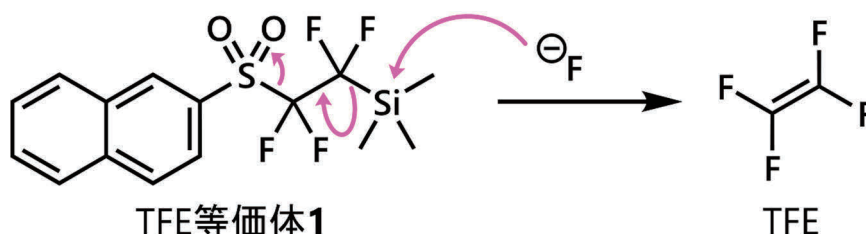


【目的】有機フッ素官能基の導入は医薬品の性質向上の常とう手段である。新たな有機フッ素官能基の候補としてトリフルオロビニル基が挙げられる。我々はこれまで、テトラフルオロエチレン (TFE) を用いたトリフルオロビニル化合物の合成法を開発してきた。しかし、TFE は毒性や爆発性を有する気体であり、一般的な有機化学の研究室で取り扱うことはできない。そこで、本研究では創薬分野にて簡便に使用できるトリフルオロビニル基導入試薬を、安価で安定供給されている TFE から製造する技術開発に取り組んだ。

【方法】我々はこれまで、Mg および ZnCl₂ を用いた TFE の還元的な脱フッ素メタル化反応の開発に成功している。この反応で得られるトリフルオロビニル亜鉛試薬は様々なトリフルオロビニル化合物の前駆体となることが示されたが、通常の有機亜鉛試薬同様、空気・水に極めて不安定であり、また定量が煩雑など、創薬分野で使いやすい試薬といえる状況ではなかった。そこで、より安定なトリフルオロビニルシランの合成を検討した。しかし、これらの検討ではあまり芳しい結果は得られなかった。そこで、TFE を反応系中にて発生させることができる分子の開発に切り替えることとした。図の化合物 1 はフッ化物イオンの作用によりフルオロシランおよびスルフィン酸塩の脱離を伴いながら TFE を発生させると期待した。また、この分子を利用したワンポットでのテトラフルオロエチレン化反応の開発に着手した。

【結果】方法でも述べた通り、トリフルオロビニルシランの合成はあまり芳しい結果が得られなかった。合成自体は可能であったものの、反応性が低く、トリフルオロビニル化剤としての性能は低かった。一方、TFE 等価体 1 の合成には成功した。この分子はフッ化物イオンを作用させると TFE を発生させることができる。また、発生した TFE からワンポットでフルオロアルキル銅錯体が合成できることも見出した。この錯体はトリフルオロビニル化合物をはじめ、様々なフッ素化合物の原料となりうることを示した。

TFE 等価体 1 の構造、合成および利用



■ *In-situ generation of TFE*

■ *Shelf stable precursor*

■ *Rapid TFE generation with F⁻*