

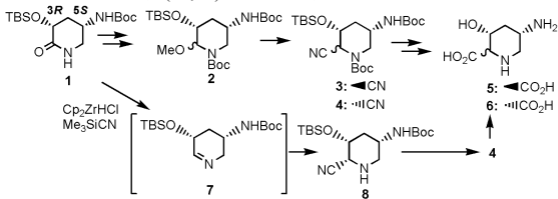
27P-am165

新規な3-ヒドロキシピペコリン酸誘導体の合成研究

○田中 憲一¹, 堀江 聡¹, 荒川 靖¹(¹北陸大薬)

【目的】3-ヒドロキシピペコリン酸は、多くの生物活性天然物に見られる重要骨格であり、配座固定型のセリン誘導体とも見なされる。また、近年、医薬品のリード化合物として高い注目を集めている。今回、我々は環上にアミノ基を有する新規な3-ヒドロキシピペコリン酸誘導体(5,6)の合成を検討した。

【実験・結果】3,5-ジ置換ラクタム体(1)¹を出発原料とし、Boc化、Super-H還元、引き続きメチル化を行い、2を得た。2はルイス酸(SnCl₄, BF₃・OEt₂)、TMSCNを用いた *N*-acyliminium ion 経由での検討を行い、低収率(40-50%)ながら2-シアノ体(3,4)を得た。一方、1に対し Schwartz's 試薬を用いシアノ化(Cp₂ZrHCl, TMSCN, THF, -20°C)を行ったところ、2,3-*cis*体(8)のみが収率65%で得られた。2-シアノ体(3,4及び8)は、各々、酸加水分解を行い目的とする5,6を得ることが出来た。現在、(3*R*,5*R*)-1を用いて、同様の反応を検討している。



1) *Tetrahedron: Asymmetry*, 2005, 16, 809-815.