

29E02-am10S

パラジウム炭素触媒による分子内 Buchwald-Hartwig 型インドール合成法の開発
○丸本 貴久¹, 高松 春樹¹, 澤間 善成¹, 門口 泰也¹, 佐治木 弘尚¹(¹岐阜薬大)

【目的】インドール骨格はセロトニンやトリプトファンなどの生体内物質や、インドメタシンに代表される医薬品の重要な部分構造である。また、インドール環 1 位に 4-フルオロフェニル基を持つセルチンドールは抗精神病作用を示すなど *N*-アリールインドール誘導体には生物活性の発現が期待される。当研究室では分離・回収が容易で再利用可能な不均一系触媒であるパラジウム炭素(Pd/C)によるハロゲン化アリールとアミン類とのクロスカップリング反応を開発している(*Adv. Synth. Catal.* **2008**, 350, 2767)。今回、2-プロモフェネチルアミン誘導体を基質とすることで、分子内で芳香族アミノ化反応が進行し、インドリン骨格を経てインドールが生成することを見い出した。

【方法・結果】10% Pd/C を触媒として 2-プロモフェネチルアミン、1,1'-ビスジフェニルホスフィノフェロセン(DPPF)及びナトリウム ターシャリーブトキシド(NaO^tBu)をメシチレン中 140 °C で攪拌したところインドリン(**1**)が、また反応温度を 200 °C に昇温するとインドール(**2**)がそれぞれ単一の生成物として得られた。さらに、140 °C でもインドリンの生成後に酢酸を添加することで、インドールへの芳香化が効率よく進行することが明らかとなった。また、インドール生成後にプロモベンゼンを添加すると、分子間での C-N クロスカップリング反応が進行し、*N*-フェニルインドール(**3**)をワンポットで合成することができた。

