

ヨード基の活性化を利用したアラインのチオアミノ化反応の開発

(東理大先進工¹・東医歯大生材研²) ○田端 慎也¹・美濃島 麻衣²・小林 瑛宏^{1,2}・細谷 孝充²・吉田 優¹

Thioamination of Arynes through the Iodine Activation

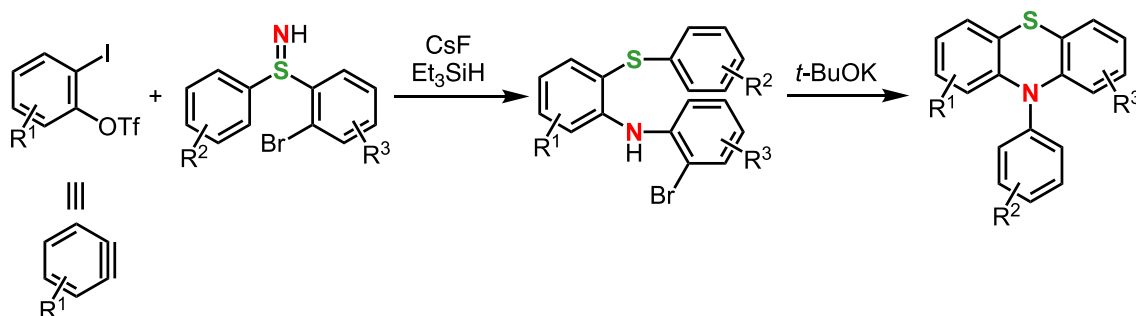
(Tokyo University of Science,¹ Tokyo Medical and Dental University²) ○Shinya Tabata,¹

Mai Minoshima,² Akihiro Kobayashi,^{1,2} Takamitsu Hosoya,² Suguru Yoshida¹

o-Sulfanylanilines have served in the synthesis of phenothiazines. Herein, we succeeded in the preparation of a wide range of *o*-sulfanylanilines from *o*-iodoaryl triflates and sulfilimines via the aryne generation triggered by the activation of easily introducible iodo group. Also, various phenothiazines were successfully synthesized by our recently developed method.

Keywords : Aryne; Thioamination; Phenothiazines; Iodo group; Sulfilimines

窒素および硫黄原子を隣接した位置に有する *o*-チオアニリン類は、フェノチアジン合成における前駆体として有用な化合物群である。これに対して、以前に我々は *o*-シリルアリアルトリフレートのアライン前駆体として用いて、スルフィリミン存在下でフッ化カリウムと 18-クラウン-6 を作用させると、*o*-チオアニリン類が得られることを見いだした¹⁾。今回我々は、導入が容易なヨード基の活性化²⁾を利用してアラインを発生させ、これをスルフィリミンと反応させることで、多彩なチオアミノ化体の簡便合成に成功した。さらに、最近我々が開発した手法³⁾により、幅広いフェノチアジンを合成できることも明らかにした。



1) S. Yoshida, T. Yano, Y. Misawa, Y. Sugimura, K. Igawa, S. Shimizu, K. Tomooka, T. Hosoya, *J. Am. Chem. Soc.* **2015**, *137*, 14071.

2) M. Minoshima, K. Uchida, Y. Nakamura, T. Hosoya, S. Yoshida, *Org. Lett.* **2021**, *23*, 1868.

3) T. Matsuzawa, T. Hosoya, S. Yoshida, *Org. Lett.* **2021**, *23*, 347.