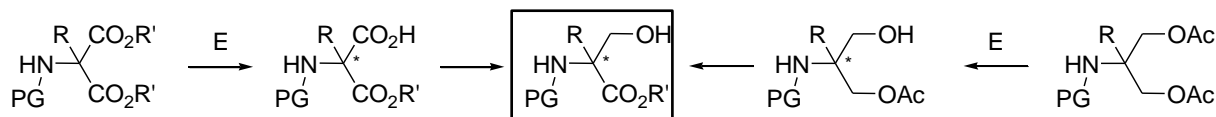


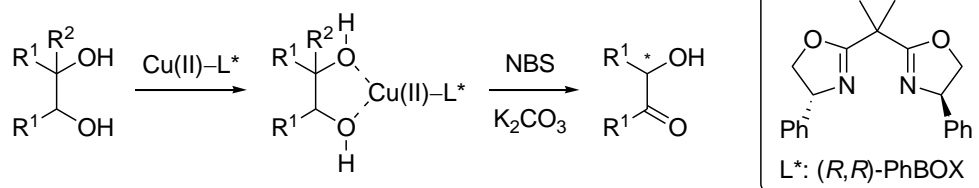
臭素カチオン源を酸化剤とする α -置換セリン類の触媒的不斉合成 Catalytic asymmetric synthesis of α -substituted serines by oxidation using bromonium ion source

大山 達也、栗山 正巳、尾野村 治 (長崎大院医歯薬)

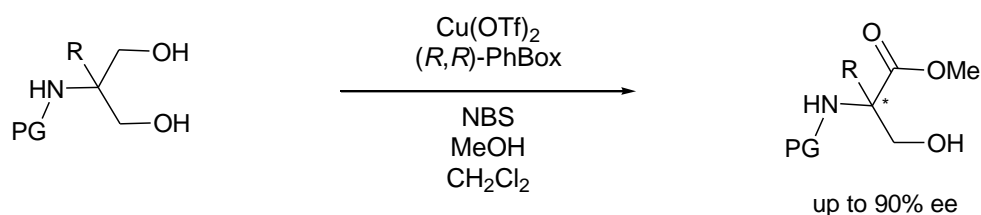
非天然アミノ酸である α -置換セリン類は様々な生理活性物質の骨格に含まれるが、効率的な合成法は確立されていない。これまではジエステル類の酵素的加水分解を用いる不斉非対称化を鍵反応として多工程で合成されている。



一方、当研究室では 1,2-ジオールの水酸基がキラル銅触媒とキレート錯体を形成することによって活性化し、その活性化された水酸基を臭素カチオンによって不斉酸化する反応の開発に成功しており¹、今回我々はこの手法を 2-アミノ-1,3-プロパンジオールに適用することにより簡便に光学活性セリン類合成が達成できるのではないかと考え研究を開始した。



初期検討の結果、予想通り反応は進行し、中程度の収率、選択性で目的となる α -置換セリン類のメチルエステル体を得られることがわかった。さらに、反応条件を種々検討したところ良好な収率及び選択性で目的物を得ることに成功した。本発表では反応条件最適化及び基質適応性の詳細について報告する。



<参考文献>

1) Onomura, O.; Arimoto, H.; Matsumura, Y.; Demizu, Y. *Tetrahedron Lett.* **2007**, *48*, 8668–8672.

発表者紹介

氏名 大山 達也 (おおやま たつや)
所属 長崎大学大学院医歯薬学総合研究科
学年 博士前期課程 2 年
研究室 医薬品合成化学研究室 (尾野村研)

