

# 271-pm04

不均一系 Pd/C を触媒とするラロックーインドール合成法

○筒井 梓<sup>1</sup>, 青柳 聡夏<sup>1</sup>, 森 重樹<sup>1</sup>, 前川 智弘<sup>1</sup>, 門口 泰也<sup>1</sup>, 佐治木 弘尚<sup>1</sup>  
(<sup>1</sup>岐阜薬大)

【目的】生物活性を有する天然物や医薬品にはインドール骨格を有するものが多く、簡便なインドール環構築法の開発は重要な研究課題である。Larock インドール合成法は Pd 触媒及び塩基存在下、2-ヨードアニリン誘導体とジ置換アセチレンから 2,3-二置換インドール誘導体を位置選択的に合成する手法である。近年、回収・再利用が可能で、生成物中への金属残留の懸念がない不均一系触媒を用いた反応の開発が望まれている背景から、今回、パラジウム炭素(Pd/C)の適用を検討した。

【方法・結果】*N*-Ts-2-ヨードアニリンと2当量のジフェニルアセチレンを2 mol%のPd/C存在下、炭酸ナトリウムと塩化リチウムともにDMPU中で120℃で撹拌したところ、定量的に2,3-ジフェニルインドールが得られた。また、アセチレンを3当量、Pd/Cを5 mol%に増量することで、アリファティックジ置換及びモノ置換アセチレンの適用も可能となり、インドールの一般合成法として確立することができた。

