

アミン類の効率的な *N*-ホルミル化とそれを利用したイミダゾール類の合成

(阪工大工) ○坂口 智哉・西尾 遼馬・松村 吉将・下村 修・大高 敦

Efficient *N*-Formylation of amines and their utilization in the synthesis of imidazole derivatives
(Faculty of Engineering, Osaka Institute of Technology) ○Tomoya Sakaguchi, Ryoma Nishio, Yoshimasa Matsumura, Osamu Shimomura, Atsushi Ohtaka

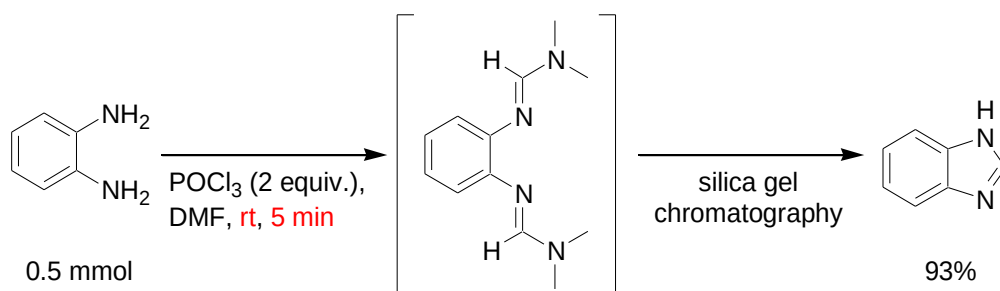
Tertiary formamides constitute pivotal structure components in numerous synthetic intermediates. In recent years, *N*-formylation reactions employing DMF as a formylation agent have been documented; however, these methods typically demand high temperature and prolonged reaction times.¹⁾ On the other hand, benzimidazoles are significant compounds widely used as fungicides and precursors for *N*-heterocyclic carbene (NHC) ligands. Nevertheless, the synthesis of imidazole derivatives utilizing DMF as a C1 source remains relatively underexplored, with most reported approaches requiring elevated temperatures and metal catalysts.²⁾

In this study, we present an efficient *N*-formylation of secondary amines using the Vilsmeier reagent and demonstrated its application to the synthesis of benzimidazole derivatives under milder conditions, using DMF as the C1 source.

Keywords : Vilsmeier reagent; DMF; *N*-Formylation; Imidazole derivatives.

第三級ホルムアミド骨格は様々な合成中間体に含まれる重要な構造である。近年、DMF をホルミル化剤とする *N*-ホルミル化反応は数多く報告されているものの、高温条件や長時間などの過酷な反応条件が必要とされる¹⁾。一方で、ベンズイミダゾール類は殺菌剤や *N*-ヘテロ環状カルベン(NHC)配位子の前駆体に用いられている重要な化合物である。しかしながら、DMF を C1 源とするイミダゾール類の合成例は少なく、多くの場合高温条件や金属触媒が必要とされる²⁾。

本研究では Vilsmeier 試薬による第二級アミン類の効率的な *N*-ホルミル化と、それを利用することで DMF を C1 源としたより温和な条件下でのベンズイミダゾール誘導体の合成を達成した。



- 1) (a) Jagtap, S. V. *et al. Org. Lett.* **2017**, 19, 2078. (b) Kihara, N. *et al. Tetrahedron Lett.* **2019**, 60, 1291.
- 2) (a) Bhanage, B. M. *et al. Synlett* **2015**, 26, 2835. (b) Liu, W.; Sun, W. *et al. Tetrahedron* **2017**, 73, 3458. (c) Islami, M. R. *et al. Chem. Pap.* **2018**, 72, 2973.