

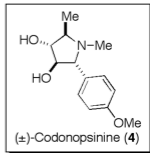
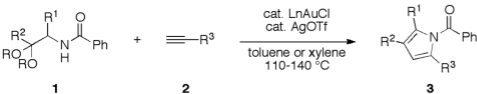
26C-am06S

金触媒を用いた新規多置換ピロール合成法の開発

山口 南実¹, ○亀谷 紘¹, 杉本 健士², 植田 浩史¹, 徳山 英利¹ (¹東北大院薬, ²富山大院薬)

【背景・目的】ピロールは多くの医薬品や機能性材料に含まれる骨格であり、汎用性の高いピロール合成法の開発は重要な課題である。しかし、既存のピロール合成法では合成可能な置換様式の一般性が低く、また、ピロール環の選択的な官能基化も容易ではない。一方、当研究室では、金触媒による分子内連続的環化反応を利用した多置換インドリジン合成法を開発している。¹そこで、本反応を分子間反応に応用し、多置換ピロール合成法の開発を行った。

【方法・結果】まず、アセタールアミド **1** とアセチレン **2** を使い、種々、条件検討を行った。その結果、カチオン性金触媒存在下、連続的付加環化反応が進行し、1,2-二置換ピロール **3** が得られることがわかった。² また、あらかじめ側鎖を導入した基質に対して本反応を適用し、多様な置換様式のピロールを得ることもできた。さらに、確立した反応をもとに、(±)-codonopsinine (**4**)の全合成も行ったので、併せて報告する。



【参考文献】 1) Tokuyama, H. *et al. Angew. Chem. Int. Ed.* **2013**, *52*, 7168.

2) Tokuyama, H. *et al. Org. Lett.* **2014**, *16*, 4948.