

ハロゲン化アリールを用いる 1-インドリルマグネシウムの 3-アリール化反応

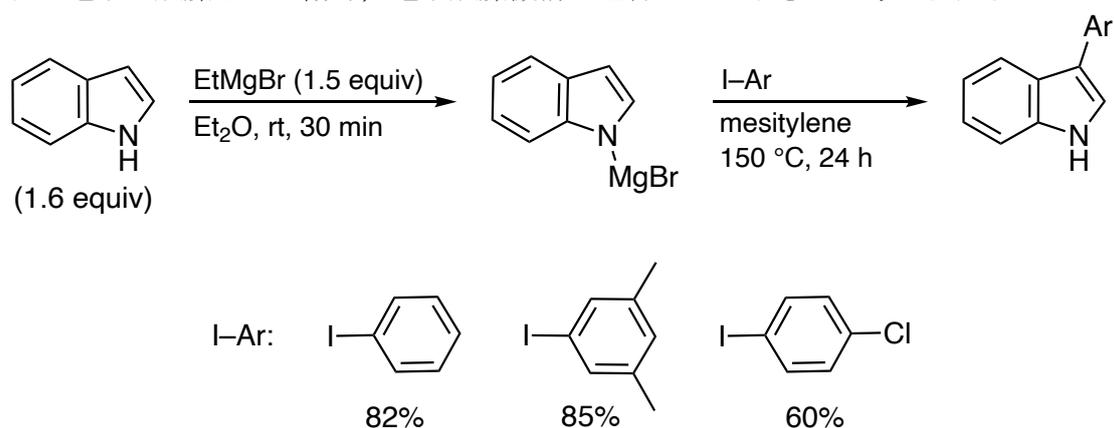
(関西学院大生命環境¹・JST CREST²) ○奥澤 結子¹・米倉 恭平¹・白川 英二^{1,2}
 3-Arylation of 1-Indolylmagnesiums with Aryl Halides (¹*School of Biological and Environmental Sciences, Kwansai Gakuin University*, ²*CREST, JST*) ○Yuiko Okuzawa,¹ Kyohei Yonekura,¹ Eiji Shirakawa^{1,2}

Organometallic compounds have merely been used as nucleophiles in the electron-catalyzed cross-coupling reaction forming a carbon-carbon bond. Here 1-indolylmagnesium bromides were found to be applied to the electron-catalyzed cross-coupling reaction with aryl halides, giving 3-arylindoles regioselectively.

Keywords: Radical Mechanism; Electron Catalysis; Aryl Halides; Indoles; 3-Arylindoles

我々はこれまでに、有機金属化合物とハロゲン化アリールの電子触媒クロスカップリング反応を多数開発してきたが¹⁾、炭素-炭素結合を構築する電子触媒クロスカップリング反応では、求核剤として有機金属化合物のみが利用されてきた。今回、ハロゲン化アリールを用いる電子触媒クロスカップリング反応への 1-インドリルマグネシウムの適用を検討し、3-アリールインドールが位置選択的に得られることを見つけたので報告する。

エチルマグネシウムブロミド (1.5 当量) によるインドール (1.6 当量) の脱プロトン化によって調製した 1-インドリルマグネシウムブロミドを、メシチレン中 150 °C でヨードベンゼンと 24 時間反応させたところ、3-フェニルインドールが収率 82% で得られた。本反応には、5-ヨード-*m*-キシレンも利用できる。1-クロロ-4-ヨードベンゼンの反応は、クロロ基を損なうことなく進行し、対応する 3-アリールインドールが中程度の収率で得られた。反応は、1-インドリルマグネシウムから供給された電子が触媒として働く、電子触媒機構で進行しているものと考えられる。



- 1) E. Shirakawa, in *Science of Synthesis: Free Radicals: Fundamentals and Applications in Organic Synthesis* ed. by L. Fensterbank, C. Ollivier, Thieme, Stuttgart, **2021**, pp. 135–158.