

テオフィリンパラジウム触媒による銅フリー菌頭カップリング反応を 経由するワンポットインドール合成

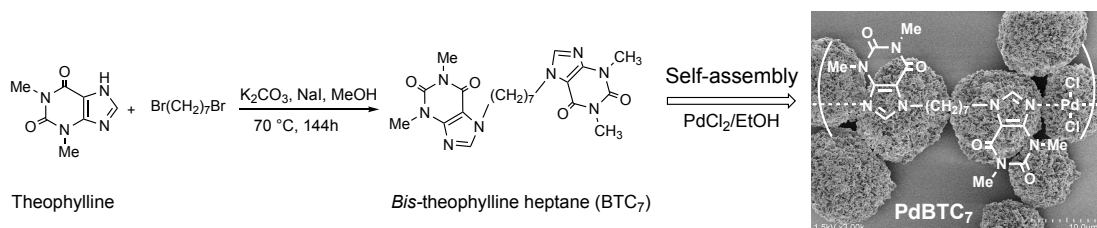
(神奈川大化学生命) ○貝掛 勝也・三浦 拓己・宮下 愛美・金 仁華

The one-pot synthesis of indoles via a copper-free Sonogashira coupling reaction using a theophylline-palladium catalyst (*Department of Applied Chemistry, Faculty of Chemistry and Biochemistry, Kanagawa University*) ○Katsuya Kaikake, Takumi Miura, Manami Miyashita, Ren-Hua Jin

The feasibility of using bistheophylline palladium complex (PdBTC₇) as a catalyst for the Sonogashira coupling reaction was investigated. It was found that under green conditions-water, 40°C, and triethylamine-the reaction proceeded very well without the presence of copper. Additionally, it was revealed that treating continuously the coupling product obtained from *o*-iodoaniline and ethynylbenzene with hydrochloric acid allowed to produce phenylindoles.

Keywords : *Theophylline; Copper-free Palladium catalyst; Sonogashira coupling reaction; green catalyst; indole*

2分子のテオフィリンをヘプチル鎖により連結した配位子(BTC₇)を合成し、パラジウムと錯形成させたパラジウムビステオフィリン触媒(PdBTC₇)を合成した(Scheme 1)。



Scheme 1. The route from theophylline to PdBTC₇.

この触媒は、水/エタノールを媒体とする鈴木-宮浦カップリング反応において、高い触媒活性と極めて優れたリサイクル性を示した。^{1, 2)} 本研究では同様な触媒 PdBTC₇を菌頭反応に展開し、その生成物からインドール閉環へのワンポット反応について検討した。種々の置換基を有するヨウ化アリル及びエチニル化合物を用いた反応が水/40°C/トリエチルアミンの条件下、銅フリーで高収率で進行した。このことを前提に、*o*-ヨードアニリン化合物に種々の置換基を有するエチニルをカップリング反応させたのち、その反応液に塩酸を加え、80°Cで24時間反応させたところ、インドール化合物が効率的に生成した。

【参考文献】 Suzuki-Miyaura coupling reaction using *bis*-theophylline-palladium catalyst has been reported. 1) K. Kaikake, N. Jou, G. Shitara, R.-H. Jin, *RSC Advances.*, **2021**, 11, 35311–35320. 2) K. Kaikake, K. Matsuo R.-H. Jin, *Catal. Commun.*, 181 **2023**, 106727.