

Pd 触媒を用いた *N*-ブチル-3-アリルインドール誘導体の合成

(千葉大院工) 三野 孝・○中野 景太・山岡 敏樹・吉田 泰志・坂本 昌巳

Synthesis of *N*-Butyl-3-allylindole Derivatives Using Pd Catalyst

(Graduate School of Engineering, Chiba University) Takashi Mino, ○Keita Nakano, Toshiki Yamaoka, 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 using P,olefin type ligand gave the corresponding 3-allylindole derivatives in good yields. In this study, the intramolecular reaction of *N*-butyl-*N*-cinnamyl-2-ethynylaniline derivative **1a** was carried out using 2.5 mol % of Pd catalyst ($\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$), 5.0 mol % of ligand, and 2 equiv. of tripotassium phosphate in acetonitrile. The corresponding product was obtained in 56% yield (branch type 3-allylindole **2a** : linear type 3-allylindole **2a'** = 2.5 : 1). We also report the optimal conditions in this reaction.

Keywords : Indole; Pd 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。これまで当研究室では、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*-ブチル-*N*-シンナミル-2-エチニルアニリン誘導体 **1a** を用い、アセトニトリル中、パラジウム触媒($\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$)2.5 mol %、配位子 5.0 mol %、リン酸三カリウム 2 当量存在下で分子内反応を行ったところ、対応する生成物が収率 56% で得られた。(branch 型 3-アリルインドール **2a** : linear 型 3-アリルインドール **2a'** = 2.5 : 1)。また、条件検討を行った結果、branch 型の **2a** が選択的に得られた (**2a** : **2a'** =>20 : 1) ので、それらの結果についても報告する。

