

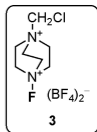
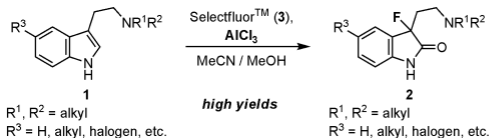
31V-pm12

N,N-ジアルキルトリプタミンの直接フッ素化による 3-フルオロオキシインドールの合成

○関 孝行¹, 藤原 朋也¹, 竹内 義雄¹(¹富山大院薬)

【目的】当研究室では、種々のインドール類から直接 3-フルオロオキシインドールを得る反応の開発を行ってきた。今回、上記反応をセロトニン受容体のリガンドである *N,N*-ジアルキルトリプタミン類 **1** に適用し、対応する 3-フルオロオキシインドール **2** の合成を試みる。

【実験・結果】*N,N*-ジメチルトリプタミン (**1a**, $R^1, R^2 = \text{Me}$; $R^3 = \text{H}$) について、文献記載の条件,¹⁾ すなわち MeCN (or MeOH) / H₂O 中、Selectfluor™ (**3**) によりフッ素化を試みた。しかしながら、対応する 3-フルオロオキシインドール **2a** は殆ど得られなかった。この原因はインドール側鎖の窒素原子の求核性が高いためと考えられた。そこで、これを解決することを目的として、種々のルイス酸存在下での **1a** のフッ素化を試みた結果、MeCN/MeOH 中、AlCl₃ 存在下でフッ素化を行うことにより、**2a** を高収率で得ることに成功した。本反応の基質一般性を調べるべく、種々の **1** を用いて反応を検討したところ、いずれの場合も高収率で対応する 3-フルオロオキシインドール **2** が得られた。



1) Fujiwara, T. et al. *J. Fluorine Chem.* **2008**, *129*, 829.