

スチレンの光触媒による二量化およびトリフルオロメチル化反応

(山口大院) ○井西 司、西形 孝司

Photocatalytic dimerization and trifluoromethylation of styrene

○Tukasa Inishi, Takashi Nishikata

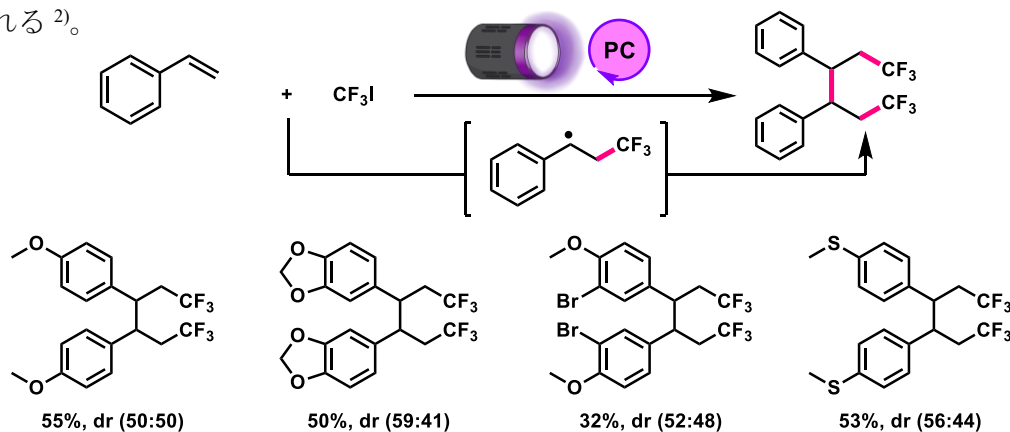
The introduction of trifluoromethyl groups into a molecule can change its metabolic stability, lipid solubility, and basicity in vivo. Therefore, the development of methods to introduce trifluoromethyl groups is an important research theme in the development of pharmaceuticals and agrochemicals. CF_3I is an inexpensive CF_3 source, but being a gas, it is difficult to handle and therefore requires the use of expensive reactants such as Togni reagents.

In the present study, using CF_3I solution, the corresponding 1,4- CF_3 ylated products were successfully obtained via radical trifluoromethylation/dimerization reactions with styrene in the presence of photocatalysts; there are few reactions that allow multiple introduction of CF_3 groups in a single reaction, and various double trifluoromethylations were realized in this study. The obtained compound is a non-steroidal estrogen and is expected to have pharmaceutical applications.

Keywords : Trifluoromethylation; Photocatalyst;; Dimerization

分子に対してトリフルオロメチル基を導入することで生体内での代謝安定性や脂溶性・塩基性を変化させることができる。そのためトリフルオロメチル基の導入法の開発は医薬品や農薬の開発において重要な研究テーマである。 CF_3I は安価な CF_3 化試薬であるが、ガスであるため扱いが難しい。そのため、 CF_3 化反応では、Togni 試薬など高価な反応剤を代替として使う必要がある¹⁾。

本研究では、 CF_3I 溶液を用いると、光触媒存在下スチレンとのラジカル的 CF_3 化/二量化反応を経て、対応する 1,4- CF_3 化生成物を得ることに成功した。 CF_3 基を一度の反応で複数導入できる反応はほとんどなく、本研究により様々な二重 CF_3 化が実現した。得られた化合物は非ステロイド性エストロゲンであり医薬品への応用が期待される²⁾。



1) Eisenberger, P.; Gischig, S.; Togni, A. *Chem. Eur. J.* **2006**, *12*, 2579

2) Chung, K. R.; Kun, C.; Louis, A. L.; Kenneth S. K. *B. Med. Chem. Lett.* **1995**, *5*, 133-138