

(19) 日本国特許庁 ( J P )

(12) 特 許 公 報 ( B 2 )

(11) 特許番号

特許第3323917号  
(P3323917)

(45) 発行日 平成14年9月9日(2002.9.9)

(24) 登録日 平成14年7月5日(2002.7.5)

(51) Int.Cl.<sup>7</sup>

識別記号

F I

C 0 7 D 209/08

C 0 7 D 209/08

B 0 1 J 31/24

B 0 1 J 31/24

X

C 0 7 D 209/10

C 0 7 D 209/10

209/12

209/12

209/18

209/18

請求項の数1(全6頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2000-70596(P2000-70596)

(22) 出願日 平成12年3月14日(2000.3.14)

(65) 公開番号 特開2001-261641(P2001-261641A)

(43) 公開日 平成13年9月26日(2001.9.26)

審査請求日 平成12年3月14日(2000.3.14)

前置審査

(73) 特許権者 391012394

東北大学長

宮城県仙台市青葉区片平2丁目1番1号

(72) 発明者 山本 嘉則

宮城県仙台市青葉区一番町2丁目10-26-1003

(72) 発明者 武田 玲

宮城県仙台市青葉区米ヶ袋一丁目3番13号

(74) 代理人 100058479

弁理士 鈴江 武彦 (外4名)

審査官 富永 保

(56) 参考文献 Heterocycles,  
(1998), 48(9), p. 1793-9

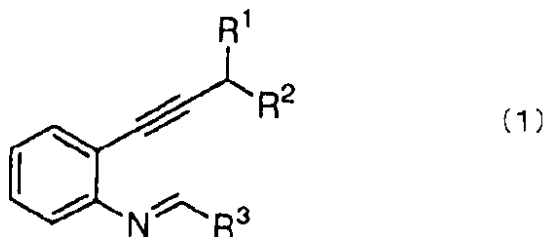
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 インドール化合物の製造方法

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記一般式(1)：

【化1】

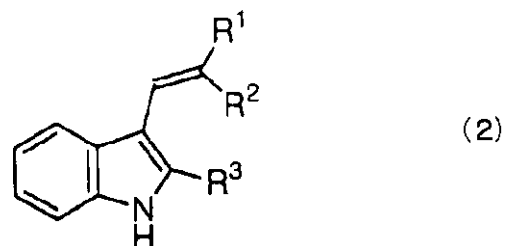


(一般式(1)中、R<sup>1</sup>は、メトキシメトキシもしくはエトキシカルボニルで置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>アルキル基、またはテトラヒドロピラニルオキシ基；R<sup>2</sup>は、水素；R<sup>3</sup>は、それぞれメチル基もしくはニトロ基で置換されていてもよいフェニル基、ピリジニル基、

フリル基またはチエニル基であり、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>とは、互いに結合して環を形成していてもよい)で示される2-(1-アルキニル)-N-アルキリデンアニリン化合物をパラジウム触媒の存在下に閉環させて下記一般式

(2)：

【化2】



(一般式(2)において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、一般式(1)における定義と同じ)で示されるインドール

化合物を製造することを特徴とするインドール化合物の製造方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、インドール化合物の製造方法に係り、特に、パラジウム触媒を用いたインドール化合物の製造方法に関する。

【0002】

【従来の技術】インドール骨格は数多くの天然のアルカロイドうち最も基本的な骨格の一つであり、インドール骨格を有するインドール化合物は、医薬品を合成するための中間体として重要である。インドール化合物の製造方法として、遷移金属触媒を用いた方法が種々提案されているが、その中でも、パラジウム錯体を触媒として用いた方法が注目されている。これらの方法は、次の三つのタイプに大別される。すなわち、1) 2 - アルキニルアニリン誘導体の分子内環化反応、2) 2 - ハロ - N - アリルアニリンまたは2 - ハロ - N - ビニルアニリンのヘック型環化反応、および3) 2 - ハロアニリンとアルキンの分子間環化付加反応である。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】しかしながら、上記従来の方法では、2位にアルケニル基を有するインドール化合物を合成することが困難であった。

