

研究区分	教員特別研究推進（独創・先進的研究）
------	--------------------

研 究 テーマ	遷移金属フリー脱芳香族的アリール化によるピロロインドリン類合成反応の開発				
研究組織	代 表 者	所属・職名	静岡県立大学薬学部・教授	氏名	眞鍋 敬
	研究協力者	所属・職名	静岡県立大学薬学部・准教授	氏名	小西 英之
		所属・職名	静岡県立大学薬学部・講師	氏名	岩本 憲人
		所属・職名	静岡県立大学薬学部・助教	氏名	山口 深雪
	発 表 者	所属・職名	静岡県立大学薬学部・教授	氏名	眞鍋 敬

講演題目
遷移金属フリー脱芳香族的アリール化によるインドリン類合成反応の開発
研究の目的、成果及び今後の展望
インドール等の含窒素複素環は、医薬品をはじめとする多くの機能性分子の骨格として重要な役割を果たしている。それらの効率的な化学合成のために、これまで多くの合成反応が開発されてきた。しかし、高価な反応剤や触媒が頻繁に使用されており、さらに毒性を持つ遷移金属触媒を移用する反応も多い。そのため、これまで遷移金属触媒を主に用いてきた反応に関して、高価かつ毒性を有する遷移金属触媒を用いない「遷移金属フリー」な反応条件で実現する手法の開発が注目されている。研究代表者らはこれまで、種々の遷移金属触媒を用いるインドール類のアリール化反応の開発で業績をあげてきた。ごく最近、インドール環に側鎖を有する誘導体を基質として用い、脱芳香族的アリール化と分子内環化とを連続的に行わせる三環性化合物の合成反応を開発した。これはアリール基（Ar基）を有するインドリン類の優れた合成法であるが、遷移金属であるパラジウムを触媒として用いている。そこで本研究では、遷移金属フリーの脱芳香族的アリール化を実現し、それを活用するインドリン類の新規合成法を開発することを目指した。 インドール誘導体 $\xrightarrow[\text{遷移金属フリー脱芳香族的アリール化}]{\text{アリール化剤 塩基}}$ [中間体] $\xrightarrow{\text{分子内環化}}$ 三環性インドリン誘導体 まず、文献を参考に、側鎖に NTs 基を有するインドール誘導体とジフェニルヨードニウム塩 ($\text{Ph}_2\text{I}^+\text{BF}_4^-$) を比較的強い塩基である BTMG 存在下に反応させたところ、低収率ではあるが目的物である三環性化合物が得られた。そこで、反応条件を種々検討したところ、塩基として <i>t</i>-BuOLi (4 当量)、溶媒として塩化メチレンを用いた場合に 53%で目的物が得られることが明らかとなった。このような遷移金属フリー脱芳香族的アリール化を活用した三環性インドリン誘導体の合成法はこれまで例が無く、初めての成功例である。今後、さらなる検討により、真に有効な合成法の開発へとつながるものと期待される。