

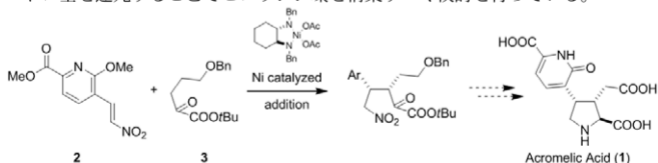
# 31P-0003

アクロメリン酸の合成研究

○大内 仁志<sup>1</sup>, 浅川 倫宏<sup>1</sup>, 袖岡 幹子<sup>2</sup>, 濱島 義隆<sup>1</sup>, 菅 敏幸<sup>1</sup> (<sup>1</sup>静岡県大葉,  
<sup>2</sup>理研)

【目的】アクロメリン酸 (**1**) はドクササコより単離されたアミノ酸誘導体であり、グルタメート受容体 (GluR) に対する強力なアゴニストとして知られている。興奮性の GluR は記憶、学習、痛みの伝達に関わるといわれており、そのサブタイプ選択的作用薬は医薬に直結する。しかし **1** のサブタイプ選択性は未解明であり、その機能解明のため **1** 及びその類縁体の化学合成による安定供給が求められている。

【方法および結果】Ni 触媒を用いたニトロオレフィンと  $\alpha$ -ケトエステルとの共付加反応は高い官能基耐性を示し、高立体選択的に進行することを既に見出している<sup>a)</sup>。そこで本研究では、上記不斉触媒反応を鍵工程とする **1** の効率的全合成を検討することとした。文献既知のピリジン誘導体から効率良く合成したニトロオレフィン **2** と  $\alpha$ -ケトエステル **3** との反応を、Ni 触媒存在下、DME 中で行ったところ、反応は良好に進行し、90% ee にて目的の付加体を得ることに成功した。現在、ニトロ基を還元することでピロリジン環を構築すべく検討を行っている。



a) Y. Hamashima and M. Sodeoka *et al.*, *J. Am. Chem. Soc.* **2010**, *132*, 4036-4037.