N-フルオロスルホニルイミダゾールを用いるフェノールの高化学 選択的フルオロスルホニル化反応

(神戸薬大薬 1 ・セントラル硝子株式会社 2) 平田 翼 1 ・○庄野 真白 1 ・木村 高岳 2 ・富田 廉 2 ・秋山 勝宏 2 ・波多野 学 1

Highly Chemoselective Fluorosulfonylation of Phenols Using *N*-Fluorosulfonylimidazole (¹Faculty of Pharmaceutical Sciences, Kobe Pharmaceutical University, ²New-STEP Research Center, Central Glass Co. Ltd.) Tsubasa Hirata,¹ ○Mashiro Shono,¹ Kogaku Kimura,² Ren Tomita,² Katsuhiro Akiyama,² Manabu Hatano¹

Aryl triflates (ArOTf) are important in organic synthesis as equivalents of aryl halides in transition metal catalyzed cross-coupling reactions. However, environmental concerns have led to restrictions on the use of persistent perfluoroalkyl and polyfluoroalkyl compounds (PFAS). In addressing this issue, aryl fluorosulfates (ArOSO $_2$ F) have emerged as a promising solution. However, the conventional fluorosulfonylation of phenols requires the use of highly toxic gaseous sulfuryl fluoride (SO $_2$ F $_2$). In this study, as an alternative to conventional triflations, we have developed a highly chemoselective fluorosulphonylation of the hydroxy groups of phenols using N-fluorosulfonylimidazole. We will demonstrate some Pd-catalyzed transformations of the obtained aryl fluorosulfates.

Keywords: Chemoselectivity; Fluorosulfonylation; PFAS; Phenol; Sulfonylation

アリールトリフラート(ArOTf)は、遷移金属触媒によるクロスカップリング反応におけるハロゲン化アリール等価体として重要である。一方で、環境への懸念から難分解性のペルフルオロアルキル化合物およびポリフルオロアルキル化合物(PFAS)の使用規制が進んでいる。こうした問題に対して、アリールフルオロスルフェート(ArOSO₂F)の利用が着目されている。従来のフルオロスルホニル化では、有毒な気体のフッ化スルフリル(SO_2F_2)を用いる必要があった。本研究では、従来のトリフリル化反応に替わり、N-フルオロスルホニルイミダゾールを用いるフェノール類の高化学選択的なフルオロスルホニル化反応を開発した。得られたアリールフルオロスルフェートのクロスカップリング反応による誘導も発表する。

$$\begin{array}{c} & & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & \\ & \\ & & \\$$