

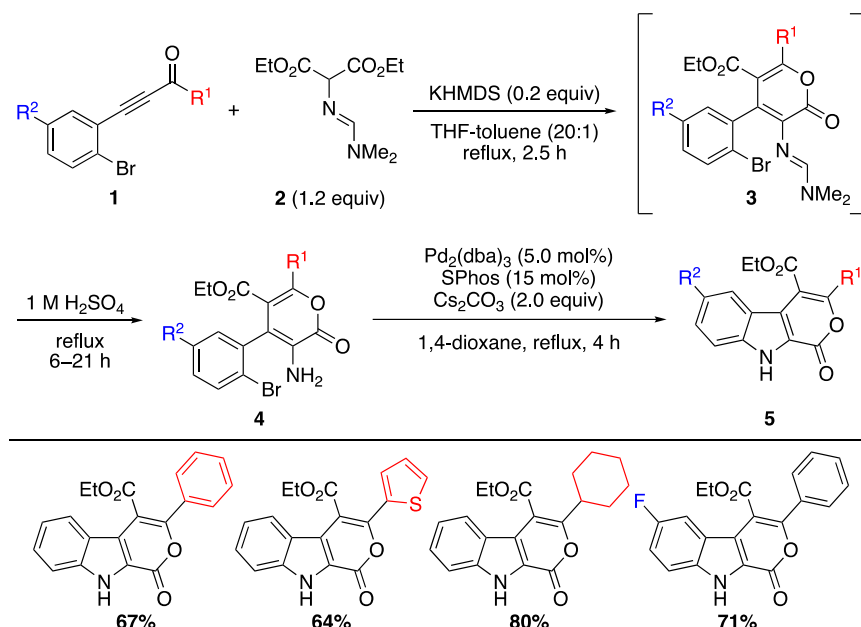
2-アミノマロン酸ジエチルのアルキニルケトンへの共役付加反応を用いた 3-アミノ-2-ピロン合成を経るピラノインドール-1-オンの合成

(三重大院工) 福岡 宏太・○山崎 蓮・今井 克俊・平野 航太郎・後藤 信介・八谷 巖
 Synthesis of Pyranoindol-1-ones via 3-Amino-2-pyrone Synthesis Using the Conjugate Addition Reaction of Diethyl 2-Aminomalonate to Alkynyl Ketones (*Graduate School of Engineering, Mie University*) Kota Fukuoka, ○Ren Yamasaki, Katsutoshi Imai, Kotaro Hirano, Shinsuke Goto, Iwao Hachiya

Pyranoindol-1-ones have attracted much attention due to their interesting biological activities such as anti-tumor and cancer effects. Therefore, the development of an efficient synthesis of multi-substituted pyranoindol-1-ones has been highly desired. We report that the synthesis of multi-substituted pyranoindol-1-ones is developed using palladium-catalyzed intramolecular amination of 3-amino-4-(2-bromophenyl)-2-pyrones prepared by the conjugate addition reaction of diethyl 2-aminomalonate to alkynyl ketones.

Keywords : 3-Amino-2-pyrone; Pyranoindol-1-one

ピラノインドール-1-オン骨格を有する化合物は、抗腫瘍、抗がん作用などを示し、その興味深い生物活性から注目されている含窒素ヘテロ環骨格の一つである。それゆえに、多置換ピラノインドール-1-オンの新規合成法の開発は強く望まれている。今回、アルキニルケトン **1** と 2-アミノマロン酸ジエチル **2** の共役付加反応とそれに続く脱保護により、3-アミノ-2-ピロン **4** を得た。続くパラジウム触媒を用いた 3-アミノ-2-ピロン **4** の分子内アミノ化により多置換ピラノインドール-1-オン **5** が得られることを見出したので報告する¹⁾。



- 1) K. Fukuoka, K. Imai, K. Hirano, S. Goto, R. Miura, I. Hachiya, *Asian J. Org. Chem.* **2022**, *11*, e202200110.