

キラルリン酸を用いたトリフルオロアルキニルケトイミンに対するエナンチオ選択的 Friedel–Crafts アルキル化反応

(学習院大理) ○有賀紅葉・鈴木理矩・内倉達裕・秋山隆彦

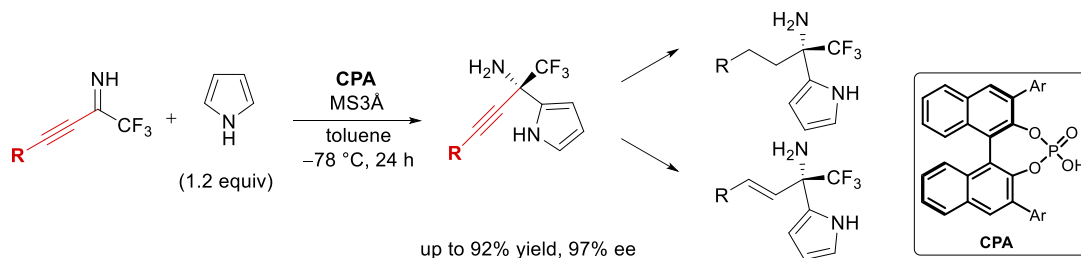
Enantioselective Friedel–Crafts Type Alkylation of *N*-Unprotected Trifluoromethyl Ketimines Bearing Alkynyl Groups

(Faculty of Science, Gakushuin University) ○Kureha Aruga, Riku Suzuki, Tatsuhiko Uchikura, Takahiko Akiyama

Because α -trifluoromethylated amines have attracted much attention due to its high biological activity, and enantioselective synthesis of these compounds is an important issue in organic synthesis. We previously reported enantioselective Friedel–Crafts alkylation reaction of *N*-unprotected trifluoromethyl ketimines and pyrroles using chiral phosphoric acid¹⁾. In this study, we focused on *N*-unprotected alkynyl trifluoromethyl ketimines, and have developed enantioselective Friedel–Crafts alkylation reaction with pyrroles to give chiral α -trifluoromethylated amines. Transformation of the adducts will be also discussed.

Keywords: *enantioselectivity, trifluoromethyl, Friedel–Crafts alkylation reaction, chiral phosphoric acid*

α 位にトリフルオロメチル基を有する光学活性アミン類の中には、高い生理活性を有する化合物が存在する。これらのアミンを光学純度良く合成する不斉合成反応の開発は有機合成化学において重要な研究課題の一つである。当研究室では、キラルリン酸による窒素上無保護のトリフルオロケトイミンの Friedel–Crafts アルキル化反応を報告している。本研究では、アルキニル基を有するケトイミンを新たに合成し、キラルリン酸によるエナンチオ選択的な Friedel–Crafts アルキル化反応に成功した。得られた付加体の変換反応についても紹介する¹⁾。



- 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.