

α -ケトアミドに対する極性転換による O-アルキル化反応

(三重大院工) ○寺澤 俊也・溝田 功

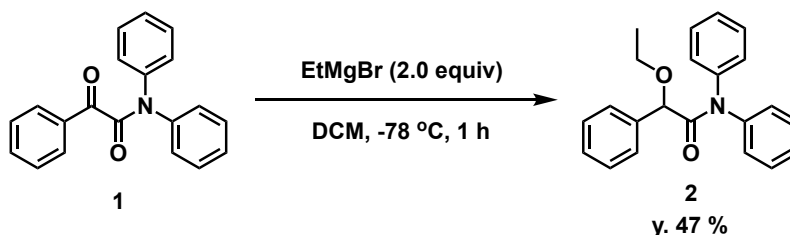
Umpolung Reaction of α -Ketoamide (Graduate School of Engineering, Mie University) ○ Shunya Terasawa, Isao Mizota

We have already reported that the umpolung reaction of α -iminoester with organometallic reagents proceeded smoothly to give the corresponding products in high yields. Recently, we developed a tandem *N*-alkylation/intramolecular amidation/*N*-alkylation reaction for α -hydrazonoester and the total synthesis of inhibitor of glycine type 1 transporter. In this study, we found the *O*-alkylation of α -ketoamides with organometallic reagents to give the α -alkoxycarbonyl compounds.

Keywords : α -Ketoamide; Umpolung Reaction; *O*-Alkylation; α -Alkoxycarbonyl Compound

α -アルコキシアミドは、抗真菌性や PDA10A 阻害活性をはじめとする様々な生物活性物質中に広く見られ、またそのような化合物の合成中間体であるという点で非常に重要な骨格である。当研究室では、 α -イミノエステルに対し有機金属反応剤を用いる事で、極性転換反応が進行し、高収率で対応する *N*-アルキル化体を得られることを既に見出し報告している。^{1,2)}今回反応性の高い酸素を持つカルボニル化合物へ同様の反応を行うことで極性転換が進行し、エーテル合成が可能になるのではないかという仮説を立て α -ケトアミドに、有機金属反応剤を作用させたところ望みの *O*-アルキル化が進行することを見出したので詳細に報告する。

α -ケトアミド **1** に対し 2.0 当量の EtMgBr をジクロロメタン溶媒中 -78 °C で 1 時間反応させたところ、目的の α -アルコキシアミド **2** を収率 47% で得た。



- 1) I. Mizota, M. Shimizu, *Chem. Rec.* **2016**, *16*, 688.
- 2) I. Mizota, Y. Nakamura, S. Mizutani, N. Mizukoshi, S. Terasawa, M. Shimizu, *Org. Lett.* **2021**, *23*, 4168.