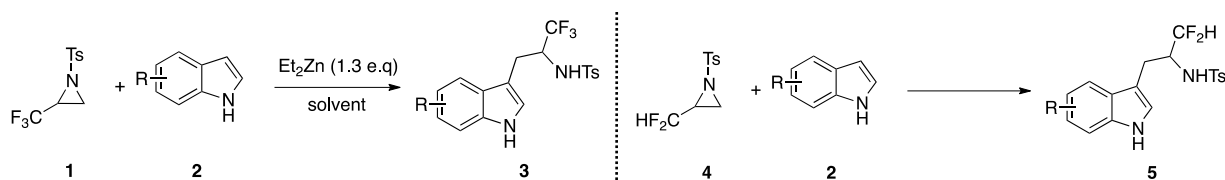


2-CF₂H-N-Ts アジリジンを用いた β-CF₂H-トリプタミン誘導体の簡便合成 Easy access to β-CF₂H-tryptamine analogues using 2-CF₂H-N-Ts-aziridine

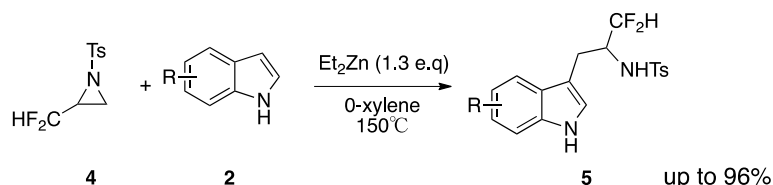
黒里郁仁、石川卓也、山田泰教、花本猛士（佐賀大院工）

フッ素を有機化合物の特定部位に導入するとフッ素の最も高い電気陰性度、水素に次いで小さいファンデルワールス半径、C-F 結合は C-H 結合より強力な結合を作る特徴に起因して化合物の物性や生理活性が著しく変化することが知られている。このように医薬品や機能性材料に広く用いられているため、含フッ素有機化合物の合成は重要なテーマである。

フッ素置換基としてはトリフルオロメチル基の導入が最も多い。しかし、トリフルオロメチル基の代わりにジフルオロメチル基を導入する合成研究の例は少なく、その簡便な合成法には興味を持たれる。既に当研究室では CF₃-N-Ts アジリジン **1** とインドール誘導体 **2** よりトリフルオロメチル基を有する β-トリプタミン骨格 **3** の合成に成功している。また最近、CF₂H-N-Ts アジリジン **4** の合成に成功したことから、対応するジフルオロメチル基を有する β-トリプタミン骨格 **5** の合成を検討した。



トリフルオロメチル基を有する β-トリプタミン骨格 **3** の反応条件を参考にして、CF₂H-N-Ts アジリジン **4** とインドール **2** の反応を行ったところ、目的の β-トリプタミン骨格 **5** を非常に高い収率で得ることに成功した。最適条件が得られたので基質の適用範囲を検討した。インドール環上の置換基によっては未反応の基質が存在するものの、幅広い基質で反応が進行し、目的の CF₂H トリプタミン誘導体を与えた。



また、インドール **2** に対する 2 つのアジリジン **4,5** の反応性について比較検討を行ったところ、両者の間に著しい差は見られなかった。

<参考文献>

1) F. Kurosato, T. Ishikawa, Y. Yamada, T. Hanamoto, *Synlett*, **2015**, *26*, 1827.

発表者紹介

氏名 黒里 郁仁 (くろさと ふみひろ)
所属 佐賀大学大学院工学系研究科
循環物質化学専攻
学年 博士前期課程 2 年
研究室 反応化学研究室 (花本研究室)

