炭素-フッ素結合の切断を経るフルオレン合成法の開発

(東理大先進工)○濱田 修輔・吉田 優

Synthesis of Fluorenes via Cleavage of Carbon–Fluorine Bond (*Tokyo University of Science*) Shusuke Hamada, Suguru Yoshida

Fluorenes are useful as bioactive compounds and intermediates for fluorescent molecules. Conventionally, they have been synthesized by cyclization of carboxylic acids. Despite their importance, it is not easy to synthesize fluorenes with a variety of functional groups. In this study, we demonstrate that fluorenes can be efficiently synthesized through the activation of carbon–fluorine bond. Specifically, a variety of fluorenes were easily synthesized by the treatment of 2–(trifluoromethyl)biaryls with trifluorometasulfonic acid (TfOH) in 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propanol (HFIP). In addition, we succeeded in the synthesis of various xanthones under the TfOH–promoted conditions.

Keywords : Fluorenes; Xanthones; C–F bond activation; Electrophilic aromatic substitutions; Cyclization

フルオレン類は、生物活性化合物や蛍光分子の中間体などとして有用である。従来は、カルボン酸の環化などによって合成されていたが、多彩な官能基を有するフルオレン類の合成は容易ではない。これに対して今回我々は、強固なトリフルオロメチル基の炭素ーフッ素結合の活性化を経て、分子内環化によってフルオレン類を効率的に合成できることを明らかにした。具体的には、1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロ-2-プロパノール(HFIP)中で、2-(トリフルオロメチル)ビアリールに対してトリフルオロメタスルホン酸(TfOH)を作用させることで、多様なフルオレン類を合成できた。本手法によって、幅広いキサントン類の合成にも成功した。

$$(HO)_{2}B$$

$$R = \begin{pmatrix} CF_{3} \\ HO \end{pmatrix}$$

$$R = \begin{pmatrix} CF$$