

# ベンズアニリド誘導体における外部刺激誘起によるアミド異性体の選択的生成

## Stimulus-triggered selection of amide cis-trans isomers of benzanilides by transformation of N-substitution

○一瀬 朝海<sup>1</sup>、尾谷 優子<sup>1</sup>、大和田 智彦<sup>1</sup>

○Asami Ichinose<sup>1</sup>, Yuko Otani<sup>1</sup>, Tomohiko Ohwada<sup>1</sup>

1. 東大院薬

1. Grad. Sch. Pharm. Sci., The Univ. of Tokyo

【目的】アミド結合において、アミドプロトン(NH)を持つ二級アミドがトランス体の構造をとるのに対し、アミドプロトンを持たない三級アミドはシス体とトランス体が平衡で存在する。二級アミドを持つベンズアニリドはトランス体をとるが、アミド窒素上にメチル基などアルキル置換基を導入することで、三級アミドとなりシス体の構造をとることが知られている。本研究では、光照射や酸・塩基添加などの外部刺激によりアミド窒素上の置換基を脱離させ、アミド結合においてシス体からトランス体への変化を誘起することを目的とし脱離基の構造最適化を検討した。

【方法・結果】アミド窒素に異なる方法で脱離可能なベンジル基を有する2種のベンズアニリド誘導体1、2を合成し、それぞれについて置換基の脱離能と脱離による構造の変化を解析した。o-nitrobenzyl基を持つ1では光照射<sup>1)</sup>により、4-acetoxy-2-methoxybenzyl基を持つ2ではCsFを用いた条件<sup>2)</sup>により、いずれも脱離反応が進行し、シスアミド体1、2からトランスアミド体3に変化することを確認した(図1(a))。さらに、ベンズアニリド誘導体1と $\alpha$ -アミノ酸を結合させたペプチドも合成した(図1(b))。上記の外部刺激によるベンズアニリドのアミドシス体からトランス体への選択的変換を利用したペプチドコンホメーションのスイッチングについても発表する。

【参考文献】

1) Nandy S. K. et al. Org. Lett. (2007), 9, 2249-2252.

2) Muranaka K. et al. J. Org. Chem. (2011), 76, 9278-9293.

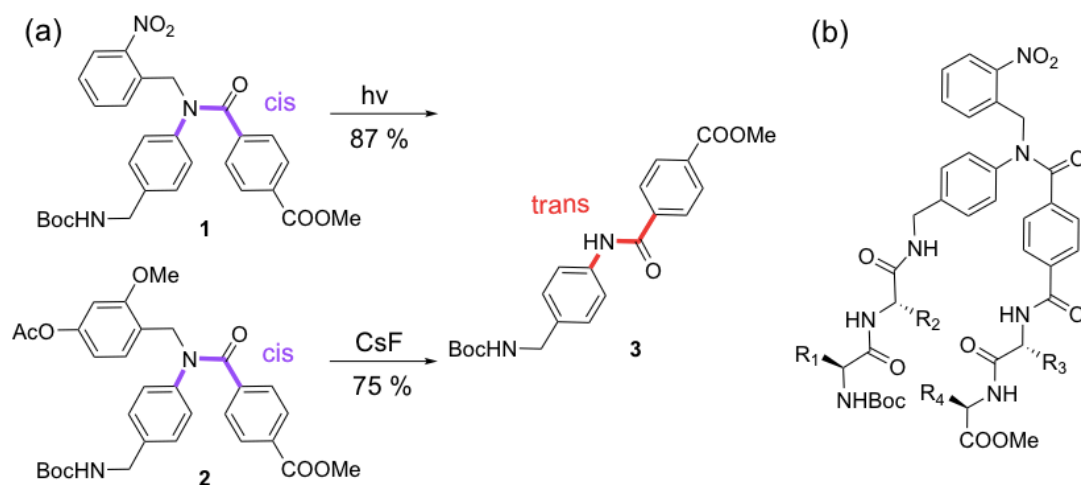


図1 外部刺激誘起型アミド異性体の選択的創製