

NaO^tBu による *N*-アリール-β-ケトアミドのイソシアネートの脱離をとまなうアリール基の 1,4-転位反応

(阪大院工¹・阪大 ICS-OTRI²) ○森本 もえ¹・島住 竜馬¹・鳶巣 守²

NaO^tBu-Promoted 1,4-Aryl Shift of *N*-Aryl-β-ketoamides with the Elimination of Isocyanate.

(¹Graduate School of Engineering, Osaka University, ²ICS-OTRI, Osaka University)○Moe Morimoto,¹ Ryoma Shimazumi,¹ Mamoru Tobisu²

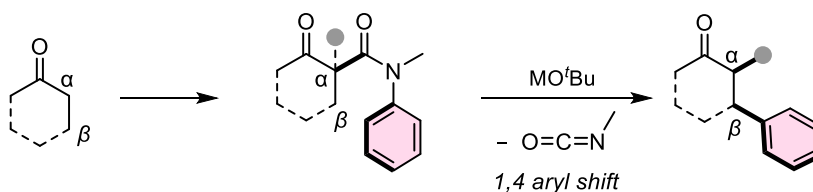
β-Aryl carbonyl compounds are valuable motifs commonly found in bioactive molecules, including drug candidates, antioxidants, and pesticides. Traditionally, these compounds are prepared via the conjugate addition of aryl nucleophiles to α,β-unsaturated carbonyl compounds. Recently, several transition metal-catalyzed β-C–H arylation strategies have emerged, enabling the direct functionalization of saturated carbonyl compounds.

In this study, we have developed a new transition metal-free methodology for the β-arylation of cyclic ketones. This transformation was achieved via the introduction of an amide group as a traceless aryl source, followed by a 1,4 aryl rearrangement and elimination of isocyanate.

Keywords : Arylation; Elimination of isocyanate; β-ketoamide; Transition metal-free; Rearrangement

β-アリール置換カルボニル化合物は、医薬品、農薬などの生物活性化合物に含まれている有用な化合物である¹⁾。従来、β-アリール置換カルボニル化合物は、α,β-不飽和カルボニル化合物にアリール求核剤を共役付加することにより調製される。最近では、遷移金属触媒による飽和カルボニル化合物のβ位 C–H アリール化反応が報告されている²⁾。

本研究では、遷移金属を用いない新たな環状カルボニル化合物のβ位アリール化反応を開発した。本反応は、除去可能なアリール源であるアミド基の導入、アリール基の 1,4 転位およびイソシアネートの脱離を経て進行する。



transition metal-free

1) (a) L. Melvin.; M. Johnson.; C. Harbert.; G. Milne.; A. Weissman.; *J. Med. Chem.* **1984**, 27, 67. (b) G. Roth.; A. Chandra.; M. Nair. *J. Nat. Prod.* **1998**, 61, 542.

2) Huang, Z.; Dong, G. *J. Am. Chem. Soc.* **2013**, 135, 17747.