

γ-トリフルオロメチルケトンの合成法の開発

(山口大院創成科学) ○川端崇裕・川本拓治・上村明男

Synthesis of γ-trifluoromethylated ketones (*Yamaguchi University*)

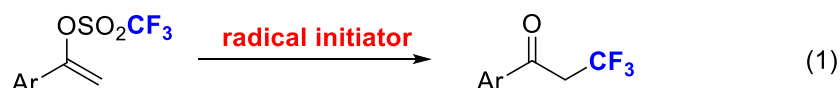
○Takahiro Kawabata, Takuji Kawamoto, Akio Kamimura

Recently, we have reported trifluoromethylation of vinyl triflates to give α-trifluoromethyl ketones. The reaction proceeds via an intermolecular radical mechanism. The generated trifluoromethyl radical adds to the vinyl triflate, followed by β-cleavage to give the product. In this work, we report synthesis of γ-trifluoromethyl ketone from vinyl triflates in the presence of olefins.

Keywords : radical reaction, vinyl triflate, intermolecular reaction

有機分子にフッ素原子を導入すると、フッ素の特異的な性質により薬理効果が発現もしくは増強する。さらに、生体内での吸収輸送など体内動態の改善などが期待できる。特異性の発現のためには分子の特定の位置への含フッ素置換基の導入が鍵となっている。最近、当研究室ではビニルトリフラーに対してラジカル開始剤を作用させるとトリフラーの CF₃ 部位が形式的に転位し、α-トリフルオロメチルケトンが得られることを報告している (式 1)¹。この反応ではビニルトリフラーに対し、ラジカル開始剤を作用させることでトリフルオロメチルラジカルが生成する。このトリフルオロメチルラジカルがビニルトリフラーへ付加、続く β 開裂により生成物を与える。本研究では、この手法をオレフィン共存下へと展開することでトリフルオロメチルラジカルがオレフィンに付加し、生じたアルキルラジカルがビニルトリフラーに付加することで γ-トリフルオロメチルケトンが得られることを見いだした (式 2)。

Our Previous work



This work



Reference

- ¹ Kawamoto, T.; Sasaki, R.; Kamimura, A. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2017**, 55, 1342.