

イリジウム触媒を用いたピラゾールおよびインダゾールの不斉アリル化反応

(青学大理工) 澤野 卓大・○石井 優吾・岩瀬 理帆・北村 桜・武内 亮

Iridium-Catalyzed Asymmetric Allylation of Pyrazoles and Indazoles (*Department of Chemistry and Biological Science, Aoyama Gakuin University*) Takahiro Sawano, ○Yugo Ishii, Riho Iwase, Sakura Kitamura, Ryo Takeuchi

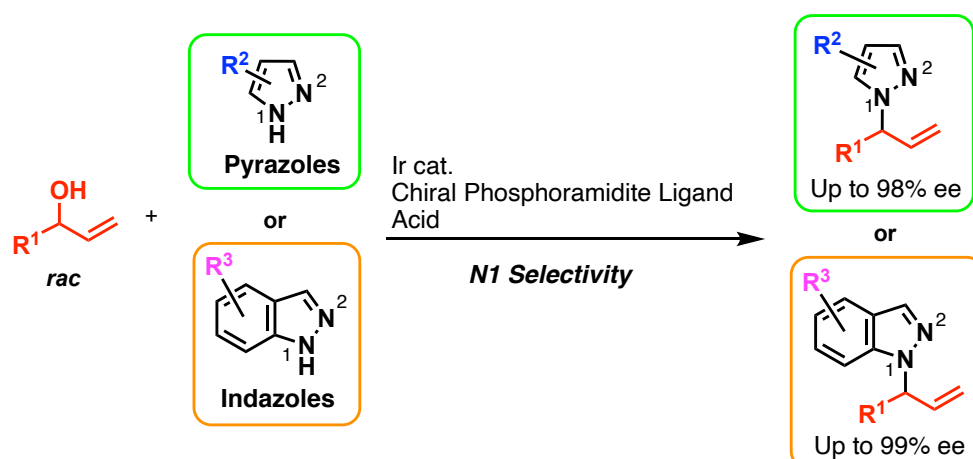
Whereas asymmetric allylic substitution via dynamic kinetic asymmetric transformation is a useful reaction for the enantioselective construction of a carbon-carbon bond from a racemic substrate,¹⁾ asymmetric allylic substitution with pyrazoles and indazoles, which can be found in a variety of biologically active compounds and pharmaceuticals, has not been reported. We first developed iridium-catalyzed asymmetric allylic substitution with pyrazoles and indazoles as nucleophiles.

In the presence of an iridium/phosphoramidite catalyst and an acid, the asymmetric N1-allylation of pyrazoles and indazoles via dynamic kinetic asymmetric transformation of racemic secondary allylic alcohols proceeds with high enantioselectivity.

Keywords : Iridium Catalyst; Asymmetric Allylation; Pyrazole; Indazole; Phosphoramidite Ligand

動的速度論的不斉変換を経由する不斉アリル化反応は、ラセミ体の基質からエナンチオ選択的に炭素-炭素結合を構築できる有用な反応として知られているが¹⁾、様々な種類の生理活性物質や医薬品の基本骨格に見られるピラゾールおよびインダゾールを用いた不斉アリル位置換反応は達成されていない。我々は初めて、イリジウム触媒によるピラゾールおよびインダゾールを用いた不斉アリル位置換反応を開発した。

イリジウム/キラルホスホラアミダイト触媒と酸存在下、ラセミ体の第2級アリルアルコールを用いたピラゾールおよびインダゾールのN1選択的な不斉アリル化反応が高エナンチオ選択的に進行した。



1) Sawano, T.; Matsui, T.; Koga, M.; Ishikawa, E.; Takeuchi, R. *Chem. Commun.* **2021**, 57, 9684.