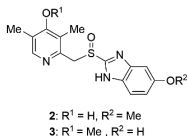
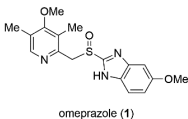


27PA-am002S

メトキシ基の位置選択的脱保護によるオメプラゾール代謝物の合成
○長谷川 結美¹, 牧野 宏章¹, 田畑 英嗣¹, 忍足 鉄太¹, 夏刈 英昭¹, 伊藤 清美²,
高橋 秀依¹ (¹帝京大薬, ²武蔵野大薬)

【目的】強力な胃酸分泌抑制作用を有する Omeprazole (**1**) の代謝研究の一環として、**1** の代謝物である脱メチル誘導体 **2** 及び **3** を合成することを目的とし、新たな位置選択的脱メチル化反応を検討した。



【方法・結果】スルフィド体 **4** を用いて MeO 基の脱保護を試みた。CH₂Cl₂ 中 BBr₃ を用い、6 位の MeO 基が脱保護された **5** のみを収率 79% で得た。一方、THF 中 *L*-selectride、reflux 条件下で反応を行い、pyridine 上の 4' 位の MeO 基のみが脱保護された **6** を収率 94% で得た。これらの位置選択的反応を利用して脱メチル誘導体 **2** 及び **3** を効率よく合成することができた。さらに、この位置選択的脱メチル化反応の一般性について検討したので併せて報告する。