【0004】従って、本発明は、2位にアルケニル基を有するインドール化合物を簡便な方法で合成することができるインドール化合物の製造方法を提供することを課題とする。

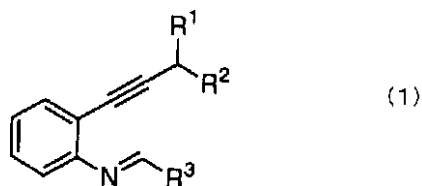
【0005】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、上記課題を解決すべく鋭意研究した結果、2 - (1 - アルキニル) - N - アルキリデンアニリン化合物をパラジウム触媒の存在下に閉環させることにより効率よく3 - 置換 - 2 - ((E) - 1 - アルケニル)インドール化合物を製造し得ることを見だし、この知見に基づいて本発明を完成した。

【0006】すなわち、本発明によれば、下記一般式(1)：

【0007】

【化3】

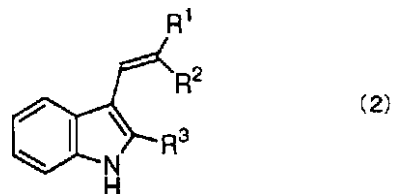


【0008】(一般式(1)中、R<sup>1</sup>は、メトキシメトキシもしくはエトキシカルボニルで置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub>アルキル基、またはテトラヒドロピラニルオキシ基；R<sup>2</sup>は、水素；R<sup>3</sup>は、それぞれメチル基も

しくはニトロ基で置換されていてもよいフェニル基、ピリジニル基、フリル基またはチエニル基であり、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>とは、互いに結合して環を形成していてもよい)で示される2 - (1 - アルキニル) - N - アルキリデンアニリン化合物をパラジウム触媒の存在下に閉環させて下記一般式(2)：

【0009】

【化4】



【0010】(一般式(2)において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は一般式(1)における定義と同じ)で示されるインドール化合物を製造することを特徴とするインドール化合物の製造方法が提供される。

【0011】

【発明の実施の形態】以下、本発明をより詳しく説明する。

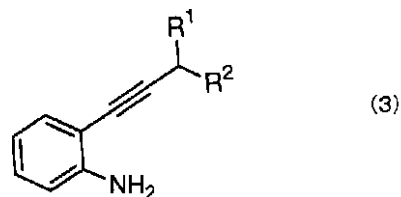
【0012】本発明は、上記一般式(1)で示される2 - (1 - アルキニル) - N - アルキリデンアニリン化合物をパラジウム触媒を用いて閉環させるものである。

【0013】一般式(1)において、R<sup>1</sup>は、メトキシメトキシもしくはエトキシカルボニルで置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub>アルキル基、またはテトラヒドロピラニルオキシ基であり、R<sup>2</sup>は、水素である。R<sup>3</sup>は、それぞれメチル基もしくはニトロ基で置換されていてもよいフェニル基、ピリジニル基、フリル基またはチエニル基である。R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>とは、互いに結合してシクロアルカン等の環を形成していてもよい。特に好ましくは、R<sup>1</sup>はエチル基であり、R<sup>3</sup>は、フェニル基等である。

【0014】一般式(1)で示される2 - (1 - アルキニル) - N - アルキリデンアニリン化合物は、下記一般式(3)：

【0015】

【化5】



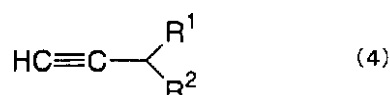
【0016】(ここで、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は一般式(1)と同じ)で示される2 - (1 - アルキニル)アニリン化合物を式R<sup>3</sup> - CHO(ここで、R<sup>3</sup>は、一般式(1)と同じ)で示されるアルデヒド化合物と反応させることにより得られる。この反応は、塩化メチレン等の有機溶媒中、室温で、モレキュラーシーブスとともに両反応体

をほぼ当量割合で混合することによりおこなうことができる。

【0017】また、一般式(3)で示される2-(1-アルキニル)アニリン化合物は、既知の方法(Tokuyama, H.; Yamashita, T.; Reding, M. T.; Kaburagi, Y.; Fukuyama, T. J. Am. Chem. Soc. 1999, 121, 3791)に従い2-ヨードアニリンと下記一般式(4)

【0018】

【化6】



【0019】(ここで、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は一般式(1)と同じ)で示される1-アルキン化合物とをパラジウム-銅触媒を用いてカップリング反応させることにより製造することができる。

