



**BF₃ · OEt₂ による形式的な[3+2]環化付加を介した
4-モノフルオロメチル-1,3-オキサゾリジンの合成
Access to 4-Monofluoromethyl-1,3-Oxazolidines via a Formal
[3+2] Cycloaddition Triggered by BF₃ · OEt₂**

佐藤慧一、山田泰教、花本猛士（佐賀大院理工）

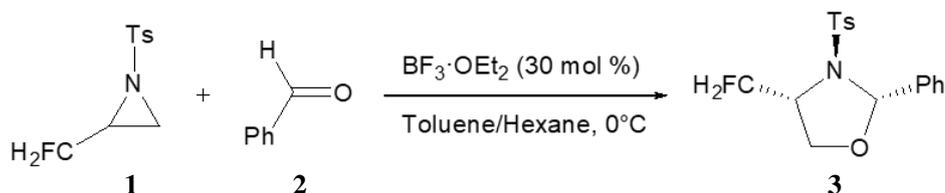
有機分子中の特定の位置にフッ素を導入する研究は活発である。この背景には、既存分子の部分フッ素化による物理活性や生理活性の向上による、新たな医薬品の開発への期待感が反映されている。そのため含フッ素有機化合物の簡便な合成法の開発は極めて重要なものとなっている。

当研究室では、ビルディングブロック法を用いた含フッ素有機化合物の合成を行っている。これまでに 2-CF₃-ならびに、2-CF₂H-*N*-トシルアジリジンとアルデヒドの[3+2]環化付加反応をそれぞれ報告している。



しかし 2-CFH₂-*N*-トシルアジリジンとアルデヒドの[3+2]環化付加反応は未報告である。今回、従来の反応条件を参考に、2-CFH₂-*N*-トシルアジリジンと様々なアルデヒドの[3+2]環化付加反応を検討した。最終的には、ルイス酸に BF₃ · OEt₂、溶媒にヘキサン/トルエンの混合溶媒を用い、0°Cで反応させることで、対応する CFH₂基をもつオキサゾリジン **3** を比較的高い異性体比で合成することに成功した。

最適条件を用い 2-CFH₂-*N*-トシルアジリジン **1** と様々なアルデヒドを反応させることでそれぞれ対応する CFH₂基を持つオキサゾリジンを合成することに成功した。



<参考文献>

- 1) K. Sato, Y. Yamada, T. Hanamoto, *Journal of Fluorine Chemistry*. 237, 109599 (2020).
- 2) R. Maeda, R. Ishibashi, R. Kamaishi, K. Hirota, H. Furuno, T. Hanamoto, *Org. Lett.* 13, 6240 (2011).
- 3) T. Ishikawa, M. Yoshiki, T. Tanaka, K. Ogata, Y. Yamada, T. Hanamoto, *Synthesis* 48, 1322 (2016).

発表者紹介

氏名 佐藤 慧一（さとう けいいち）

所属 佐賀大学院理工学研究科

学年 修士課程 2 年

研究室 花本研究室

