

イリジウム触媒による異種アジド基選択的 トリアゾール形成反応の開発

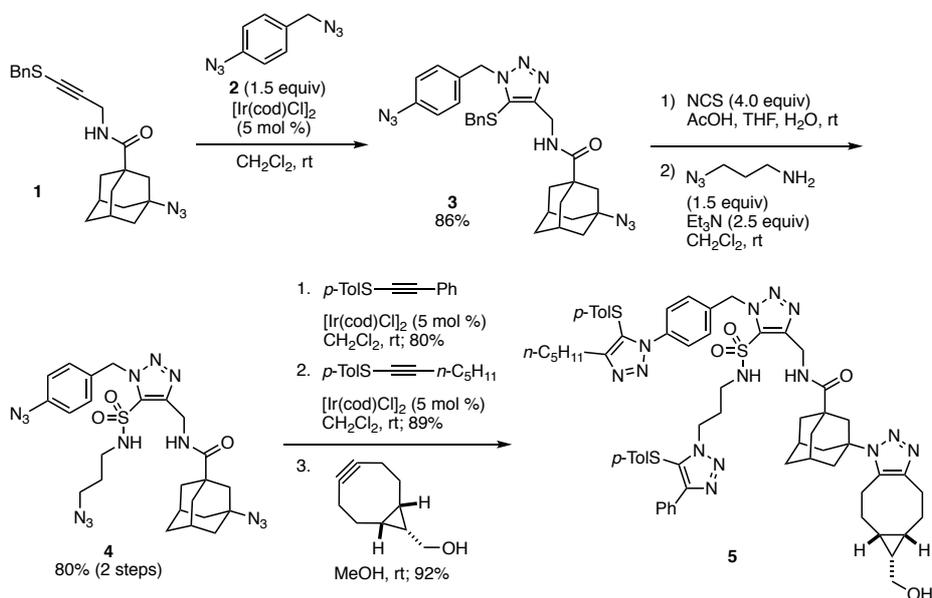
(医科歯科大生材研) ○杉山 和也・坂田 優希・吉田 優・細谷 孝充
Azido-Type Selective Iridium-Catalyzed Triazole Formation
(*IBB, Tokyo Med. & Dent. Univ.*)

○Kazuya Sugiyama, Yuki Sakata, Suguru Yoshida, Takamitsu Hosoya

It is not easy to achieve an azido-type selective cycloaddition of a multiazido compound with alkynes using a copper catalyst. Herein, we report an azido-type selective triazole formation using thioalkynes under Ir-catalyzed conditions. The method was successfully applied to the synthesis of a triazide molecule, which served as a good platform for efficient three sequential triazole formations.

Keywords : Azide; Triazole; Cycloaddition; Iridium catalyst; Thioalkyne

銅触媒を用いたアルキンとアジドとのクリック反応¹を用いて、複数のアジド基を区別してトリアゾール形成を行うことは容易ではない。これに対して、今回我々は、イリジウム触媒存在下、チオアルキン²を用いることで異種アジド選択的にトリアゾール形成が進行することを見いだした。本手法により、ベンジルアジド、フェニルアジド、アダマンチルアジドの3種のアジドのうち、ベンジルアジドを優先して反応させることに成功し、ジアジド**3**を効率よく合成することができた。また、つづくチオ基の官能基変換によってトリアジド型プラットフォーム分子**4**を簡便に合成することにも成功した。トリアジド**4**に対して、3種のアルキンの逐次連結を試みたところ、2度の異種アジド基選択的反応と、残ったアダマンチルアジドの環状アルキンとのトリアゾール形成反応が問題なく進行し、効率的な3分子集積に成功した。



References: (1) H. C. Kolb, M. G. Finn, K. B. Sharpless, *Angew. Chem., Int. Ed.* **2001**, *40*, 2004. (2) S. Ding, G. Jia, J. Sun, *Angew. Chem., Int. Ed.* **2014**, *53*, 1877.