【0020】本発明による一般式(2)のインドール化合物を生成する一般式(1)の化合物の閉環反応は、一般式(1)の化合物をジオキサン等の有機溶媒中において、酢酸パラジウム等の可溶性パラジウム塩の形態にあるパラジウム触媒の存在下に加熱することによって行うことができる。その際、トリブチルホスフィンを用いることが好ましい。反応温度は、通常、80 ~ 100 であり、反応は、一般に、4時間~70時間で完結する。パラジウムは、一般式(1)の化合物に対して、1モル%ないし10モル%の割合で用いることが好ましい。また、トリブチルホスフィンは、パラジウム1当量に対して、3ないし4当量の割合で用いることが好ましい。反応終了後、反応混合物をフロリジル等を用いてろ過し、エーテル等で洗浄し、濃縮することにより所望の生成物を得ることができる。

【0021】

【実施例】以下本発明を実施例により説明するが、本発明はそれらに限定されるものではない。

【0022】実施例1~9

<一般式(3)の2-(1-アルキニル)アニリン化合

物の合成>上記既知の方法に従い、2-ヨードアニリン(50mmol)、PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>(1モル%; Ph=フェニル)、CuI(2モル%)およびトリエチルアミン(1.0M)からなる混合物に、アルゴン雰囲気下、室温で、一般式(4)の1-アルキン化合物(60ミリモル、1.2当量)を滴下した。この反応混合物を室温で16時間攪拌した後、約10mLになるまで溶媒を留去し、エーテルで抽出を行った。エーテル相を水と飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮した。シリカゲル-フラッシュカラムクロマトグラフィーにより目的化合物を得た。

【0023】<一般式(1)の化合物の合成>

上で合成した一般式(3)の化合物(10ミリモル)と前記式のアルデヒド化合物(10ミリモル)との混合物に加熱乾燥したモレキュラーシーブス4A(4g)および塩化メチレン(2mL)を加え、室温で攪拌した。プロトンNMRで反応を追跡し、12時間後に反応混合物をセライトを用いてろ過した。溶媒を留去し、下記表1に示す一般式(1)の化合物を定量的に得た。

【0024】<一般式(2)のインドール化合物の合成>

アルゴン雰囲気下で、Pd(OAc)<sub>2</sub>(0.05ミリモル)を1,4-ジオキサン(2.0mL)に溶解し、トリ-n-ブチルホスフィン(0.2ミリモル)を加えた。この溶液を、反応容器内に収容した一般式(1)の化合物(1.0ミリモル)に加え、100 で25時間、アルゴン雰囲気下で攪拌した。冷却後、反応混合物をフロリジルの短いパッドで濾過し、エーテルを流して触媒を除去した。濃縮後、臭化メチレン(0.712ミリモル)を内部標準としてプロトンNMRで収率を求めた。アルミナ充填フラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=20~10:1)により精製して目的化合物を得た。

【0025】結果を表1に示す。

【0026】

【表1】

表 1


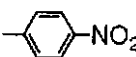


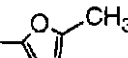
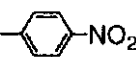
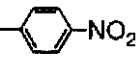
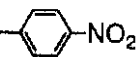
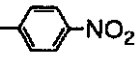
実施例	一般式(1)			一般式(2)	
	化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	化合物 収量(収率)
1	1a	Et	H		2a 58 (88%)
2	1b	Et	H		2b 70 (65%)
3	1c	Et	H		2c 64 (99%)
4	1d	Et	H		2d 70 (78%)
5	1e	Et	H		2e 63 (82%)
6	1f	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -			2f 71
7	1g	OTHP	H		2g 56 (61%)
8	1h	CH <sub>2</sub> OMOM	H		2h 55 (60%)
9	1i	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	H		2i 59 (73%)

表1において、Et=エチル;THP=テトラヒドロピラニル;MOM=メトキシメチル  
収量はmg

【0027】なお、化合物2f(実施例6)を製造する際の反応温度は80であった。

【0028】<化合物2a~2iの分析結果>化合物2a: <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 7.95-7.90 (m, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.50-7.46 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.34-7.27 (m, 1H), 7.24-7.14 (m, 3H), 6.60 (dt, 1H, J = 16.1, 1.4 Hz), 6.35 (dt, 1H, J = 15.9, 6.5 Hz), 2.31-2.20 (m, 2H), 1.10 (t, 3H, J = 7.4 Hz); <sup>13</sup>C NMR (75 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 136.2, 135.2, 132.8, 132.0, 128.6 (2C), 128.5 (2C), 127.7, 127.1, 122.5, 121.5, 120.5, 120.3, 111.8, 111.0, 26.9, 14.2; IR (neat, cm<sup>-1</sup>) 3402, 3056, 2963, 2931, 2872, 1635, 1603, 1489, 1456, 1373, 1315, 1243, 1073, 1028, 963, 908, 742, 698; HRMS C<sub>18</sub>H<sub>17</sub>Nの計算値: 247.1361. 実測値: 247.1349.

