

フッ素化ラクトンの合成を目指したアリールジフルオロ酢酸類の変換反応

(群馬大院理工¹) ○田中 みどり¹・杉石 露佳¹・網井 秀樹¹

Transformations of 2-aryldifluoroacetates for the synthesis of fluorolactones

(¹Graduate School of Science and Technology, Gunma University) ○Midori Tanaka¹, Tsuyuka Sugiishi¹, Hideki Amii¹

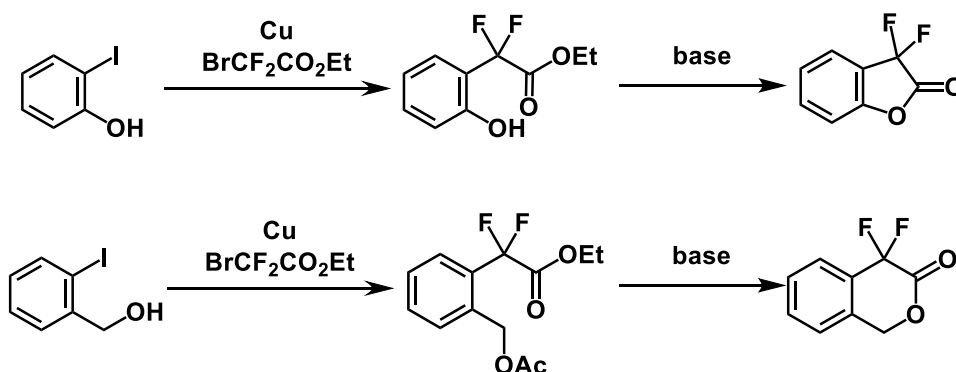
Organic compounds containing difluoromethylene groups are utilized in the design of biologically active molecules, including drug discovery, due to their unique steric and electronic properties. This study aims to develop new synthetic blocks and use them to synthesize fluorinated lactones. Additionally, efforts focus on synthesizing fluorine-containing organic compounds with five- and six-membered rings and examining the reaction behaviors from the viewpoint of the steric hindrance by fluorine substituents.

Actually, aryldifluoroacetate was obtained by cross-coupling of 2-iodobenzene with ethyl bromodifluoroacetate. Subsequently, we aimed to synthesize 3,3-difluoro-2-coumaranone by the lactonization of the obtained substance. Similarly, cross-coupling was performed for 2-iodobenzyl alcohol, and the reduction reaction was examined with the aim of cyclization.

Keywords : Fluorine; Difluoromethylene group; Lactone; Cross-coupling

ジフルオロメチレン基を有する有機化合物は、立体的な性質と極性から、創薬などの生理活性分子の設計に用いられる。本研究では、ジフルオロメチレン基を有する新たな合成ブロックの開発と、それを用いたフッ素化ラクトンの合成を目的としている。併せて、6員環を有する含フッ素有機化合物の生成に取り組み、フッ素置換基が与える立体障害について考察を行う。

2-ヨードベンゼンに対しクロスカップリングを行うことでアリールジフルオロ酢酸エチルを得ることができた。続いて、得られた化合物のラクトン化により、3,3-ジフルオロ-2-クマランンの合成を目指した。同様に 2-ヨードベンジルアルコールに対してクロスカップリングを行い、環化を目指して検討を行った。



1) K. Sato, M. Omote, A. Ando, I. Kumadaki, *J. Fluorine Chem.* **2004**, *125*, 509-515.