

N-ARYLATION OF INDOLE CATALYZED BY COPPER-DIIMINE COMPLEXES AND COPPER NANOPARTICLES

ATITIYA SUKSAKET 5036521 SCAI/M

M.Sc.(APPLIED ANALYTICAL AND INORGANIC CHEMISTRY)

THESIS ADVISORY COMMITTEE: EKASITH SOMSOOK, Ph.D. (CHEMISTRY),
KHAMPHEE PHOMPHRAI, Ph.D.(CHEMISTRY), LAKSAMEE
CHAICHAROENWIMOLKUL, Ph.D. (INORGANIC CHEMISTRY)**ABSTRACT**

N-arylation of indoles are an important class of compounds because of the significant pharmacological, biological, and chemical activities and their presence in bioactive natural products. Beside their biological activity, they are also used as synthetic intermediates for the preparation of other biologically active compounds. The example of indole derivative is indole-3-carbinol extracted from broccoli or cabbage. Indole-3-carbinol is used for chemo preventive, anticancer such as breast cancer, and antitumor. Much attention has been focused on these heterocycles and various synthetic strategies have been developed for the *N*- arylation of indoles and other heterocycles. Herein, studied the *N*-arylation of indole is catalyzed by using CuI/diimine (**1–6**) as a catalyst and iodobenzene as substrate. The results exhibited good catalytic activity with %yield of C–N coupling, %yield of this reaction of approximately 40–80%. In addition, the ratio of indole: iodobenzene of 1:1.5 gave good rate of reaction and yield. Moreover, the study of different substituents revealed that the methoxy group as donating group has higher rate of reaction and %yield of C–N coupling than the nitro group as withdrawing group. The position of substituent had the similar trend where both methoxy and nitro group gave *-ortho* > *-meta* > *-para*. Moreover, copper nanoparticles was used as a catalyst in *N*-arylation of indole. The copper nanoparticles was more efficient than CuI/diimine system.

KEY WORDS: *N*-ARYLATION/ INDOLE/ DIIMINE LIGANDS/ COPPER NANOPARTICLES

88 pages

ปฏิกิริยา เอ็น-แอริลเลชัน ของอินโดล ที่เร่งปฏิกิริยาโดยสารเชิงซ้อนระหว่าง คอปเปอร์กับไดอิมินลิแกนด์และอนุภาคนาโนของคอปเปอร์

N-ARYLATION OF INDOLE CATALYZED BY COPPER-DIIMINE COMPLEXES AND COPPER NANOPARTICLES

อาทิตยา สุขสะเกษ 5036521 SCAI/M

วท.ม.(เคมีวิเคราะห์และเคมีอินทรีย์ประยุกต์)

คณะกรรมการที่ปรึกษาวิทยานิพนธ์: เอกสิทธิ์ สมสุข, Ph.D.(Chemistry), คัมภีร์ พรหมพราย, Ph.D.(Chemistry),
ลักขมิ ชัยเจริญวิมลกุล, ปร.ค.(เคมีอินทรีย์)

บทคัดย่อ

ปฏิกิริยา เอ็น-แอริลเลชัน ของอินโดล เป็นปฏิกิริยาที่มีความสำคัญและถูกนำไปใช้ในหลากหลายด้าน เช่น ด้านเภสัชกรรม ด้านชีวภาพและเคมีรวมไปถึงด้านผลผลิตที่ได้จากธรรมชาติ ตัวอย่างอนุพันธ์ของอินโดลที่สำคัญเช่น อินโดล-3-คาร์บินอล เป็นสารอนุพันธ์ของอินโดลที่สกัดได้จากบลอกคอร์หรือกะหล่ำปลี ซึ่งสารอินโดล-3-คาร์บินอลนี้ถูกนำไปใช้เป็นสารต้านการเกิดเนื้องอก ด้านการเกิดมะเร็ง โดยเฉพาะมะเร็งเต้านม เป็นต้น นอกจากนี้ ปฏิกิริยา เอ็น-แอริลเลชัน ของอินโดลยังเป็นวิธีสังเคราะห์สารตัวกลางเพื่อเตรียมเป็นสารตั้งต้นของสารประกอบทางชีวภาพ อื่น ๆ ได้อีกด้วย การทดลองเบื้องต้นพบว่าไดอิมินลิแกนด์(1–6)สามารถเร่งปฏิกิริยาการเข้าสู่ของคาร์บอนและไนโตรเจนได้ โดยร้อยละผลผลิตอยู่ในช่วง 40–80 โดยศึกษาอัตราส่วนระหว่างอินโดลต่อไอโอโดเบนซีน พบว่า อัตราส่วน 1:1.5 เป็นอัตราส่วนที่เหมาะสมต่อการทำปฏิกิริยา จึงใช้อัตราส่วนนี้ในการศึกษาในงานวิจัยนี้ นอกจากนี้ยังได้ศึกษาความแตกต่างของตำแหน่งและหมู่แทนที่พบว่าหมู่แทนที่ที่เป็นหมู่ให้อิเลคตรอน (กลุ่มเมทอกซี) ให้อัตราผลผลิตและอัตราการเกิดปฏิกิริยาที่ดีกว่าหมู่ดึงอิเลคตรอน (กลุ่มไนโตร) และพบว่าตำแหน่งของหมู่แทนที่ทั้งหมู่ให้อิเลคตรอนและหมู่ดึงอิเลคตรอนมีแนวโน้มเดียวกัน *-ortho > -meta > -para* นอกจากนี้ยังพบว่าอนุภาคนาโนของคอปเปอร์ก็สามารถใช้เป็นตัวเร่งปฏิกิริยาการเข้าสู่ของคาร์บอนและไนโตรเจนได้ โดยอนุภาคนาโนของคอปเปอร์มีประสิทธิภาพสูงกว่าสารประกอบคอปเปอร์ไดอิมิน