【0029】化合物2b: 固体(深紫色); mp =91-95; <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 8.27 (dt, 1H, J = 9.0, 2.2 Hz), 8.21 (brs, 1H), 7.91 (d, 1H, J = 7.9 Hz), 7.70 (dt, 2H, J = 9.0, 2.2 Hz), 7.39 (d, 1H, J = 7.9 Hz), 7.27 (ddd, 1H, J = 8.1, 7.0, 1.1 Hz), 7.20 (ddd, 1H, J = 8.1, 7.0, 1.1 Hz), 6.56 (dt, 1H, J = 15.9, 1.3 Hz), 6.40 (dt, 1H, J = 16.1, 6.3 Hz), 2.37-2.27 (m, 2H), 1.15 (t, 3H, J = 7.4 Hz); <sup>13</sup>C NMR (75 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 146.4, 139.2, 136.9, 134.9 (2C), 132.0, 128.4 (2C), 127.2, 124.1, 123.9, 120.9, 120.8, 120.6, 114.9, 111.2, 26.9, 14.0; IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) 3408, 3053, 2961, 2928, 2870, 1593, 153

5, 1506, 1450, 1340, 1246, 955, 858, 826, 741, 700; HRMSC<sub>18</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>の計算値: 292.1212. 実測値: 292.1215.

【0030】化合物2c: 固体(淡黄色); mp =166-170.5; <sup>1</sup>H NMR (MHz, CDCl<sub>3</sub>) 8.68 (dd, 2H, J = 4.6, 1.7 Hz), 8.40 (brs, 1H), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.52 (dd, 2H, J = 4.5, 1.7 Hz), 7.41 (dt, 1H, J = 7.9, 1.0 Hz), 7.28 (ddd, 1H, J = 8.1, 7.0, 1.3 Hz), 7.20 (ddd, 1H, J = 7.9, 7.1, 1.3 Hz), 6.63 (dt, 1H, J = 15.9, 1.5 Hz), 6.41 (dt, 1H, J = 15.9, 6.5 Hz), 2.39-2.28 (m, 2H), 1.16 (t, 3H, J = 7.4 Hz); <sup>13</sup>C NMR (75 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 149.7 (2C), 140.8, 137.1, 134.5, 131.4, 127.2, 123.6, 122.5 (2C), 120.9, 120.7, 120.5, 114.7, 111.4, 26.9, 14.0; IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) 3134, 3036, 2963, 2928, 2868, 1603, 1501, 1454, 1416, 1323, 1283, 1238, 1219, 999, 970, 827, 737, 669; HRMS C<sub>17</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>の計算値: 248.1313; 実測値: 248.1311.

【0031】化合物2d: <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 7.97 (brs, 1H), 7.85 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 7.33 (dd, 1H, J = 5.1, 1.1 Hz), 7.30-7.25 (m, 1H), 7.23-7.16 (m, 2H), 7.14 (dd, 1H, J = 7.0, 1.5 Hz), 7.09 (dd, 1H, J = 5.1, 3.7 Hz), 6.74 (dt, 1H, J = 15.9, 1.5 Hz), 6.39 (dt, 1H, J = 16.1, 6.5 Hz), 2.37-2.25 (m, 2H), 1.15 (t, 3H, J = 7.4 Hz); <sup>13</sup>C NMR (75 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 136.3, 134.4, 133.1, 129.0, 127.7, 127.2, 125.7, 125.6, 122.9, 121.2, 120.6, 120.5,

112.7, 110.8, 26.9, 14.0; IR (neat,  $\text{cm}^{-1}$ ) 3412, 3104, 3069, 3030, 2962, 2930, 2871, 1489, 1456, 1443, 1419, 1336, 1244, 1201, 964, 853, 742, 699; HRMS  $\text{C}_{16}\text{H}_{15}\text{NS}$ の計算値: 253.0939; 実測値 253.0925。

