

アミノスルホキソニウムを脱離基とするジアステレオ発散的 Gabriel-Cromwell アジリジン合成

(阪大院工¹・阪大工学部²) 安井 孝介¹・○先森 大翔²・平野 康次¹

Diastereodivergent Gabriel-Cromwell Aziridination Enabled by Aminosulfoxonium

(¹Graduate School of Engineering, The University of Osaka, ²School of Engineering, The University of Osaka) Kosuke Yasui,¹ ○Taiga Sakimori,² Koji Hirano,¹

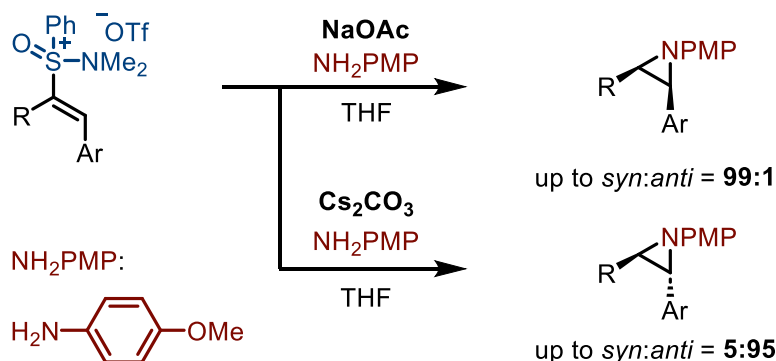
The Gabriel-Cromwell aziridine synthesis is the most classical method for synthesizing aziridines. Continuous efforts allow the use of various leaving groups in this transformation, including halogens and sulfonium. However, none of them exhibit diastereoselectivity.

Herein, we developed a diastereodivergent Gabriel-Cromwell aziridine synthesis using aminosulfoxonium as the leaving group. The key to realizing these reactions is the choice of the used base: Cs₂CO₃ provided the *anti* isomer, and NaOAc did the *syn* isomer, both with high diastereoselectivity.

Keywords : Sulfoximine; Gabriel-Cromwell reaction; Aziridine; C-S bond cleavage; Diastereodivergency

脱離基を有するアルケンとアミンを基質とする Gabriel-Cromwell アジリジン合成は最も古典的なアジリジンの合成法である¹⁾。脱離基にはハロゲンのみならず、近年ではカチオン性硫黄官能基であるスルホニウムも用いられるようになった²⁾。このように脱離基の種類が拡充されてきたものの、いずれの方法においてもジアステレオ選択性がほとんど発現しないことが課題であった。

今回我々はアミノスルホキソニウムを脱離基とすることで、用いる塩基に応じて、ジアステレオ発散的に Gabriel-Cromwell アジリジン合成が進行することを見出した。すなわち、用いる塩基が Cs₂CO₃ では *anti* 体、NaOAc では *syn* 体がそれぞれジアステレオ選択的に得られた。



1) Dequina, H. J.; Jones, C. L.; Schomaker, J. M. *Chem* **2023**, 9, 1658.

2) (a) Review: Kim, M.; Targos, K.; Holst, D. E. ; Wang, D. J. ; Wickens, Z. K. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2024**, 63, e202314904. (b) Liu, M.-S.; Du, H.-W.; Cui, J.-F.; Shu, W. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2022**, 61, e20220992.