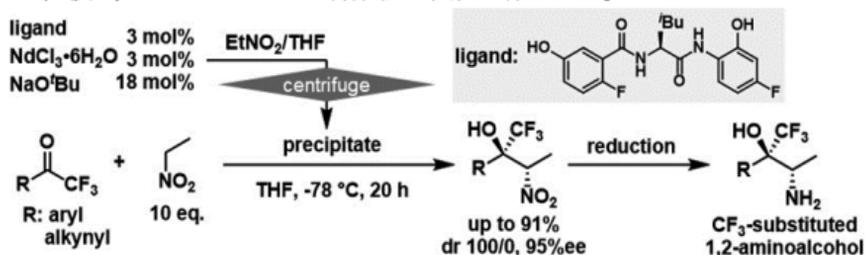


# 26C-am03

トリフルオロメチルケトンの直接的触媒的不斉ニトロアルドール反応  
○柄澤 智哉<sup>1</sup>, 熊谷 直哉<sup>1</sup>, 柴崎 正勝<sup>1</sup> (1 微化研)

【背景・結論】 トリフルオロメチル(CF<sub>3</sub>)基、1,2-アミノアルコールはどちらも医薬品に多くみられる単位構造であるが、これら両方を併せ持つ CF<sub>3</sub> 置換 1,2-アミノアルコールの立体選択的な合成法はほとんど知られていない。今回我々は、当研究室から報告されている Nd/Na 異種二核金属触媒を用いた不斉ニトロアルドール(Henry)反応<sup>a)</sup>が CF<sub>3</sub> ケトンにも適用可能であることを見出した。続くニトロ基の還元により、CF<sub>3</sub> 置換 1,2-アミノアルコールを立体選択的に得ることに成功した。

【方法・結果】 アミド型配位子および安価な NdCl<sub>3</sub>・NaO<sup>t</sup>Bu から調製した不均一系触媒<sup>b)</sup>が CF<sub>3</sub> ケトンとニトロエタンのニトロアルドール反応を-78 °Cの低温下に促進し、望みとする CF<sub>3</sub> 置換 1,2-ニトロアルコールが高い *anti* 選択性およびエナンチオ選択性で得られることを見出した。生成物のニトロ基は容易に還元可能で、医薬化学的に有用な各種 CF<sub>3</sub> 置換 1,2-アミノアルコール合成法の開発に成功した。



References (a) Nitabaru, T.; Nojiri, A.; Kobayashi, M.; Kumagai, N.; Shibasaki, M. *J. Am. Chem. Soc.* **2009**, *131*, 13860. (b) Nonoyama, A.; Hashimoto, K.; Saito, A.; Kumagai, N.; Shibasaki M. *Tetrahedron Lett.* **2016**, *57*, 1815.