

プロパルギルアミドを用いた含フッ素ヘテロ環化合物の合成

(群馬大院理工) ○茂木 稜平・杉石 露佳・網井 秀樹

Synthesis of fluorine-containing heterocyclic compounds using propargylamides (¹*Graduate School of Science and Technology, Gunma University*) ○Ryohei Motegi, Tsuyuka Sugiishi, Hideki Amii

Because of the unique properties of fluorine atoms, organic fluorine compounds have been applied to various medicines and pesticides. On the other hand, there are many bioactive natural products and synthetic pharmaceuticals having heterocyclic structures. Therefore, we focused on the synthesis of fluolinated oxazoles. Oxazoles **2** bearing perfluoroalkyl groups at the C-2 positions were synthesized by intramolecular cyclization of propargylic amides **1**, which were prepared from primary amines by perfluoroacylation with perfluorocarboxylic anhydrides. When propargylic amide **1** having a trifluoromethyl group was stirred in DMSO at 140 °C in the presence of 2 equivalents of base, the desired oxazole **2** was obtained in high yield. Furthermore, the synthesis of the oxazoles with pentafluoroethyl groups will be studied and reported in this presentation.

Keywords : Fluorine; Propargylamide; Oxazole; Perfluoroalkyl groups; Intramolecular cyclization

フッ素原子の特異的な性質によって、有機フッ素化合物は様々な医薬や農薬に応用されており、広く研究されている。一方で、ヘテロ環骨格は天然物や医薬品など、生物活性化合物の分子構造内によく見られる。そのため、近年、当研究室では含フッ素ヘテロ環化合物合成の研究を進めてきた。今回、我々はプロパルギルアミド **1** からの含フッ素オキサゾール **2** 骨格形成反応について報告する。本反応では、プロパルギルアミンにペルフルオロアシル基を導入し、これを分子内環化させることによって C-2 位にペルフルオロアルキル基(-R_f)を有するオキサゾール化合物 **2** を合成した。

まず、トリフルオロメチル基を有するプロパルギルアミド **1** を DMSO 溶媒中、塩基性条件で加熱し、目的のオキサゾール **2** が得られることを確認した。そして、反応条件の最適化を行ったところ、2 当量の炭酸カリウム存在下、140 °Cにて反応させることで、目的のオキサゾール **2** が高収率で得られることがわかった。さらに、ペンタフルオロエチル基を有するプロパルギルアミドからのオキサゾール合成についても検討した。

