

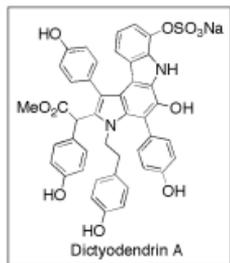
31V-pm08

ベンザイン中間体を経由する新規多置換複素環合成法の開発

○野地 寿治¹, 百井 雄一¹, 藤原 栄人¹, 岡野 健太郎¹, 徳山 英利¹(¹東北大院薬)

【背景】多置換芳香環に縮環した複素環は医薬等に多く見られることから、その位置選択的合成法の開発は重要な課題である。最近我々は、ベンザインを経由する新規7位置換インドリン合成法の開発を基盤として、海洋天然物 dictyodendrin 類の全合成を達成した¹。今回、本反応の一般性を検討したので、その詳細について報告する。

【方法・結果】モデル基質 **1** に対して、 $Mg(TMP)_2 \cdot 2LiCl$ を $-78^\circ C$ で加え、 $0^\circ C$ に昇温した。その結果、ベンザインの生成とつづく窒素アニオンからの環化が進行し、7-マグネシオインドリン **2** が生成した。これに対して種々の求電子剤を作用させて、7位置換インドリンを高収率で合成した(式1)。また、本反応は、銅へのトランスメタル化を経ることでワンポットクロスカップリング反応へ展開できることがわかった(式2)。さらに、窒素上の置換基に関する検討や、本反応系の他の複素環骨格構築への応用についても合わせて報告する。



【参考文献】1) Tokuyama, H. *et al. Angew. Chem. Int. Ed.* **2010**, *49*, 5925; Tokuyama, H. *et al. Chem. Asian J.* Early View (doi:10.1002/asia.201000544)