

## アミドアリル化反応を利用する新規なラクタム構築法の開発

(静大工) 仙石 哲也・○高野 亜也加・依田 秀実

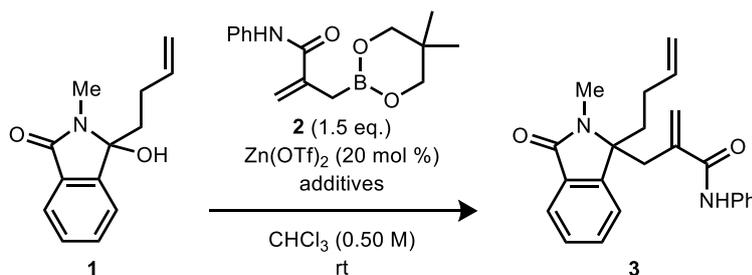
Development of new synthetic method for lactam derivatives based on amide allylation.  
(Faculty of Engineering, Shizuoka University) Tetsuya Sengoku, ○Ayaka Takano, Hidemi Yoda

We investigated a new synthetic method for dialkenyl lactams bearing an amide functionality. When the hydroxylactam bearing an butenyl side chain at the  $\gamma$ -position was treated with  $\beta$ -amido allylboronate in the presence of catalytic amounts of  $\text{Zn}(\text{OTf})_2$  and  $\text{K}_2\text{CO}_3$ , and 18-crown-6, a new lactam bearing two different alkenyl chains was formed in 25% yield. Use of molecular sieves 4 Å instead of  $\text{K}_2\text{CO}_3$  accelerated the reaction to give the corresponding lactam in 42% yield.

**Keywords** : nucleophilic amide allylation;  $\beta$ -amido allylboronate;  $\gamma$ -hydroxylactam; diallyl lactam

同一炭素上にアルケニル基を二つ有するラクタムは、二環式複素環化合物の前駆体として利用可能である。本研究では、アルケニル鎖上に官能基化の足がかりとなるアミド基を有する新規な  $\gamma$ -二置換ラクタムの合成を検討した。

$\gamma$ -ブテニル  $\gamma$ -ヒドロキシラクタム **1** を基質に用い、クロロホルム溶媒中にてトリフルオロメタンスルホン酸亜鉛(II) ( $\text{Zn}(\text{OTf})_2$ ) 存在下、アリル化剤 **2** との反応を試みたところ、**1** への付加は全く進行せず、**2** の分解が起こるのみであった (entry 1)。一方、炭酸カリウム ( $\text{K}_2\text{CO}_3$ ) やリン酸三カリウム ( $\text{K}_3\text{PO}_4$ ) と 18-crown-6 を添加した場合においては、室温下反応が進行し、収率 25% および 27% で **3** が得られることが明らかとなった (entries 2, 3)。さらに、塩基の代わりにモレキュラーシーブス 4 Å (MS 4 Å) を添加したところ、収率が大幅に向上した (42%) (entry 4)。



entry	additives		yield [%] <sup>a</sup>
1			N.R.
2	$\text{K}_2\text{CO}_3$	18-crown-6	25
3	$\text{K}_3\text{PO}_4$	18-crown-6	27
4	MS 4 Å	18-crown-6	42

<sup>a</sup> Isolated yield. N.R. : no reaction.

1) Sattely, E. S.; Alexander Cortez, G.; Moebius, D. C.; Schrock, R. R.; Hoveyda, A. H. *J. Am. Chem. Soc.* **2005**, *127*, 8526.