

アルキニルニトロベンゼンおよびアニリンを用いたインドール、キノリン、アクリジン、ベンゾチアジンの新規合成法の開発

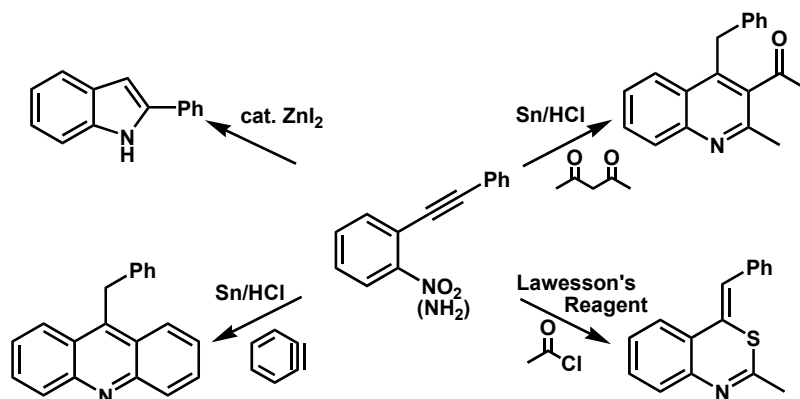
Efficient Synthesis of Indoles, Quinolines, Acridines, Benzothiazines from Alkynyl Nitrobenzenes and Anilines

尾崎沙織、瀬戸淳一、長洞記嘉、塩路幸生、大熊健太郎（福岡大理）

窒素や硫黄などのヘテロ原子を含む複素環化合物は天然物として存在し、多くの生理活性を持っていることからその合成法の開発は現在でも多くの研究がなされている。また、アルキニルニトロベンゼンおよびアニリンは菌頭カップリングによって簡単に合成出来るため、様々な複素環化合物誘導体の出発物質として用いることが容易である。これらのことから、我々はアルキニルニトロベンゼンおよびアニリンを用いて、ヘテロ原子を含む複素環化合物の簡便かつ効果的な合成法の開発に取り組むことにした。

①ハロゲン化亜鉛を用いたインドール類の合成: 出発物質である 2-アルキニルアニリンから安価なハロゲン化亜鉛を用いて触媒的環化反応によるインドール類合成法を見出した¹⁾。また、Zn と $\text{BrCH}_2\text{CH}_2\text{Br}$ を用いた 2-アルキニルニトロベンゼンからのインドール合成も可能であった。②多置換キノリン誘導体の one-pot 合成: 2-アルキニルニトロベンゼンを用いて還元、水和反応、Friedländer 反応を経由し、one-pot で多置換キノリン誘導体を得ることに成功した²⁾。③ベンザインとの反応によるアクリジン誘導体の合成: 2-アルキニルニトロベンゼンを用いて 2-アミノフェニルケトン類を合成し、さらにベンザインを作用させることで 9 位に置換基を有するアクリジン誘導体を得ることが出来た。

④硫化による 3,1-ベンゾチアジン誘導体の合成: 2-アルキニルアニリンを用いて 2-アルキニルアニリドを合成し、そこに硫化剤であるローソン試薬を作用させると硫化、環化反応が進行し、二重結合を環外に有するベンゾチアジン誘導体を得ることに成功した。



<参考文献>

- 1) K. Okuma, J. Seto, K. Sakaguchi, S. Ozaki, N. Nagahora, K. Shioji, *Tetrahedron Lett.* **2009**, 50, 2943.
- 2) K. Okuma, S. Ozaki, J. Seto, N. Nagahora, K. Shioji, *Heterocycles*, **2010**, 81, 935.

発表者紹介

氏名 尾崎 沙織 (おざき さおり)

所属 福岡大学大学院理学研究科

化学専攻

学年 M2

研究室 有機生物化学研究室

E-mail sd092004@cis.fukuoka-u.ac.jp

