

銅触媒を用いた 1-トリフルオロメチルアルケンの位置選択的アリルホウ素化

(阪大院工) ○小島 有貴・平野 康次

Copper-Catalyzed Regioselective Allylboration of 1-Trifluoromethylalkenes (*Graduate School of Engineering, Osaka University*) ○KOJIMA, Yuki; HIRANO, Koji

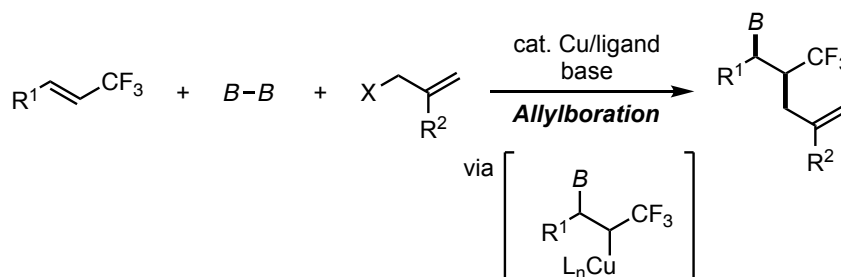
Since the trifluoromethyl group can be frequently found in pharmaceuticals and agrochemicals, the development of efficient synthetic method to construct CF₃-containing organic molecules is an important task in synthetic community. We recently focused on the synthesis of CF₃ molecules using 1-trifluoromethylalkenes as the starting platform: Copper-catalyzed regioselective hydroamination and hydroallylation of 1-trifluoromethylalkenes were reported. In these reactions, the judicious choice of ligand and base selectively promoted the hydroamination/hydroallylation reaction even with the possibility of undesired β -F elimination from an α -trifluoromethyl organocopper intermediate.

Based on the aforementioned strategy, herein, we report the copper-catalyzed regioselective allylboration of 1-trifluoromethylalkenes with diborons and allylic electrophiles. The addition of the boryl copper species and subsequent allylation reaction can introduce two substituents into the 1-trifluoromethylalkenes simultaneously.

Keywords : *Copper Catalysts; Allylboration; Organofluorine Compounds; Trifluoromethyl Group*

トリフルオロメチル基は医薬品や農薬に頻繁に含まれているため、トリフルオロメチル基を有する化合物の効率的な合成法の開発は重要な研究課題である。最近我々は、銅触媒を用いた 1-トリフルオロメチルアルケンの位置選択的ヒドロアミノ化反応¹⁾/ヒドロアリル化反応²⁾を報告している。これらの反応では、適切な配位子および塩基を用いることで α -トリフルオロメチル有機銅中間体からの β -フッ素脱離に優先して望みのアミノ化/アリル化が進行する。

この手法を基に、本研究では適切な銅触媒および塩基存在下、1-トリフルオロメチルアルケンに対してジボロンおよびアリル求電子剤を作用させることで位置選択的アリルホウ素化が進行することを見出した。



1) Takata, T.; Hirano, K.; Miura, M. *Org. Lett.* **2019**, *21*, 4284.

2) Kojima, Y.; Miura, M.; Hirano, K. *ACS Catal.* **2021**, *11*, 11663.