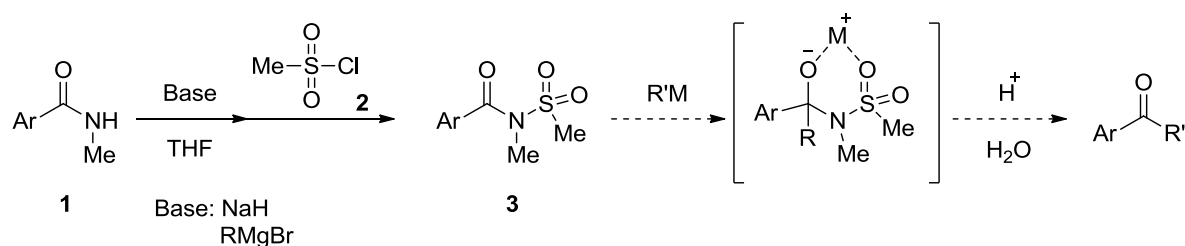


芳香族酸アミドは反応性が低く、官能基変換を簡便に行うことができない。その中であって窒素上にメトキシ基を有する Weinreb amide は、各種求核試薬との反応によりホルミル基やアシル基に変換することができ、合成化学的に有用であるが、カルバモイル基のメトキシ化は非常に困難である。そこで本研究では、配位性活性基としてスルホニル基に着目し、カルバモイル基への導入を検討した。



塩基として水素化ナトリウムを用いて酸アミド **1** のカルバモイル基をアニオンとした後、メタンサルホン酸クロリド **2** を作用させたところ、少量のスルホニル化生成物 **3** を得た。反応条件の最適化の検討を種々行った結果、収率の向上が認められたものの 30%程度に留まった。そこで塩基を対カチオンがマグネシウムである Grignard 試薬に替えたところ、スルホニル化体の収率を 64%にまで大幅に向上させることに成功した。こうして得たスルホニル化体 **3** の官能基変換についても検討を行った。