ニトロベンゼン誘導体とチオールによる光スルホンアミドカップ リングの開発

(東工大院生命理工) ○遊部 智大・金森 功吏・湯浅 英哉

Development of photo sulfonamide coupling with nitrobenzene derivatives and thiols (*Graduate School of life science, Tokyo Institute of Technology*) OTomohiro Yube, Takashi Kanamori, Hideya Yuasa

Sulfonamides are often used as bioisosteres for carboxylic acids and amides in the pharmaceutical field because they have more stable structures that are less susceptible to hydrolysis by acids and bases and hydride reduction compared to carboxylic acid amides. Here we discovered a novel photoreaction to form sulfonamides from nitrobenzene derivatives and thiols. Unlike existing synthetic methods, this reaction uses substrates that are inherently less reactive and does not require catalysts.

Accordingly, we investigated the conditions, substrates, and reaction mechanism of this new reaction. As a result, sulfonamide was formed in 42% yield when *N*-acetyl-4-nitroaniline was used as a substrate. The mechanism of sulfonamide formation was estimated to be the photosensitization mechanism of nitrobenzene derivatives.

Keywords: Sulfonamide; Nitrobenzene; Thiol; Photoreaction

スルホンアミドはカルボン酸アミドと比較して、酸や塩基による加水分解やヒドリド還元を受けにくい安定性の高い構造を持ち、医薬品分野などにおいてカルボン酸やアミドに対するバイオイソステアとしてしばしば利用されている。今回ニトロベンゼン誘導体とチオールからスルホンアミドを形成する新規の光反応を発見した。この反応は既存の合成法と異なり、本来反応性の低い基質を用いる反応であり、また触媒などを必要としない。

続いて、この新規スルホンアミド合成法についての条件検討、基質検討及び反応機構の推定を行った。その結果基質検討において N-アセチル-4-ニトロアニリンを基質とした際 42%の収率でスルホンアミドが生成された。またスルホンアミドの生成機構についてニトロベンゼン誘導体の光増感機構によるものであることが推定された。