

銅触媒を用いた CF₃ が置換した不斉四級炭素の構築

(東理大) ○山本 太陽・遠藤 恆平

Multinuclear Cu-catalyzed enantioselective conjugated addition for the construction of CF₃-substituted quaternary carbon center (*Department of Chemistry, Faculty of Science, Tokyo University of Science*) ○Taiyo Yamamoto, Kohei Endo

The substitution of fluorine atom instead of hydrogen or hydroxy group and/or trifluoromethyl group instead of methyl group has become a common strategy in pharmaceutical and material science. But, the enantioselective construction of quaternary carbon center bearing a methyl and a trifluoromethyl group has never been reported. In our previous reports, multinuclear Cu-catalyzed enantioselective conjugate addition of Me₃Al to enones and ketoesters were achieved. Herein we report the enantioselective conjugate addition of Me₃Al to β-trifluoromethylenones and β-trifluoromethylketoesters in the presence of multinuclear copper catalysts that enables the construction of CF₃-substituted chiral quaternary carbon center.

Employing SP (5 mol%) as a ligand and Cu(NO₃)₂·3H₂O (5 mol%) as a Cu-salt for the reaction of β-trifluoromethylenones with Me₃Al (3 equiv) in THF (0.010 M) at 0 °C-rt afforded corresponding products in 93% yield and 95% ee.

Keywords : Multinuclear catalysts; Fluorine; All-carbon quaternary center

フッ素原子やトリフルオロメチル基の導入は、医薬品および材料開発の分野で盛んに行われている。しかし、メチル基とトリフルオロメチル基が置換した不斉四級炭素をエナンチオ選択的に構築した例はまだない。本研究室では、これまでに多核金属錯体を用いた不斉共役付加反応を報告している。本研究では、β-トリフルオロメチルエノンに対する Me₃Al の不斉共役付加反応によりトリフルオロメチル基が置換した不斉四級炭素の構築を達成した。

トリフルオロメチル基が置換したエノンに対して、配位子として **SP** (5 mol%)、銅塩として Cu(NO₃)₂·3H₂O (5 mol%) を用い、THF (0.010 M) 溶媒中、0 °C から室温条件で Me₃Al (3 当量) と反応させたところ、目的とする生成物が 93%, 95% ee と高収率かつ高エナンチオ選択に得られた。

