

28AB-am005

2-アミノカルコンの転位反応を利用する one-pot インドール合成法の開発
○中村 光¹, 田中 智士¹, 高子 怜大¹, 前川 智弘¹, 三木 康義¹ (¹近畿大薬)

【目的】我々の研究室では、超原子価ヨウ素試薬を用いたカルコン類の転位反応を利用した複素環合成研究を行ってきた。その中で、2位に保護されたアミノ基を持つカルコンに対して転位反応を行うとアセタールを経由し、容易にインドール類に変換できることを報告している。¹⁾しかし中間体のアセタールが不安定なため、段階的に反応させた場合に収率が良くない点が課題であった。今回、転位後に酸または塩基を加え、アミノ基の脱保護と環化までを一挙に行うことで、収率の改善が期待できると考え反応条件を検討した。

【結果】まずカルコンの転位反応の条件を最適化した結果、オルトギ酸メチルを溶媒とし PIDA と $\text{BF}_3 \cdot \text{Et}_2\text{O}$ を組み合わせた条件を用いると、転位が円滑に進行することが分かった。転位終了後にアセタールを単離することなく、酸を加え反応を行った場合、目的のインドールは低収率でしか得られなかった。一方、炭酸カリウム水溶液で塩基性条件にすると、アミノ基の脱保護に続き環化反応が進行し、目的のインドール類が高収率で得られた。室温条件では反応に時間を要しアセタールの分解を伴うため、加温が収率向上の要因となった。発表では、本手法の基質適応範囲など詳細について報告する。

