

9-ボラビシクロ[3.3.1]ノナン (9-BBN) を保護基として用いる 非天然 α -アミノ酸簡便合成法の開発

(東医歯大生材研) ○山中 大輔・丹羽 節・田口 純平・細谷 孝充

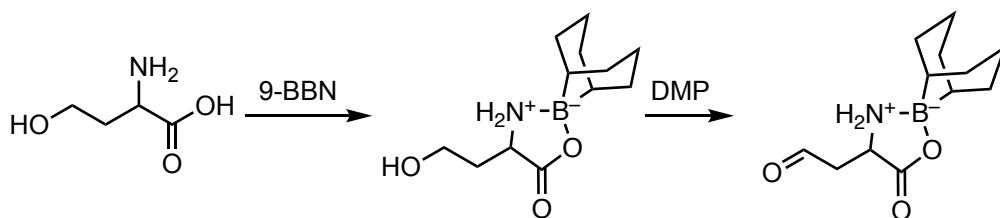
Development of a facile synthetic method for unnatural α -amino acids using 9-borabicyclo[3.3.1]nonane (9-BBN) protection. (*IBB, Tokyo Med. & Dent. Univ.*)

○Daisuke Yamanaka, Takashi Niwa, Jumpei Taguchi, Takamistu Hosoya

Non-natural α -amino acids with functional moieties are often used to elucidate the function and dynamics of amino acids and proteins. Their conventional synthetic methods require a multi-step process including protection and deprotection. In this study, we focused on a simultaneous protecting method of amino and carboxy groups using 9-borabicyclo[3.3.1]nonane (9-BBN), and utilize it for developing synthetic methods for functionalized unnatural amino acids under mild conditions. As a result, we found that protection of DL-homoserine with 9-BBN followed by oxidation of the hydroxyl group using Dess–Martin periodinane efficiently afforded protected formylalanine. We also examined its further derivatization via the transformation of the formyl group.

Keywords : *Unnatural amino acids; 9-Borabicyclo[3.3.1]nonane; Protection*

アミノ酸やその重合体であるペプチドおよびタンパク質は、生命機能を司る重要な生体分子の一つであり、それらの機能や動態を明らかにするため、アミノ酸に機能性部位を導入した非天然アミノ酸が生命科学研究においてよく利用される。これまでに様々な機能性部位を有する非天然アミノ酸が開発されてきたが、従来の合成法では、アミノ基とカルボキシ基のそれぞれの保護、脱保護を含む多段階の工程が必要である。今回我々は、9-ボラビシクロ[3.3.1]ノナン (9-BBN) を用いてアミノ基とカルボキシ基を一挙に保護、脱保護できる手法¹⁾に着目し、側鎖に分子連結可能な官能基を導入した非天然アミノ酸の短工程かつ穏和な条件での合成法の開発に取り組んだ。具体的には、DL-ホモセリンのアミノ基とカルボキシ基をそれぞれ 9-BBN で保護した後、Dess–Martin ペルヨージナンを用いてヒドロキシ基を酸化することで、側鎖にホルミル基を持つアミノ酸 9-BBN 保護体が効率よく得られることを見いだした。さらに、生じたホルミル基の変換に基づく側鎖部での誘導体化を検討した。



1) W. H. Dent III, W. R. Erickson, S. C. Fields, M. H. Parker, E. G. Tromiczak, *Org. Lett.* **2002**, 4, 1249.