

研究区分	教員特別研究推進（独創・先進的研究）
------	--------------------

研究テーマ	二酸化硫黄等価体を用いる多様性志向型硫黄原子導入反応の開発				
研究組織	代 表 者	所属・職名	薬学部・准教授	氏名	小西 英之
	研究協力者	所属・職名		氏名	
		所属・職名		氏名	
		所属・職名		氏名	
	発 表 者	所属・職名	薬学部・准教授	氏名	小西 英之

講演題目
二酸化硫黄等価体を用いる原子価数選択的な硫黄原子導入反応の開発
研究の目的、成果及び今後の展望
【概要】二酸化硫黄（SO₂）の等価体としてのピロ亜硫酸カリウム（K₂S₂O₅）の利用法拡大およびこれを用いて医薬品開発に資する簡便で選択的な有機合成手法の開発を目指し、原子価数選択的な硫黄原子導入反応について検討を行ったところ、アルキルスルホンおよびアルキルスルフィドの新規合成法を見出した（図）。アルキルスルホンについては、ボロン酸と SO₂ より生じると考えられるスルフィン酸イオンを求電子剤で捕捉する戦略により合成することができた。一方、アルキルスルフィドについては反応条件の工夫が必要であり、ボロン酸と SO₂ からジスルフィドの生成およびアルキル源と還元条件の利用により目的物を得ることができた。現在、さらなる収率向上のために反応条件の最適化を進めている。 ●アルキルスルホン合成 up to 75% yield アルキルスルホン ●アルキルスルフィド合成 up to 68% yield アルキルスルフィド 【当初の目的と達成状況】当初は「多様な原子価数の硫黄原子や置換基の導入」ならびに「硫黄原子導入型分子骨格編集」を実現する実用性の高い新規有機合成手法の開発を目的としていた。前者については、2 種類の化学種の合成反応を見出し、3 月に学会発表を行った。後者については、ある環状化合物にスルホニル基を挿入する反応が進行したと見られる有望な結果が得られた。したがって、本研究は計画通り進めることができたと考えられる。 【公表状況】本研究成果については論文執筆の準備中である。また、2026 年 3 月の日本薬学会第 146 年会において、直接指導した学生 2 名が発表を行った。 【今後の展望】本研究において開発した反応は合成化学者にとって「使いやすい」反応である。スルホンやスルフィドの合成には、従来法では悪臭や安定性の問題を有するスルホニルクロリドやチオールが必要であったが、本手法ではこれらの単離および使用を K₂S₂O₅ 由来の SO₂ による硫黄原子導入を伴う直接変換により回避することで、従来法における課題を根本的に解決した。本成果は高い合成的有用性と実用性を兼ね備えており、今後の硫黄化学における重要な基盤技術となることが期待される。 【その他】本研究の基盤となる成果：Konishi, H.; Manabe, K. et al. <i>ACS Catal.</i> 2024, <i>14</i>, 15348–15355.