

イリジウム触媒を用いた *N*-アルキル基の α 位 C–H 活性化を経る分子内環化反応

(阪市大院理) ○田中 克昌・西村 貴洋

Iridium-catalyzed Intramolecular Cyclization *via* α C–H Activation of an *N*-Alkyl Group (*Graduate School of Science, Osaka City University*) ○Katsumasa Tanaka, Takahiro Nishimura

Transition metal-catalyzed direct C–H functionalization has attracted much attention in terms of atom- and step-economy. In this respect, intramolecular cyclization involving C–H activation provides an efficient method for carbo- and heterocyclic compounds that are often included in pharmaceutical and agricultural chemicals. Here we report that a cationic iridium-catalyzes intramolecular cyclization of alkenylamines through the activation of sp^3 C–H bond of an *N*-alkyl group. For example, the reaction of 3-chloro-*N*-(2-vinylphenethyl)pyridin-2-amine (**1**) in the presence of $[\text{IrCl}(\text{cod})]_2$ (5 mol% of Ir) and $\text{NaBAr}^{\text{F}}_4$ (10 mol%) in 1,4-dioxane at 80 °C for 20 h gave to the corresponding five-membered carbocycle **2** in 80% yield with very high diastereoselectivity.

Keywords : Iridium; C–H Activation; Cyclization

遷移金属触媒を用いた C–H 結合の直接的な官能基化は原子効率や反応工程数の削減につながるため、有用な反応として注目を集めている。C–H 結合活性化が関与する分子内環化反応は、医薬品や農薬によく含まれる炭素環式化合物やヘテロ環式化合物を効率よく合成する方法である。今回、我々はイリジウム触媒を用いたアルケニルアミンの C–H 結合活性化を伴う分子内環化反応を開発した。例えば、アルケニルアミン **1** をカチオン性イリジウム触媒存在下、1,4-ジオキサン中、80 °C で 20 時間反応させると五員環生成物 **2** がほぼ単一の生成物として収率 80% で得られた。

