



FONCTIONNALISATION « ONE POT » DES POSITIONS 3 ET 6 D'IMIDAZO[1,2-*a*]PYRIDINES SOUS IRRADIATION MICRO-ONDES♦

J. Koubachi^{1,2}, S. El Kazzouli^{1,2}, S. Berteina-Raboin^{1*},
A. Mouaddib², G. Guillaumet¹

¹*Institut de Chimie Organique et Analytique, Université d'Orléans, UMR
CNRS 6005, B.P. 6759, 45067 Orléans Cedex 2, France*

²*Faculté des Sciences et Techniques de Béni-Mellal, Université Cadi-
Ayyad, BP 523, 23000 Béni-Mellal, Maroc.*

*Correspondance : sabine.berteina@univ-orleans.fr

Abstract: The synthesis of imidazo[1,2-*a*]pyridines functionalized in positions 3 and 6 has been done in one-pot and under microwaves.

Keywords: *imidazo[1,2-*a*]pyridines, one-pot palladium, microwaves.*

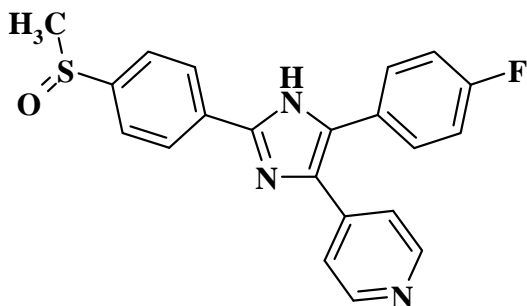
Résumé : Synthèse d'imidazo[1,2-*a*]pyridines fonctionnalisées en positions 3 et 6 réalisée en one-pot et sous irradiation micro-ondes.

Mots clés : *imidazo[1,2-*a*]pyridines, one-pot palladium, micro-ondes.*

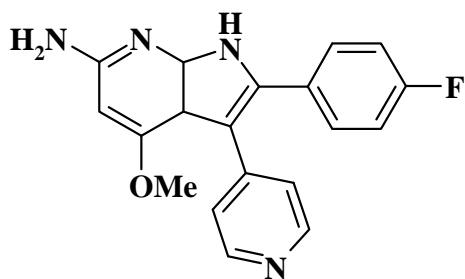
♦ Paper presented at COFrRoCA 2006: Quatrième Colloque Franco-Roumain de Chimie Appliquée, 28 June – 2 July, Clermont-Ferrand, France

INTRODUCTION

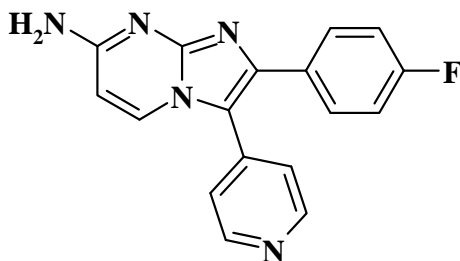
Depuis quelques années, les kinases dépendantes des cyclines (ou CDK) sont devenues des cibles de choix pour la recherche thérapeutique [1 – 5]. Une nouvelle classe de composés di- et trisubstitués a suscité notre intérêt pour la mise en œuvre de diverses modifications structurales. Des tests réalisés sur des composés tels que les imidazoles, azaindoles ou imidazo[1,2-*a*]pyrimidines (Fig.1), montrent qu'ils sont aussi d'excellents inhibiteurs de l'ALK5 [6, 7].



I SB 203 580



II RWJ 68 354



III

*Figure 1.*SYNTHESE D'IMIDAZO[1,2-*a*] PYRIDINES SUBSTITUEES
EN POSITION 3 ET 6

Dans ce travail nous présentons la fonctionnalisation « one pot » des sommets 3 et 6 d'imidazo[1,2-*a*]pyridines sous irradiation micro-ondes [12]. A notre connaissance, pour réaliser ce type de fonctionnalisation en position 3 et 6, trois étapes sont nécessaires : une première réaction de Suzuki [8, 9] ou de Stille [10, 11] en position 6 suivie d'une iodation ou bromation en position 3 et enfin un autre couplage pallado-catalysé de type Suzuki ou Stille (Schéma 1).

