

第 47 回複素環化学討論会 — 銅触媒下で三成分反応を利用した

5-セラニルトリアゾールの一般合成

○山田瑞希

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】

2017 年 10 月 26–28 日、高知県高知市、高知県立県民文化ホールで開催された「第 47 回複素環化学討論会」に参加し、以下の研究内容を口頭発表した。

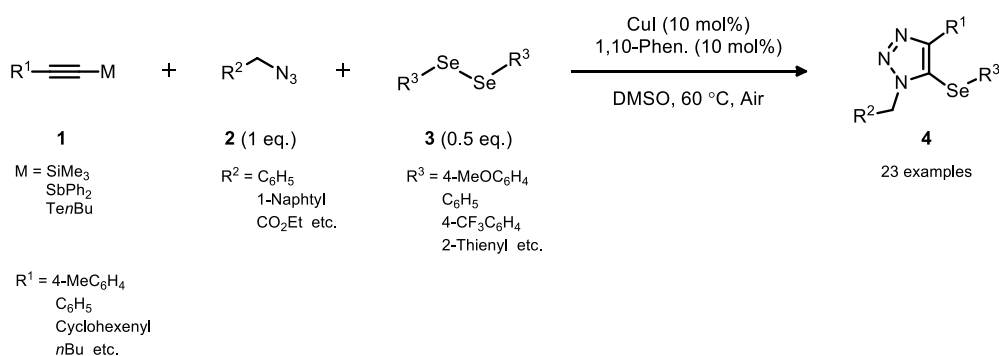
【目的】

近年、有機 Se 化合物の合成と創薬への応用が活発に行われ、Se 官能基を持つ複素環化合物の中にも抗酸化作用や抗うつ作用を持つものが見出されている。また 1,2,3-トリアゾール環を持つ化合物にも生理活性が報告され、創薬を指向した研究が進められている。そこで、Se 官能基とトリアゾール環から成る 5-セラニルトリアゾールの合成法を調べたところ、単発的な報告が数例あるのみで、5-セラニルトリアゾール誘導体の一般合成法はこれまで確立されていなかった。そこで、今回、5-セラニルトリアゾールの簡便な合成法の開発を目的として、各種の典型元素を含むアセチレン誘導体と

アジド化合物ならびにジセレニド類を用いた三成分反応を検討した。

【方法と結果】

まず、各種のアセチレン誘導体(1)に対して、ベンジルアジド(2)とジ-*p*-トリルジセレニド(3)を用いて反応を行ったところ、Sb を含むアセチレン誘導体の場合にのみ、目的とする 5-セラニルトリアゾール(4)を 87% の高収率で得ることができた。そこで、本反応に最適なアセチレンをエチニルスチバンと決定し、銅触媒、配位子、溶媒等の詳細な反応条件の検討を行った。その結果、本反応の最適条件を空気雰囲気下、10 mol% のヨウ化銅(I)と 1,10-フェナントロリン存在下、DMSO 溶液中、60 °C での加熱と決定した。ついで、得られた最適条件をもとに、各種のジセレニド類とエチニルスチバン類ならびにアジド化合物との反応を行った。その結果、いずれの場合も、目的とする 5-セラニルトリアゾールを得ること



ができ、本反応に一般性があることが明らかとなった。また、本反応は三成分反応で、反応経路が複数考えられたため、反応機構を考察するために最適条件下でのコントロール実験も行った。

【考察】

本反応は空気雰囲気下、簡便な条件で反応を行えること、ジセレニドの2つのセラニル基を効率よく利用できることなどを特徴としている。さらに、各種のジセレニド類やエチニルスチバン類ならびにアジド化合物を用いた場合も、対応する5-セラニルトリアゾール誘導体に変換でき、1,4,5位す

べての置換基にさまざまな官能基を導入できることが明らかとなった。

【感想】

今回の学会で発表した際に、研究内容について質問を受けたり他の先生方からアドバイスをいただいたりすることで、改めて自分の研究を見直すことができました。また、複素環化学討論会ということもあって自分の研究テーマに近い研究が多く発表されており、大変勉強になりました。

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。

