



## 新規医薬品開発に重要な非天然型 $\alpha$ -アミノ酸の新規合成法を開発！

九州大学大学院薬学研究院の大嶋孝志教授と矢崎亮助教らの研究グループは、ペプチド（タンパク質）の構成成分として、医薬品中に広く用いられている重要な化合物である  $\alpha$ -アミノ酸の新たな合成法の開発に成功しました。

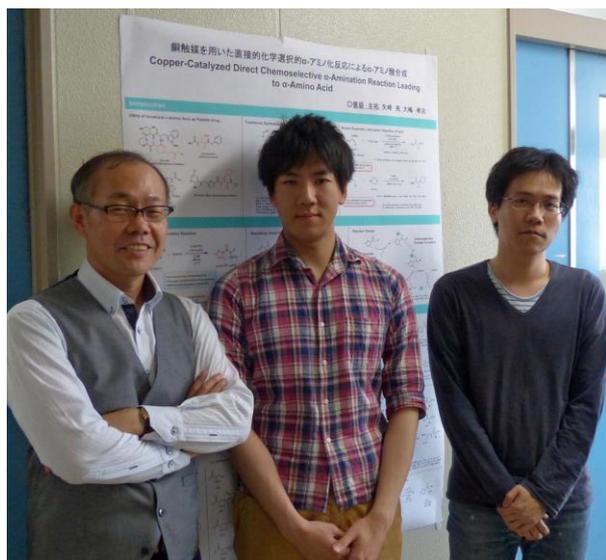
自然界に存在しない非天然型の  $\alpha$ -アミノ酸は、天然型の  $\alpha$ -アミノ酸では発現できない新たな機能を有しているものも多く、新たな医薬品開発などにおいて注目されています。しかし、非天然型の  $\alpha$ -アミノ酸は人工的な合成が必要であるため、その効率的な合成法の開発が強く望まれています。今回の研究成果では、あらかじめ  $\alpha$ -アミノ酸の炭素骨格を構築した後に、触媒的にアミノ基を導入する新たな合成戦略を立案することで、従来法では合成困難であった様々な官能基共存下において化学選択的に非天然型の  $\alpha$ -アミノ酸を合成することに成功しました。また本合成手法は、天然物などに広く存在し、安価で入手容易なカルボン酸を原料としており、カルボン酸を有している天然物を  $\alpha$ -アミノ酸に簡便に変換することができるため、新たな医薬品創製のためのツールとなることが期待されます。

本研究成果は、2016年2月9日（火）に国際科学誌「Journal of the American Chemical Society (IF 12.1)」で掲載されました。



(参考図)

カルボン酸誘導体としてアシルピラゾールを用いることで、これまで困難であった触媒的なアミノ化反応を化学選択的に進行させることに成功しました。本反応は、温和な条件下進行するため様々な官能基を用いることができます。



### 研究者からひとこと：

今回開発した  $\alpha$ -アミノ酸合成法では、独自の非天然型  $\alpha$ -アミノ酸を合成できますが、まだまだ合成できない  $\alpha$ -アミノ酸も数多くあります。そのため今後も、より実用的でこれまで合成すらされなかったような独自の  $\alpha$ -アミノ酸を合成するための手法を開発し、新規医薬品や機能性分子開発に貢献したいと考えています。