

キラルリン酸を用いたトリフルオロメチル基を有するケトイミン に対する複素環化合物のエナンチオ選択的 Friedel-Crafts アルキル 化反応

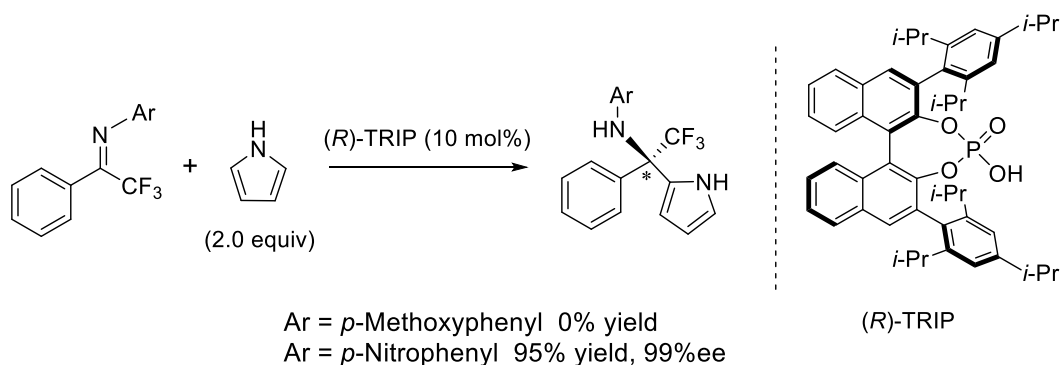
(学習院大理) ○成田 千裕・須田 悠介・内倉 達裕・秋山 隆彦

Enantioselective Friedel-Crafts Alkylation Reaction of Heterocyclic Compounds and Trifluoromethyl Ketimines Using Chiral Phosphoric Acid (*Faculty of Science, Gakushuin University*) ○Chihiro Narita, Yusuke Suda, Tatsuhiro Uchikura, Takahiko Akiyama

Because optically active α -trifluoromethylated amines are found in biologically active compounds, development of efficient method is desired. We already reported highly enantioselective Friedel-Crafts alkylation reaction of pyrrole with *N*-H trifluoromethyl ketimines catalyzed by chiral phosphoric acid. We studied Friedel-Crafts alkylation reactions of *N*-aryl trifluoromethyl ketimines with pyrrole and have found that electronic effect of *N*-substituent played an important role on the reactivity.

Keywords : Asymmetric Catalyst; Trifluoromethyl Group; Chiral Phosphoric Acid; Ketimine; Friedel-Crafts Alkylation

α 位にトリフルオロメチル基が置換した光学活性アミン類の中には高い生理活性を有するものが存在することから、その合成法の開発は有機合成化学において重要な課題の一つである。キラルリン酸を用いることで、窒素上無置換のトリフルオロメチルケトイミンに対するピロールの Friedel-Crafts アルキル化反応が効率的に進行することを既に報告した¹⁾。本研究では窒素上がアリール基で置換されたトリフルオロメチルケトイミンに対する Friedel-Crafts アルキル化反応を試み、窒素上の置換基が反応性に大きく関与していることを見出した。特に、*p*-ニトロフェニル基のような窒素上に電子求引性基を有するケトイミンに対し、(*R*)-TRIP 存在下ピロールを作用させることで、良好な収率かつ高い光学純度で対応する付加体が得られた。



- 1) Miyagawa, M.; Yoshida, M.; Kiyota, Y.; Akiyama, T. *Chem. Eur. J.* **2019**, 25, 5677-5681.
 Uchikura, T.; Suzuki, R.; Suda, Y.; Akiyama, T. *ChemCatChem* **2020**, 12, 4784-4787.