

# 天然物の構造解析を志向した *N*-アシル-β-アミノアルコール選択的な誘導体化の試み

(横浜市大院生命ナノ) ○入江 楽・及川 雅人

Studies on *N*-acyl-β-amino-alcohol-selective derivatization directed toward structure analyses of natural products

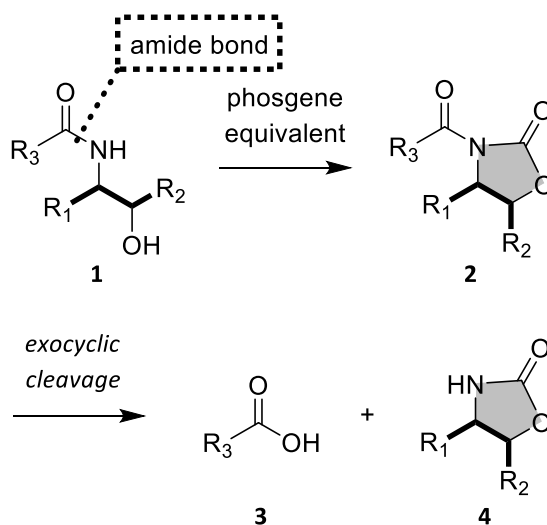
(Graduate School of Nanobioscience, Yokohama City University)

○Raku Irie, Masato Oikawa

An *N*-acyl-β-aminoalcohol motif **1** is frequently found in natural products<sup>1</sup> and pharmaceutical agents. Method for selective cleavage of the amide bond is of use to generate the fragments to 1) analyze the structure and to 2) investigate the structure-activity relationships, especially for structurally complex natural product. In this study, transformation of an *N*-acyl-β-aminoalcohol into the 5-membered cyclic carbamate **2** followed by an exocyclic cleavage of the amide bond to generate **3** and **4** under mild conditions was investigated.

**Keywords:** *N*-Acyl-β-aminoalcohol; Natural Products; Structure Analysis; Derivatization

*N*-アシル-β-アミノアルコール **1** は、天然物<sup>1</sup>や医薬品に含まれる部分構造である。そのアミド結合は化学的に安定であるため、脱アシル化に通常は強条件を必要とする。これを穏和な条件で選択的に実現できれば、複雑な骨格を有する天然物の立体化学解析のための分解や、構造活性相関研究にあたり有用な手法となる。本研究では *N*-アシル-β-アミノアルコールを五員環カルバメート **2** に誘導後、環外のアミド結合を選択的に切断することで、カルボン酸 **3** および脱アシル化物 **4** を得る流れを基軸に反応検討を行ったので報告する。



[1] (a) Cantrell, C. L.; Gustafson, K. R.; Cecere, M. R.; Pannell, L. K.; Boyd, M. R. *J. Am. Chem. Soc.* **2000**, *122*, 8825–8829. (b) Takada, K.; Choi, B. W.; Rashid, M. A.; Gamble, W. R.; Cardellina, J. H., II; Van, Q. N.; Lloyd, J. R.; McMahon, J. B.; Gustafson, K. R. *J. Nat. Prod.* **2007**, *70*, 428–431. (c) Irie, R.; Takada, K.; Ise, Y.; Ohtsuka, S.; Okada, S.; Gustafson, K. R.; Matsunaga, S. *Org. Lett.* **2017**, *19*, 5395–5397.