【0032】化合物 2 e:  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 8.28 (brs, 1H), 7.90-7.80 (m, 1H), 7.26-7.21 (m, 1H), 7.19-7.08 (m, 3H), 6.72 (dt, 1H,  $J = 16.1$ , 6.5 Hz), 6.50 (d, 1H,  $J = 3.1$  Hz), 6.37 (dt, 1H,  $J = 16.1$ , 6.5 Hz), 6.07 (dq, 1H,  $J = 3.3$ , 1.1 Hz), 2.38-2.26 (m, 2H), 2.32 (d, 3H,  $J = 0.6$  Hz), 1.15 (t, 3H,  $J = 7.4$  Hz);  $^{13}\text{C}$  NMR (75 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 151.6, 145.4, 135.9, 132.5, 127.0, 126.1, 122.5, 121.1, 120.3, 120.2, 110.78, 110.76, 108.8, 108.0, 26.9, 14.1, 13.5; IR (neat,  $\text{cm}^{-1}$ ) 3419, 3055, 2962, 2930, 2872, 1576, 1456, 1436, 1322, 1299, 1246, 1204, 1024, 965, 781, 741; HRMS  $\text{C}_{17}\text{H}_{17}\text{NO}$ の計算値: 251.1345; 実測値 251.1311。

【0033】化合物 2 f: 固体 (深紅); mp =159.5-161;  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 8.31-8.25 (m, 2H), 7.87-7.82 (m, 2H), 7.54 (brd, 1H,  $J = 7.7$  Hz), 7.41 (brd, 1H,  $J = 8.1$  Hz), 7.27 (ddd, 1H,  $J = 7.9$ , 7.1, 1.3 Hz), 7.16 (td, 1H,  $J = 7.5$ , 1.1 Hz), 6.22 (s, 1), 2.39 (brt, 2H,  $J = 5.6$  Hz), 2.04 (brt, 2H,  $J = 6.0$  Hz), 1.75-1.65 (m, 2H), 1.65-1.53 (m, 2H), 1.44-1.34 (m, 2H);  $^{13}\text{C}$  NMR (75 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 146.3, 146.0, 139.7, 136.5, 131.0, 129.1, 127.0 (2C), 124.1 (2C), 123.8, 120.8, 120.3, 115.2, 112.9, 111.1, 37.0, 30.7, 28.6, 27.5, 26.5; IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) 3402, 3057, 2924, 2851, 1709, 1595, 1535, 1506, 1448, 1340, 1259, 1236, 1111, 1042, 851, 737; HRMS  $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2$ の計算値: 332.1525; 実測値: 332.1533。

【0034】化合物 2 g: (E) - および (Z) - 異性体の分離し得ない混合物 (E:Z=4:1,  $^1\text{H}$  NMRで測定); 固体 (深紅); mp =77-79; (E) - 異性体の選択された  $^1\text{H}$  NMR シグナル (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 8.52 (brs, 1H), 8.14 (brd, 2H,  $J = 9.0$  Hz), 7.64 (brd, 2H,  $J = 9.0$  Hz), 7.12 (d, 1H,  $J = 12.6$  Hz), 6.25 (d, 1H,  $J = 12.6$  Hz), 5.10 (t, 1H,  $J = 3.1$  Hz), 3.95 (ddd, 1H,  $J = 11.4$ , 9.0, 3.1 Hz), 3.69-3.61 (m, 1H); (Z) - 異性体の選択された  $^1\text{H}$  NMR シグナル (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 8.54 (brs, 1H), 8.14 (brd, 2H,  $J = 9.0$  Hz), 7.69 (brd, 2H,  $J = 9.0$  Hz), 6.53 (d, 1H,  $J = 7.0$  Hz), 5.59 (d, 1H,  $J = 6.9$  Hz), 4.98 (brt, 1H), 3.79-3.60 (m, 1H), 3.58-3.50 (m, 1H); IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) 3391, 3061, 2943, 2853, 1707, 1657, 1595, 1514, 1454, 1342, 1111, 1030, 964, 903, 856, 814, 743, 698; HRMS  $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4$ の計算値: 364.1423; 実測値: 364.1416。

