イミダゾールの化学を利用した N-アシル-β-アミノアルコール選 択的な脱アシル化反応

(横市大院生命ナノ) ○入江 樂・及川 雅人

Studies on N-acyl- β -aminoalcohol-selective deacylation using imidazole chemistry (*Graduate School of Nanobioscience, Yokohama City University*)

ORaku Irie, Masato Oikawa

Selective cleavage of the amide bond is of use to generate the fragments of structurally complex natural product to 1) analyze the structure, and to 2) investigate the structure–activity relationships. In this study, we focused on N–acyl– β –aminoalcohol motif, frequently found in some natural products and pharmaceutical agents. Two-step cleavage of the amide by derivatization of the motif into N–acyloxazolidinone via imidazolyl carbamate followed by N–deacylation under mild conditions will be reported.

Keywords: N-Acyl-β-aminoalcohol; Imidazole; Carbonyldiimidazole; Oxazolidinone; N-Deacylation

アミド結合の穏和な条件における開裂反応は、複雑な骨格を有する天然物の構造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。本研究では天然物や医薬品などにも含まれる部分構造であるN-アシル β -アミノアルコール1に着目し、1,1'-カルボニルジイミダゾール(CDI)により誘導したイミダゾリルカルバメート2を経由するオキサゾリジノン形成(3)および脱アシル化反応(4,5)について検討を行ったので報告する。

amide bond
$$R_{3} \xrightarrow{NH} R_{2} \xrightarrow{CDI} R_{3} \xrightarrow{NH} R_{2} \xrightarrow{Cyclization} R_{3} \xrightarrow{R_{1} \times R_{2}} CDI \xrightarrow{R_{2} \times R_{2}} CDI \xrightarrow{R_{3} \times R_{2}}$$