

Bartoli インドール合成による 3, 3'-ビスインドリルメタンのワンポット構築

阿部 匠^{*}、仲村修平^{*}、柳田玲子^{**}、町支臣成、日比野俐、石倉 稔^{*}

Organic Letters, **15**, 3622-3625 (2013)

One-Pot Construction of 3, 3'-Bisindolylmethanes through Bartoli Indole Synthesis

Takumi Abe^{*}, Shuhei Nakamura^{*}, Reiko Yanada^{**}, Tominari Choshi,
Satoshi Hibino, and Minoru Ishikura^{*}

ABSTRACT: A one-pot approach to 3,3'-bisindolylmethane derivatives from nitrobenzene derivatives through the Bartoli indole synthesis was developed, in which the acid used to quench the reaction markedly affected its outcome. Quenching the reaction with concd HCl produced 3,3'-bisindolylmethane in contrast to the formation of 7-substituted indole by quenching with NH₄Cl.

抄録 Bartoli インドール合成は、2-置換ニトロベンゼンから短工程で7-置換インドール誘導体を合成する反応である。1-Chloro-2-nitrobenzene を低温下、ビニルマグネシウムブロミドを加え、2時間後 NH₄Cl で処理すると 7-chloroindole を 60% の収率で得られた。それに対して、10% HCl で処理すると bisindolylmethane が 26% の収率で 7-chloroindole が 22% 得られることが分かった。種々検討した結果、濃塩酸で処理すると bisindolylmethane のみが得られることが分かった。この反応を bisindolylmethane alkaloid の arundine、vibrindole へ応用できること分かり、arsindoline A、streptindole、arsindoline B の最初の合成を達成した。さらに、trisindoline 及び tris(3-indolyl)methane の合成に活用した。

^{*} School of Pharmaceutical Sciences, Health Science University of Hokkaido
北海道医療大学薬学部

^{**} Faculty of Pharmaceutical Sciences, Hiroshima International University
広島国際大学薬学部