

位置選択的[3+2]環化付加反応を利用した 5-スチバノトリアゾールの合成とその反応性

山田 瑞希、松村 実生、斎藤 宏貴、内田 裕希、川幡 正俊、山口 健太郎、
角澤 直紀、安池 修之

愛知学院大学大学院 薬学研究科 医療薬学専攻 薬化学研究室

【概要】

2016年12月8—10日、宮城県仙台市、仙台市民会館で開催された「第43回有機典型元素化学討論会」に参加し、以下の研究内容を口頭発表した。

【目的】

近年、1,4,5-三置換-1,2,3-トリアゾール誘導体に生物学的な機能が報告され、その合成法の開発が活発に行われている。一方、近年我々はアンチモン(Sb)を含む新規化合物の創製と化学反応性の解明に取り組んでいる。今回、銅触媒下でSbを含むアセチレン誘導体(1)とアジド化合物(2)を利用した位置選択的[3+2]環化付加反応を行い、新規1,2,3-トリアゾール誘導体(3)への誘導を行った。さらに得られたトリアゾールの5位をアニオン等価体として利用することを目的に、酸塩化物を利用したアシル化反応などを検討した。

【方法と結果】

まず、フェニルエチニルスチバン($R^1 = \text{Ph}$)とベンジルアジド($R^2 = \text{benzyl}$)を基質に用いて反応条件の探索を行った。その結果、空気雰囲気下、THF溶液中、臭化銅(I)を触媒に用いて反応を行うと位置選択的な環化反応が効率よく進行し、93%の収率で目的とするトリアゾール(3)を得ることがで

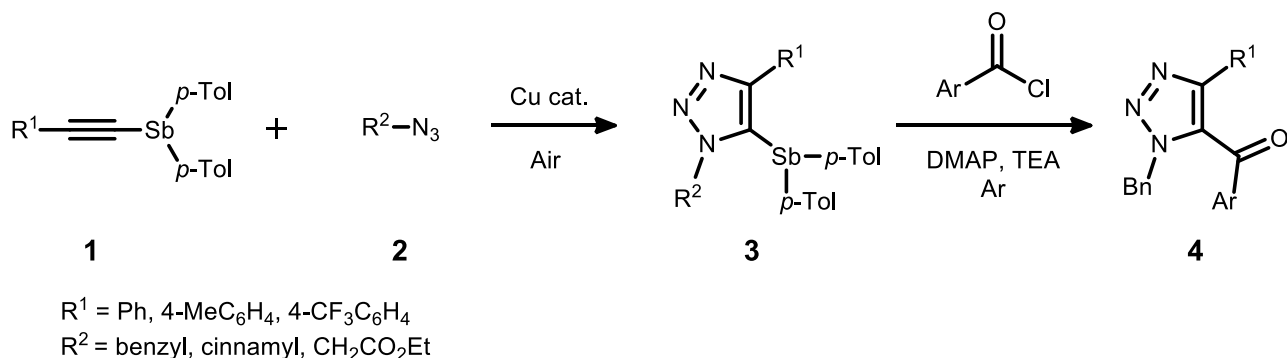
きた。本反応は一般性が高く各種のエチニルスチバンやアジド類を用いた場合も、対応するトリアゾール誘導体に変換することができた。さらに、得られたトリアゾールに対して塩基存在下で各種の芳香族酸塩化物を作用させたところ、Sb側鎖の脱離を伴うアシル化反応が進行し、対応するケトン(4)をそれぞれ得ることができた。

【考察】

本反応は一般性が高く各種のエチニルスチバンやアジド類を用いた場合も、対応するトリアゾール誘導体に変換でき、計19種のトリアゾール誘導体を得ることができた。さらに酸塩化物などとも良好に反応が進行することから、5-スチバノトリアゾールがトリアゾール環の5位のアニオン等価体として利用できることが明らかとなった。

【感想】

3日間学会に参加したことで、普段の研究分野と異なる分野における最新の研究を学ぶことができ、大変勉強になりました。また、自分と同じような学生がしっかりとした発表や質疑応答をしている姿を見て自分もより一層努力を重ねなければならないと感じました。今後は今回の学会で得られた知識や研究に対する姿勢などを自分の研究に生かしていきたいと思います。



最後になりましたが、このような機会を与えて
いただいた愛知学院大学薬学会に感謝いたします。

