

官能基を有するトリフルオロメチルイソベンゾフランを利用した Diels-Alder 反応

(群馬大院理工) ○近藤 広崇・帆足 享矢・杉石 露佳・網井 秀樹

Diels-Alder reaction of trifluoromethylated isobenzofurans bearing functional groups

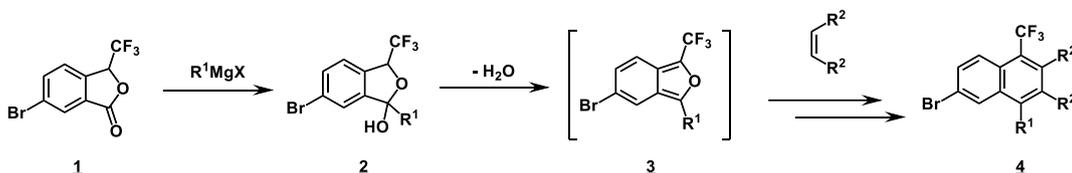
(Graduate School of Science and Technology, Gunma University) ○Hiroataka Kondo, Kyoya Hoashi, Tsuyuka Sugiishi, Hideki Amii

Since isobenzofuran has an *o*-quinodimethane structure, it acts as a highly active diene in the Diels-Alder reaction. Herein, we present [4+2] cycloaddition of trifluoromethylated isobenzofurans having functional groups with various alkenes. Isobenzofuran precursor **2** was prepared by introducing a substituent such as phenyl group into the ester moiety of 3-trifluoromethylphthalide **1** having bromo group at position 6. Upon treatment with *p*-TsOH · H₂O and dienophiles, Diels-Alder reaction of isobenzofuran precursor **2** proceeded smoothly to give the corresponding adducts **4** in good yields. We will discuss about the substrate scope of trifluoromethylated isobenzofurans **3** endowed with functional groups.

Keywords : Fluorine; Trifluoromethylated group; Isobenzofuran; Diels-Alder reaction; Naphthalene

イソベンゾフランは分子内に *o*-キノジメタン構造を有するため、Diels-Alder 反応における高活性ジエンとして働く。一方で、芳香族性を失い不安定であるという性質から、一般的にはイソベンゾフランの単離は困難である。今回、ベンゼン環上に官能基を有するトリフルオロメチルイソベンゾフランを利用した Diels-Alder 反応より、多様なナフタレン誘導体の合成を行った。

6 位にブロモ基を有する 3-トリフルオロメチルфтаリド **1**¹⁾ に対し、エステル部位にフェニル基やチエニル基などの置換基を導入し、イソベンゾフラン前駆体 **2** を合成した。続いて、*p*-トルエンスルホン酸一水和物を用いる酸触媒脱水反応により、トリフルオロメチルイソベンゾフラン **3** を系中で発生させた。その後、イソベンゾフランに対し、様々なジエノフィルとの環化付加反応とそれに続く脱水反応により、ナフタレン誘導体の合成を行い、良好な収率でナフタレン誘導体 **4** が得られた。本発表では、Diels-Alder 反応におけるトリフルオロメチルイソベンゾフラン **3** の適用範囲について述べる予定である。



1) M. Inaba, T. Sakai, S. Shinada, T. Sugiishi, Y. Nishina, N. Shibata, H. Amii, *Beilstein J. Org. Chem.* **2018**, *14*, 182.