

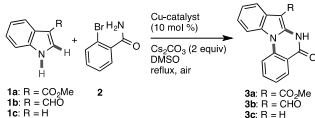
27PA-am007S

Ullmann アリール化/2-アミド化カスケード反応の開発

○松原 裕希¹, 高橋 侑加¹, 山田 康司¹, 阿部 匠¹ (¹北医療大薬)

【目的】インドロ[1,2-*a*]キナゾリノンは PARP-1 阻害剤として報告されているが、合成に数工程を必要とするためより簡便な合成法の開発が望まれている。そこで今回我々は、インドロ[1,2-*a*]キナゾリノンを効率的に入手する事を目的として簡便合成法の開発研究に着手した。

【方法・結果】インドール **1** とベンズアミド **2** の反応において、Ullmann アリール化反応と 2-アミド化反応が連続的に進行すればインドロ[1,2-*a*]キナゾリノン **3** をワンポットで得ることができるのではないかと期待した。まず、**1a** と **2** を DMSO 中で CuI 存在下加熱還流した。その結果、期待の Ullmann アリール化/2-アミド化カスケード反応が進行し、収率 42% でキナゾリノン **3a** が得られた。銅触媒の検討により収率 73% まで向上した。本カスケード反応を円滑に進行させるためには、適切なインドール 3 位置換基とベンズアミドの併用が必須であることが判明した。これら反応活性化の機構について、本年会において併せて報告する予定である。



Cu-catalyst	% yield (3a)
CuI	42
CuBr	73
CuCl	40
CuOAc	36

(1) Abc, T.; Takahashi, Y.; Matsubara, Y.; Yamada, K. *Org. Chem. Front.* **2017**, *4*, 2124-2127.