

金属ナトリウムを用いたシクロプロパンカルボキシアミドの開環二官能基化

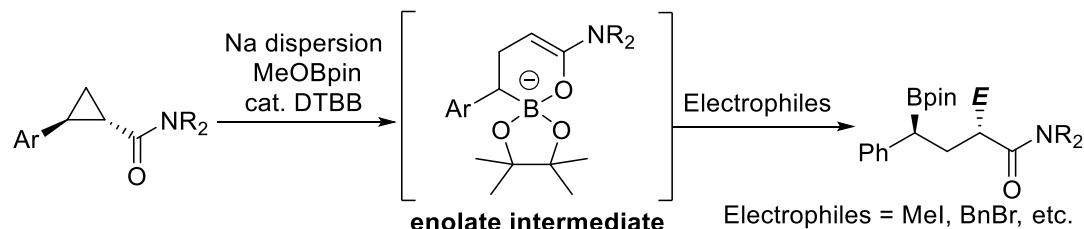
(京大院理) ○王 燦・加賀 敦志・黒木 堯・依光 英樹

Sodium-mediated Ring-opening Difunctionalization of Cyclopropanecarboxamides (*Graduate School of Science, Kyoto University*) ○Shuo Wang, Atsushi Kaga, Takashi Kurogi, Hideki Yorimitsu

We recently reported reductive ring-opening 1,3-difunctionalization of 1,2-diaryl cyclopropanes by using alkali metal and reduction-resistant electrophiles which can coexist with alkali metal.¹ Here, we report unsymmetrical ring-opening difunctionalization of cyclopropanecarboxamides. Treatment of aryl cyclopropanecarboxamides with sodium dispersion in the presence of methoxypinacolborane as a reduction-resistant electrophile leads to reductive cleavage of the cyclopropane ring followed by instant trapping with the boron electrophile to yield the enolates of γ -aryl- γ -borylalkenamides. The enolates react further with a different electrophile to yield the corresponding α -substituted amides in good yield with high *anti* selectivity.

Keywords : Sodium metal; Cyclopropanecarboxamide; Reductive ring-opening; Borylation; Enolate

ごく最近我々は、単体アルカリ金属による還元条件に共存可能な耐還元性求電子剤を利用することで、金属ナトリウムを用いた 1,2-ジアリールシクロプロパンの開環 1,3-二官能基化反応を報告した¹。今回我々は、2-アリールシクロプロパンカルボキシアミドを用いることで、非対称な二官能基化を達成したので報告する。2-アリールシクロプロパンカルボキシアミドに対して、メトキシピナコールボラン共存下、ナトリウム分散体を還元剤として作用させると、還元的な開環とホウ素求電子剤の捕捉により、対応する γ -アリール- γ -ボリルアルカンアミドのエノラートが生じた。このエノラートに対して別の求電子剤を作用させると、 α 位で反応が進行した生成物が高収率かつ高アンチ選択性で得られた。



1) S. Wang, A. Kaga, H. Yorimitsu, *Synlett* **2021**, 32, 219.