【0035】化合物 2 h: 固体 (オレンジ); mp =117.5-119;  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 8.47 (brs, 1H), 8.26-8.23 (m, 2H), 7.92 (d, 1H,  $J = 8.0$  Hz), 7.69-7.64 (m, 2H), 7.41 (d, 1H,  $J = 7.7$  Hz), 7.28 (ddd, 1H,  $J = 8.0$ , 7.0, 1.3 Hz), 7.21 (ddd, 1H,  $J = 7.9$ , 7.1, 1.3 Hz), 6.80 (dt, 1H,  $J = 15.9$ , 1.3 Hz), 6.45 (dt, 1H,  $J = 15.9$ , 6.2 Hz), 4.75 (s, 2H), 4.30 (dd, 2H,  $J = 6.2$ , 1.3 Hz), 3.43 (s, 3H);  $^{13}\text{C}$  NMR (75 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 146.8, 138.7, 136.8, 133.6, 128.8 (2C), 126.9, 126.6, 125.0, 124.1 (2C), 124.0, 121.2, 120.8, 113.4, 111.3, 95.6, 68.8, 55.3; IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) 3342, 3055, 2937, 2885, 2853, 1597, 1512, 1335, 1261, 1142, 1111, 1040, 891, 854, 741; HRMS  $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_4$ の計算値: 338.1266; 実測値: 338.1271。

【0036】化合物 2 i: 固体 (オレンジ); mp =115.5-118.5;  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 8.57 (brs, 1H), 8.25-8.19 (m, 2H), 7.84 (d, 1H,  $J = 7.7$  Hz), 7.68-7.63 (m, 2H), 7.38 (d, 1H,  $J = 7.9$  Hz), 7.25 (ddd, 1H,  $J = 8.0$ , 7.0, 1.1 Hz), 7.17 (ddd, 1H,  $J = 7.9$ , 7.1, 1.1 Hz), 6.60 (d, 1H,  $J = 15.9$  Hz), 6.31 (dt, 1H,  $J = 15.9$ , 6.4 Hz), 4.16 (q, 2H,  $J = 7.1$  Hz), 2.65-2.50 (m, 4H), 1.25 (t, 3H,  $J = 7.1$  Hz);  $^{13}\text{C}$  NMR (75 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 173.2, 146.4, 139.0, 136.9, 132.4, 130.2, 128.4 (2C), 127.0, 124.0 (2C), 123.8, 123.0, 120.8, 120.7, 114.2, 111.3, 60.5, 34.3, 29.1, 14.2; IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) 3364, 2984, 2930, 2905, 2849, 1703, 1595, 1512, 1448, 1339, 1313, 1258, 1198, 1165, 1111, 1026, 858, 754; HRMS  $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4$ の計算値: 364.1423; 実測値: 364.1393。

【0037】化合物 2 j:  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 7.88 (brs, 1H), 7.86-7.80 (m, 1H), 7.27-7.21 (m, 1H), 7.14-7.10 (m, 2H), 6.54 (d, 1H,  $J = 15.9$  Hz), 6.19 (dt, 1H,  $J = 15.9$ , 6.5 Hz), 3.01-2.89 (m, 4H), 2.29 (quintet, 2H,  $J = 7.1$  Hz), 1.99-1.71 (m, 6H), 1.46-1.33 (m, 4H), 1.13 (t, 3H,  $J = 7.4$  Hz);  $^{13}\text{C}$  NMR (75 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 141.5, 135.3, 129.7, 126.7, 121.1, 120.8, 119.8, 119.7, 110.5, 109.0, 35.6, 32.8 (2C), 27.1, 26.5 (2C), 26.0, 14.5; IR (neat,  $\text{cm}^{-1}$ ) 3418, 3055, 3030, 2928, 2853, 1638, 1541, 1487, 1462, 1342, 1294, 1246, 959, 908, 739, 665, 648; HRMS  $\text{C}_{18}\text{H}_{23}\text{N}$ の計算値: 253.1830; 実測値: 253.1836。

【0038】

【発明の効果】以上述べたように、本発明によれば、アルケニル置換インドール化合物を簡便な方法で合成することができる。

## フロントページの続き

(51) Int.Cl.7	識別記号	F I	
C 0 7 D 401/04		C 0 7 D 401/04	
405/04		405/04	
405/12		405/12	
409/04		409/04	
// C 0 7 B 61/00	3 0 0	C 0 7 B 61/00	3 0 0

## (58)調査した分野(Int.Cl.7, D B名)

C07D 209/08  
 C07D 209/10  
 C07D 209/12  
 C07D 209/18  
 C07D 401/04  
 C07D 405/04  
 C07D 405/12  
 C07D 409/04  
 C A ( S T N )  
 R E G I S T R Y ( S T N )