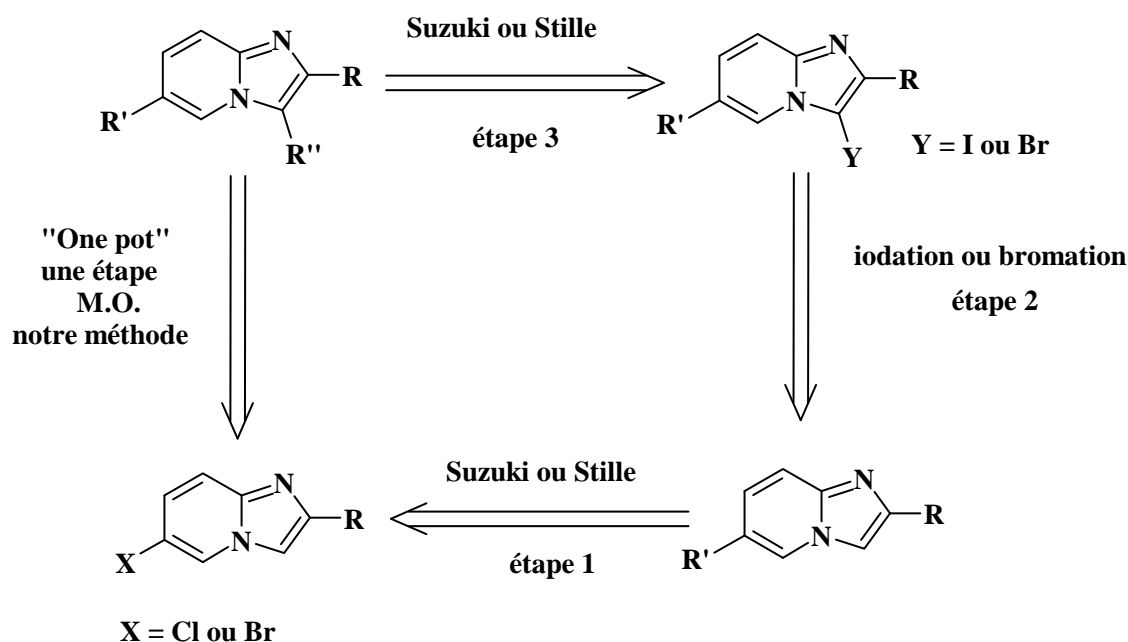


Schéma 1.

CONCLUSION

Ce travail nous permet d'avoir accès très rapidement à des imidazo[1,2-*a*]pyridines diversement substituées en positions 3 et 6.

REFERENCES BIBLIOGRAPHIQUES

1. Gray, N. ; Détiavaud, L. ; Doerig, C. Meijer, L. *Curr. Med. Chem.* **1999**, 6, 859.
2. Damiens, E. ; Meijer, L. *Path. Biol.* **2000**, 48, 340.
3. Sielecki T. M. ; Boylan, J. F. ; Benfield, P. A. ; Trainor, J. L. *J. Med. Chem.* **2000**, 43, 1.
4. Knockaert, M. ; Greengard, P. ; Meijer, L. *Trends Pharm.Sci.* **2002**, 23, 417.
5. Huwe, A. ; Mazitschek, R. ; Giannis, A. *Angew. Chem.* **2003**, 42, 2122.
6. Kenneth, C. R.; James, R. H.; John, H. D.; Scott, A. W.; Druie, E. C.; Gilbert, C. O.; Bohumilia, F.; John, J. S, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **2003**, 13, 347.
7. Dae-Kee, K.; Joonseop, K., Hyun-Ju, P, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **2004**, 14, 2401.
8. Enguehard, C.; Renou, J. L.; Collot, V.; Hervet, M.; Rault S.; Gueiffier, A. *J. Org. Chem.* **2000**, 65, 6572.
9. Hevet, M. Gueiffier, A. Enguehard-Gueiffier, *Helv. Chem. Acta.* **2003**, 86, 3461.
10. Kawai, Y. ; Satoh, S.; Yamasaki, H.; Kayakiri, N.; Yoshihara, K.; Oku, T. P.C.T. WO 96/34866, **1996**.
11. Badger, A.; Bender, P.; Esser, K.. Griswold, D.; Nabil, H.; Lee, J.; Votta, B.; Simon, P. P.C.T. WO 91/00092, **1990**.

12. Koubachi, J.; El Kazzouli, S.; Berteina-Raboin, S.; Mouaddib, A.; Guillaumet, G. *Tetrahedron Lett.* soumis. Koubachi, J.; El Kazzouli, S.; Berteina-Raboin, S.; Mouaddib, A.; Guillaumet, G. *En préparation*