

P, オレフィン型配位子を用いたパラジウム触媒反応による3-アリルインドール誘導体の合成

(千葉大院工) 三野 孝・○山岡 敏樹・栢田 千尋・渡邊 康平・吉田 泰志・坂本 昌巳

Synthesis of 3-Allylindole Derivatives Using Palladium Catalyst with P,Olefin Type Ligand
(Graduate School of Engineering, Chiba University) Takashi Mino, ○Toshiki Yamaoka, Chihiro Masuda, Kohei Watanabe, Yasushi Yoshida, Masami Sakamoto

Many biologically active natural organic compounds and medicines have an indole structure, and a method for efficient synthesis of indole derivatives is expected. We previously reported the Pd-catalyzed intramolecular reaction of *N*-allyl-*N*-tosyl-2-ethynylaniline derivatives with P,olefin type ligand gave the corresponding 3-allylindole derivatives in good yields. In this study, the intermolecular reaction of compound **1a** ($R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{Ph}$) as *N*-tosyl-2-ethynylaniline derivative and allyl ester **2a** ($R^3 = \text{Ph}$) was carried out using 4.0 mol% of Pd catalyst ($\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$), 8.0 mol% of ligand, and 2 equiv. of K_2CO_3 in *tert*-butylbenzene. The desired indole derivative **3aa** was obtained in 91% yield. Moreover, we found that this reaction is applicable to a wide range of substrates.

Keywords : Indole; P,Olefin Type Ligand; Palladium Catalyst

多くの生物活性な天然有機化合物や医薬品はインドール骨格を有しており、インドール誘導体を効率的に合成する方法が期待されている。これまで当研究室において、パラジウム触媒を用いた *N*-アリル-*N*-トシル-2-エチニルアニリン誘導体の分子内反応において、P,オレフィン型配位子を用いることで、対応する 3-アリルインドール誘導体が良好な収率で得られることを報告している。本研究では、*N*-トシル-2-エチニルアニリン誘導体として化合物 **1a** ($R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{Ph}$) とアリルエステル **2a** ($R^3 = \text{Ph}$) を用い、*tert*-ブチルベンゼン中、触媒として $\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$ を 4.0 mol% (Pd=8.0 mol%)、配位子 8.0 mol%、炭酸カリウム 2 当量存在下で分子間反応を行ったところ、目的のインドール誘導体 **3aa** が収率 91% で得られた。また、基質検討を行った結果、幅広い基質に対して適用可能であることを見出したので、それらも併せて報告する。

