

高供与性イミダゾ[1,5-*a*]ピリジンカルベンを用いる Buchwald-Hartwig アミノ化反応

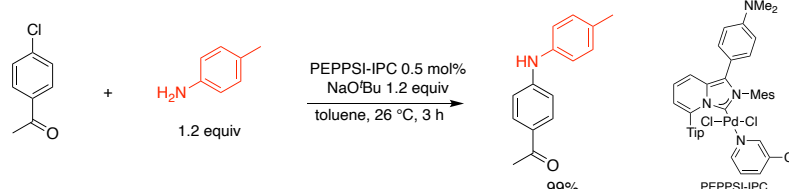
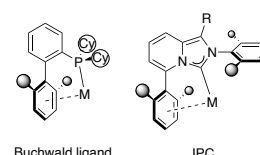
(岐阜大工) ○梅田 拓馬・柴田 理古・芝原 文利・村井 利昭

Application of Highly Donative Imidazo[1,5-*a*]pyridine Carbene to Buchwald-Hartwig Amination (*Faculty of Engineering, Gifu University*) ○Takuma Umeda, Yoshifuru Shibata, Fumitoshi Shibahara, Toshiaki Murai

Buchwald ligand is well established effective ligand for the Buchwald-Hartwig amination reaction based on fine tuning of steric and electronic characters. Imidazo[1,5-*a*]pyridine carbene (IPC) forms similar steric environment as Buchwald ligand when an aryl group is introduced at 5-position. In addition, we recently revealed that the electronic properties of imidazo[1,5-*a*]pyridine carbenes are flexibly controlled by substituents on 1-position. In this study, we developed an electron-rich IPC ligand as like Buchwald ligand by introducing highly electron-donating substituent at 1-position. With this ligand, Buchwald-Hartwig amination of aryl chloride well proceeded, and the catalytic activity was comparable to that of conventional Buchwald ligand system.

Keywords : imidazo[1,5-*a*]pyridine; NHC, Buchwald-Hartwig amination

Buchwald 配位子は、その立体的・電子的特徴により Buchwald-Hartwig アミノ化反応を促進する配位子になることが知られている。一方、イミダゾ[1,5-*a*]ピリジンカルベン(IPC)は5位にアリール基を導入すると、Buchwald 配位子と類似した立体構造を形成する。加えて、近年われわれは IPC のカルベンの電子的性質が、そのイミダゾピリジン骨格上の置換基により積極的に調整できることを明らかにしてきた。本研究では、カルベンがより電子豊富になる置換基を導入し、電子的にも Buchwald 配位子と類似した配位子を調製し、これを配位子とする塩化アリールの Buchwald-Hartwig アミノ化反応を検討した。その結果、この触媒系は Buchwald 配位子系に匹敵する触媒活性を示すことが明らかになった。



1) Koto, Y.; Shibahara, F.; Murai, T. *Org. Biomol. Chem.* **2017**, *15*, 1810.