

トリフルオロメチルアルキンとプロパルギルアルコールの付加環化

(群馬大院理工) ○石坂 美優紀・杉石 露佳・網井 秀樹

Addition-Cyclization of Trifluoromethyl alkynes and Propargylic Alcohols (*Graduate School of Science and Technology, Gunma University*) ○Miyuki Ishizaka, Tsuyuka Sugiishi, Hideki Amii

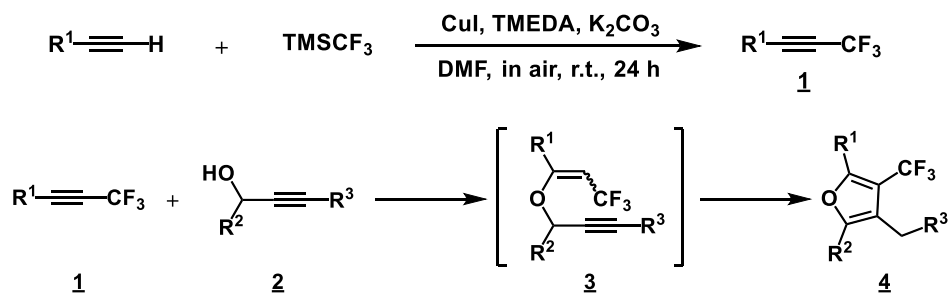
The fluorine atoms in the organofluorine compounds might bring the effects on the bioactivity, and many bioactive compounds contain heterocycles, therefore fluorine-containing heterocyclic compounds are expected to be applied to the design of medicines and pesticides. In this presentation, we report the synthesis of fluorine-containing heterocyclic compounds using trifluoromethyl alkynes **1** and propargylic alcohols **2**. Trifluoromethylated furans **4** would be generated through the addition of propargylic alcohols **2** to trifluoromethyl alkynes **1** followed by Intramolecular cyclization of intermediates **3**.

We surveyed the reaction conditions, especially the additives, in the synthesis of trifluoromethylated furans **4** with trifluoromethyl alkynes **1** having various substituents R¹ and propargylic alcohols **2**.

Keywords : Fluorine; Trifluoromethyl Alkyne; Propargyl Alcohol; Addition-Cyclization; Furan

含フッ素有機化合物はフッ素原子の特異性が生体内で発揮されて生理活性を示す可能性があり、また、ヘテロ環骨格は生理活性化合物に多く見られることから、両者を持つ化合物は医農薬への応用が期待される。本発表では、トリフルオロメチルアルキンとプロパルギルアルコールを用いた含フッ素ヘテロ環化合物合成を報告する。この合成では、トリフルオロメチルアルキン **1** へのプロパルギルアルコール **2** の付加反応と、これに続く中間体 **3** の分子内環化が進行することでトリフルオロメチルフラン **4** が生成すると考えられる。

様々な置換基 R¹ を有するトリフルオロメチルアルキン **1** を合成し¹⁾、アルキン **1** とプロパルギルアルコール **2** を用いたトリフルオロメチルフラン **4** の合成において、添加剤を始めとする反応条件の検討を行った。



1) C. Tresse, C. Guissart, S. Schweizer, Y. Bouhoute, A. C. Chany, M. L. Goddard, N. Blanchard, G. Evano, *Adv. Synth. Catal.* **2014**, 356, 2051.