

## キラルリン酸を用いた窒素上無置換のアルキニルトリフルオロメチルケトイミンに対するエナンチオ選択的アリル化反応

(学習院大理) ○葛西志保美・有賀紅葉・内倉達裕・秋山隆彦

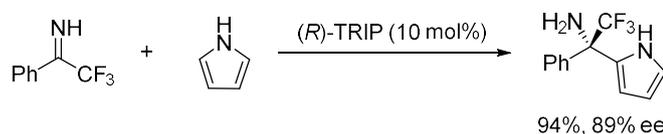
Chiral phosphoric acid catalyzed enantioselective allylation of *N*-unsubstituted alkynyl trifluoromethylketimines

(Faculty of Science, Gakushuin University) ○Shihomi Kasai, Kureha Aruga, Tatsuhiro Uchikura, Takahiko Akiyama

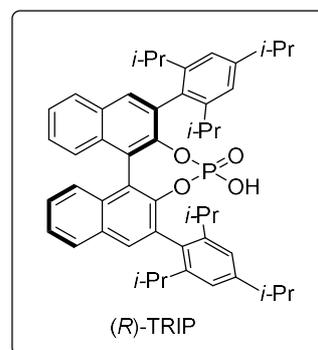
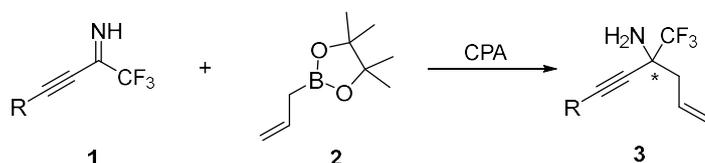
Because  $\alpha$ -trifluoromethylated amines have attracted much attention due to their high biological activities, enantioselective synthesis of those compounds is an important issue in organic synthesis. We previously reported enantioselective Friedel–Crafts alkylation reaction of pyrrole with *N*-unprotected trifluoromethyl ketimines using chiral phosphoric acid. In this study, we focused on allylation reaction and found that allylboronate is a suitable nucleophile. Keywords: asymmetric catalyst, trifluoromethyl group, chiral phosphoric acid, ketimine

$\alpha$  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、キラルリン酸存在下、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エナンチオ選択的 Friedel-Crafts アルキル化反応が効率よく進行することを報告している (Scheme 1)<sup>1)</sup>。本研究では、窒素上無置換のアルキニルトリフルオロメチルケトイミンのエナンチオ選択的アリル化反応に注目し、アリルホウ素酸エステル **2** を作用させるとアリル化体 **3** が効率よく得られることを見出した (Scheme 2)。

Scheme 1



Scheme 2



- 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.  
 Aruga, K.; Suzuki, R.; Uchikura, Y.; Akiyama, T. *Org. Lett.* **2022**, *24*, 4699-4703.