

トリプタミンのアリル化反応によるピロロインドール誘導体の高効率合成法の開発

(長崎大院工¹・長崎大院総合生産科学²・長崎大環境保全セ³) ○池田 侑慧¹・小野寺 玄²・福田 勉^{2,3}・木村 正成²

Efficient Synthesis of Pyrroloindole Derivatives via Allylic Alkylation of Tryptamine (¹Graduate School of Engineering, Nagasaki University, ²Graduate School of Integrated Science and Technology, Nagasaki University, ³Environmental Protection Center, Nagasaki University) ○Yukie Ikeda,¹ Gen Onodera,² Tsutomu Fukuda,^{2,3} Masanari Kimura²

Pyrroloindole alkaloids exhibit antitumor and antibacterial activities and have recently attracted attention as useful bioactive molecules. We have previously reported that the reaction of indole with allyl alcohol in the presence of a Pd catalyst and triethylborane gives C3-allylindole with high regioselectivity.¹⁾

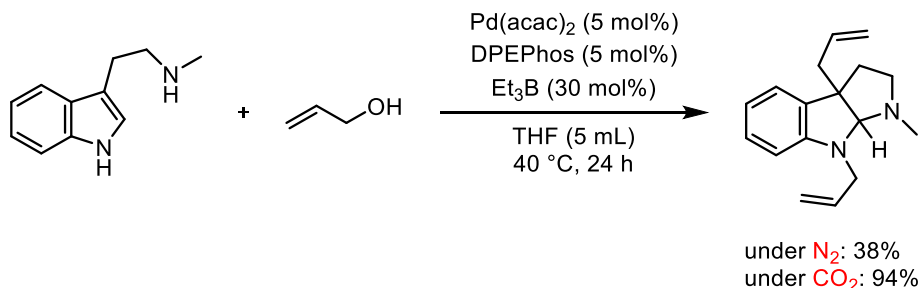
In this study, under similar catalytic conditions, the reaction was applied to *N*-methyltryptamine, the pyrroloindole skeleton was constructed in a single step. This reaction proceeds smoothly under a carbon dioxide atmosphere.

Keywords : Pyrroloindole; Allylation; Pd catalyst; Triethylborane

ピロロインドールアルカロイドは抗腫瘍活性や抗菌活性を示し、有用生理活性物質として注目されている。そのため、近年では高効率かつ高選択的な合成法の開発が求められている。

以前、当研究室では、Pd 触媒およびトリエチルボラン共存下、インドールとアリルアルコールとを反応させると、3-アリルインドールが高選択的に生成することを報告した¹⁾。この反応は、アリル化剤としてアリルアルコールを使用できるほか、強塩基を必要とせず、インドールの C3 位炭素上に高選択的にアリル基を導入できるという点で極めて有用な合成手法である。

今回、同形式の反応を *N*-メチルトリプタミンに適用した。触媒量の Pd(acac)₂, DPEPhos, トリエチルボランの存在下、テトラヒドロフラン中にて窒素雰囲気下で反応を行ったところ、ピロロインドール骨格を単工程で構築できた。また、二酸化炭素雰囲気下で本反応を行うと収率良くピロロインドールが生成した。



1) M. Kimura, M. Futamata, R. Mukai, Y. Tamaru, *J. Am. Chem. Soc.* **2005**, *127*, 4592-4593.