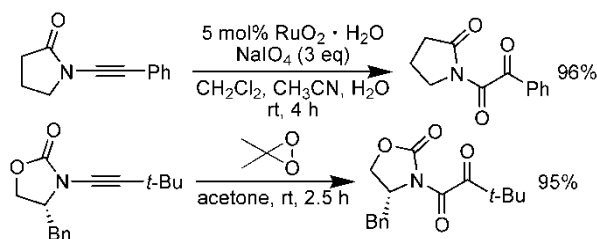


遷移金属触媒を用いない酸化反応による α -ケトイミド体の簡便合成法開発

岩澤研究室 T13M051 筑後拓也

1. 緒言

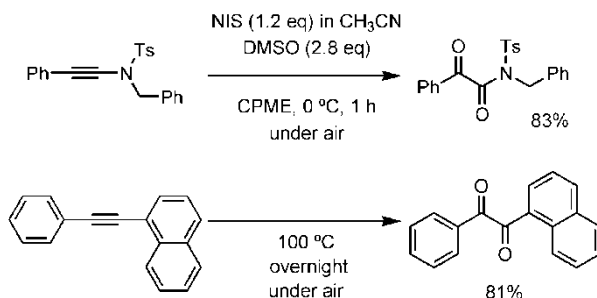
有機合成化学の一つの目標は、これまで危険とされていた反応の代替となるプロセスの改良開発である¹。特に酸化反応は有機合成の根幹となる反応であるにもかかわらず、毒性の高い遷移金属や爆発性の酸化剤を用いることが未だ多く、グリーンなプロセスの開発が求められている。今回我々は、金属を用いないイナミドの酸化による α -ケトイミドの合成法を報告する。



Scheme 1. Transition metal-promoted and explosive oxidant-enhanced oxidation of ynamides.²

2. 実験と結果

出発原料のイナミドに入手容易で比較的安全な NIS、DMSO を大気下で加えるだけで、迅速に α -ケトイミド骨格が生成する方法を開発した²。本反応は 0 °C 下わずか 1 時間以内に完結し、グラムスケールでも反応が進行することを確認した。さらに本法は、非対称型ジアリールアルキンのジケトン酸化にも適用可能であることを見出した。



Scheme 2. NIS/DMSO/CPME mediated-oxidation of ynamides and unsymmetrical diarylalkynes.

Reference.

- 1) Anastas, P. T. and Warner, J. C. *Green Chemistry, Theory and Practice*, Oxford University Press: Oxford, 1998.
- 2) (a) Al-Rashid, Z. F.; Johnson, W. L.; Hsung, R. P.; Wei, Y.; Yao, P.-Y.; Liu, R.; Zhao, K. *J. Org. Chem.* **2008**, *73*, 8780-8784. (b) Al-Rashid, Z. F.; Hsung, R. P. *Org. Lett.* **2007**, *10*, 661-664.