

スルフィンアミドの硫黄選択的アリール化反応による 光学活性なスルホキシミンの実用的合成法の開発

(東農工大院工)○東 咲良・加納 太一

Practical Synthesis of Chiral Sulfoximines by *S*-Arylation of Sulfinamides

(Graduate School of Engineering, Tokyo University of Agriculture and Technology) ○Sakura Higashi, Taichi Kano

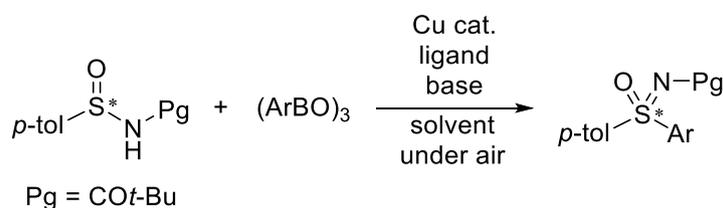
Sulfoximines contain a hexavalent sulfur atom having one oxygen, one nitrogen and two carbon substituents. Their sulfur atom has a chiral center when the two carbon substituents are not identical. Chiral sulfoximines are generally synthesized via imidation of chiral sulfoxides or oxidation of chiral sulfimides. However, asymmetric synthesis of the starting materials is difficult, and the structural variation is intrinsically limited. Recently, we have developed the *S*-arylation of readily accessible chiral sulfinamides. However, this method requires diaryliodonium salts that are not readily available.¹

In this study, a practical asymmetric synthesis of chiral sulfoximines has been achieved through a stereospecific *S*-arylation of sulfinamides with triarylboroxines in the presence of a copper catalyst.

Keywords : Sulfoximine, Boroxine, Asymmetric Synthesis

スルホキシミンは硫黄原子上に酸素、窒素、及び二つの炭素置換基を有する六価の硫黄化学種であり、硫黄原子上の炭素置換基が異なる場合に、硫黄原子は不斉中心となる。スルホキシミンの従来の不斉合成手法としては光学活性なスルホキシドやスルフィリミンを原料に、ニトレンや酸化剤を作用させる手法が挙げられるが、原料の不斉合成が難しく、合成可能なスルホキシミンの構造が限定されるといった問題があった。当研究室では近年、入手容易な光学活性スルフィンアミドを原料とした硫黄選択的アリール化反応を報告したが、合成が煩雑なジアリールヨードニウム塩を用いる必要があった¹。

本研究では、安価で入手や取り扱いが容易な試薬を用いた、より実用的なスルホキシミンの不斉合成手法の開発を行った。具体的には銅触媒存在下、スルフィンアミドとトリアリールボロキシンのカップリング反応により、スルホキシミンの不斉合成を実現した。



[1] Y. Aota, T. Kano, K. Maruoka, *J. Am. Chem. Soc.* **2019**, *141*, 19263.