2,2-ジフルオロシクロプロピルラジカルの発生と反応

(群馬大院理工) ○中嶋 柚稀・内藤 一樹・杉石 露佳・網井 秀樹 Generation and Reactions of 2,2-Difluorocyclopropyl Radicals (*Graduate School of Science and Technology, Gunma University*) ○Yuzuki Nakajima, Kazuki Naito, Tsuyuka Sugiishi, Hideki Amii

The introduction of cyclopropyl groups is increasing in the development of drug candidate compounds, and we paid a great attention to difluorocyclopropanes. In order to introduce the fluoroalkyl units (R_f), we focus on radical addition of R_f -CH₂-X. In the present study, we used bromodifluorocyclopropanes for the radical addition to alkenes. In fact, radical addition reactions of bromodifluorocyclopropanes with various alkenes were carried out. When 1,1-diphenylethylene was used as the alkene upon treatment with sodium dithionite, $\underline{1}$ (24% yield) and $\underline{2}$ (24% yield) were obtained, and when AIBN was used as the radical initiator, $\underline{1}$ was obtained in 62% yield as a sole product.

Keywords: fluorine, difluorocyclopropane, radical addition, carbon-carbon bond formation

医薬品候補化合物の開発においてシクロプロパン骨格を有するものが増加しており、ジフルオロシクロプロパン化合物にはさらなる薬理活性が期待される。そこで本研究では、ペルフルオロアルキル基とハロゲン原子の間にメチレン基を有する化合物としてブロモジフルオロシクロプロパンに着眼し、そして、当該化合物とアルケンとのラジカル付加反応を行った。

1-フェニル-1-ブロモジフルオロシクロプロパンと種々のアルケンとのラジカル付加反応を行った。アルケンとして 1,1-ジフェニルエチレンを用い、ラジカル開始剤 として亜ジチオン酸ナトリウムを用いた場合は 1 (24%収率)と 2 (24%収率)が得られ、ラジカル開始剤を AIBN とした場合は 1 のみが 62%収率で得られた。