ニオブ触媒によるアルケンとニトリルを用いた第二級アミドの合成

(1.関西大化学生命工) ○野村 萌葵¹・宮嶋 貴大¹・大洞 康嗣¹ Synthesis of secondary amide from alkene and nitrile by using niobium catalyst (¹ *Fac. Chem. Matl. & Bioeng., Kansai Univ.*) ○Moegi Nomura,¹ Takahiro Miyajima,¹ Yasushi Obora¹

Secondary amides are one of the most important frameworks for pharmaceuticals and antibiotics. Ritter reaction is known as a synthesis method of secondary amides. We have reported the synthesis of secondary amides from alkenes and nitriles with NbCl₅. However, the reaction needed two equivalents of NbCl₅ to limited substrates used. We have also reported the synthesis of pyrimidine derivatives using NbCl₅ as a catalyst. In this reaction, we conducted synthesis of secondary amides in the presence of FeCl₃ as additive. As a result, the reaction proceeded with a catalytic amount of NbCl₅ and secondary amides were obtained in moderate yield. The yields were further improved by adding FeCl₃ in several times. In this presentation, we report the details of reaction conditions.

Keywords: niobium; iron; secondary amide; alkene; nitrile

第二級アミドは医薬品や生理活性物質などに見られる重要な骨格の一つである. 第二級アミドの合成法として当研究室ではルイス酸としてニオブを用いたリッター 反応を報告している ¹⁾. しかしこの方法では,限定反応基質に対してニオブを当量以 上用いるという問題点があった. また当研究室では,添加剤として塩化鉄を加えるこ とによりニオブがピリミジン誘導体の合成において高い触媒活性を示すことを報告 した ²⁾. そこで第二級アミドの合成においても新たに添加剤として塩化鉄を加えるこ とにより,従来当量以上必要であったニオブを触媒として用いることが可能ではないかと考え,検討を行った. 結果として,触媒量のニオブで反応が進行し中程度の収率で目的生成物を得ることができた. また,塩化鉄を複数回に分けて添加することにより,収率はさらに向上した. 本発表ではその他の反応条件や実験の詳細な検討について報告する.

$$^{n}C_{5}H_{11}$$
 + PhCN $\xrightarrow{cat. \text{NbCl}_{5}}$ NaOH aq + $^{n}C_{5}H_{11}$ \xrightarrow{N} Ph H

- 1) K. Yasuda, Y. Obora, J. Organomet. Chem., 2015, 775, 33.
- 2) M. Fuji, Y. Obora, Org. Lett., 2017, 19, 5569.