

含窒素複素環カルベン配位子を持つイリジウム錯体触媒を用いたアルコールのメチルアミノ化反応

(京大院人環) ○吉田 七瀬・丁 在瑛・藤田 健一

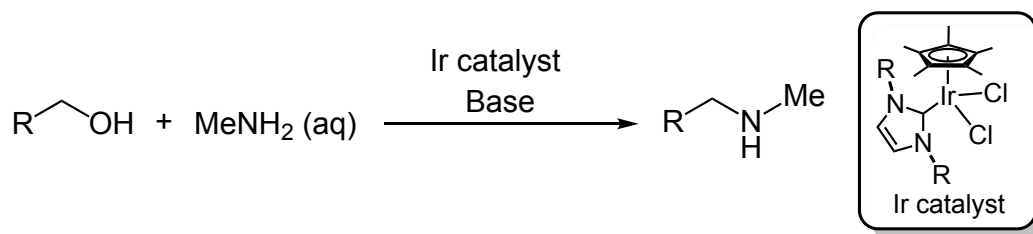
Methylamination of Alcohols Catalyzed by Iridium Complexes Bearing an N-Heterocyclic Carbene Ligand (*Graduate School of Human and Environmental Studies, Kyoto University*)

○Nanase Yoshida, Jaeyoung Jeong, Ken-ichi Fujita

Amines bearing N-methyl moieties are important compounds in the field of synthetic organic chemistry, because they are often recognized in bioactive substances and agrochemicals. Conventionally, the synthesis of N-methyl amines is performed via N-methylation reactions using methylating agents,¹ and reductive amination of carbonyl compounds.² However, from the viewpoint of environmental-benignity and atom economy such conventional protocols are not ideal due to the generation of toxic byproducts and the use of environmentally hazardous substances. In this work, we have achieved mono-methylation of alcohols using an aqueous solution of methylamine in the presence of iridium catalysts bearing an N-heterocyclic carbene (NHC) ligand. Alcohols with small burden on the environment are used as a starting material, and the only byproduct is water, making it an environmentally benign synthesis. When benzyl alcohol was heated and stirred in methylamine solution in the presence of an iridium catalyst and base, N-methylbenzylamine was obtained in a good yield.

Keywords: *Amine Synthesis; Iridium Catalyst; Methylamination; Water Solvent*

N-メチル部位を持つアミン類は生理活性物質や農薬に多く見られるため、重要な有機化合物群である。従来の N-メチルアミン合成は、メチル化剤を用いた N-メチル化反応¹や、カルボニル化合物の還元的アミノ化²等が用いられてきた。しかし、これらの反応は、環境負荷の高い基質や試剤を用いており、有害な副生成物を発生する等、原子効率や環境調和性の観点から理想的な反応とはいえない。本研究では、含窒素複素環カルベン（NHC）配位子を持つイリジウム錯体触媒を用いて、メチルアミン水溶液中でのアルコールのモノメチルアミノ化反応を達成した。環境負荷の低いアルコールを原料に用いており、副生成物は水のみであるため、環境調和性に優れた反応といえる。例えば、ベンジルアルコールをメチルアミン水溶液中、イリジウム錯体触媒と塩基の存在下で加熱撹拌したところ、良好な収率で N-メチルベンジルアミンが得られた。



1) Chiappe, C.; Piccioli, P.; Pieraccini, D. *Green Chem.* **2006**, 8, 277.

2) Eschweiler, W. *Ber. Dtsch. Chem. Ges.* **1905**, 38, 880.