

# 27Q-pm05S

## 極性変換を鍵とする多成分系の分子変換

○古沢 晃太<sup>1</sup>, 友原 啓介<sup>2</sup>, 長谷川 直人<sup>1</sup>, 加藤 敦<sup>2</sup>, 足立 伊佐雄<sup>2</sup> (<sup>1</sup>富山大薬, <sup>2</sup>富山大病院薬)

【目的】多成分からなる生薬抽出エキスを基質とした合成反応では、予期せぬ副反応や成分の分解等により、反応成績体の同定は困難を極めることになる。本研究では、官能基選択的な反応系により系の複雑化を回避するとともに、極性変換を行うことで混合物から反応成績体を容易に同定する方法を開発し、複数の新規天然物様化合物を一挙に合成することとした。

【方法】官能基選択的でありかつ極性変換可能な分子変換として、単純ケトンを経験とする Bucherer-Bergs ヒダントイン合成反応を選択した。モデル実験により反応条件及び精製方法を最適化した後、定性的・定量的分析により選抜した基質（生薬抽出エキス）について誘導化を行った。

【結果】生薬「菘朮」「牡丹皮」「生姜」の酢酸エチル抽出エキスを基質として、最適化した Bucherer-Bergs 反応条件下で誘導化を行ったところ、四置換不斉炭素を持つ複数の新規アミノ酸誘導体を一挙に合成することができた。<sup>1</sup>このとき、低極性画分中の単純ケトンが高極性化合物に変換されたため、反応成績体の同定は容易であった。次に、高極性成分の低極性化を指向した誘導化を検討した。生薬「烏梅」のメタノール抽出エキスを基質として、DMT-MM<sup>2</sup>を用いた誘導化を行ったところ、高極性カルボン酸の低極性化に成功した。現在、反応成績体および出発成分の構造解析を行っているところである。

【考察】多成分系の分子変換は、新規天然物様化合物の一挙合成法として、また新規成分同定法として有効であることが示された。

1) Tomohara, K.; Adachi, I. *et al. Tetrahedron Lett.* **2016**, *57*, 924. 2) Kunishima, M. *et al. Tetrahedron* **2001**, *57*, 1551.