることによりデヒドロアミノ酸 (**4**) へ導いた。**4** から鍵中間体である 1-メチルヒスチジン誘導体 (**5**) への変換は M.J.Burk らの Et-DuPHOS¹⁾ を用い、酢酸存在下不斉水素化することにより達成した。Boc-βアラニンを縮合させた後、脱保護を行うことで **1** の全合成に成功した。



1) M. J. Burk, *et al. J. Am. Chem. Soc.* **1993**, *115*, 10125-10138