

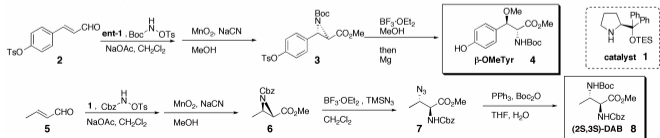
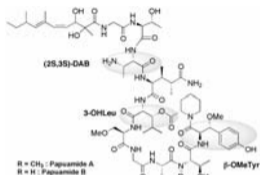
29P-am003

不斉アジリジン化を利用した異常アミノ酸の合成

○濱嶋 祥就¹, 牛尾 絵理子¹, 佐々木 ネリ¹, 濱田 康正¹(¹千葉大院薬)

【目的】我々は、プロリン型有機触媒 **1** を用いた不斉アジリジン化反応が開発に成功した。¹⁾ その応用のために天然生理活性環状デプシペプチドに含まれる異常アミノ酸を、アジリジンの開環を利用して合成する事を計画した。その標的として、抗HIV活性環状デプシペプチド、Papuaamideに含まれる異常アミノ酸の効率的な合成を目指した。

【方法と結果】既知のシナムアルデヒド誘導体 **2** に対し不斉アジリジン化を行い、二酸化マンガン-シアン化ナトリウムの条件で酸化することでメチルエステル **3** を得た。続いて、メタノール中、触媒用のBF₃·OEt₂を作用させることでアジリジンを開環し、β-メトキシチロシン(b-OMeTyr) **4** を得た。同様に不斉アジリジン化、酸化によって得たアジリジン **6** に対し、トリメチルシリルアジド存在下BF₃·OEt₂を作用させることで、アジリジンを位置及び立体選択的に開環しアジドを導入した。アジド **7** を還元することで(2S,3S)-ジアミノブタン酸((2S,3S)-DAB) **8** を合成した。



1) Arai, H.; Sugaya, N.; Sasaki, N.; Makino, K.; Lectard, S.; Hamada, Y. *Tetrahedron Lett.* **2009**, *50*, 3329-3332.