

α,γ -ジアジド- α,β -不飽和エステルを利用した多置換イミダゾールの合成

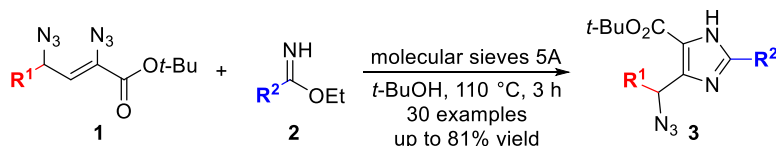
(青山学院大院理工¹⁾) ○松島 佳汰¹・田中 勝太¹・小出大晟¹・佐々木 郁雄¹・杉村 秀幸¹

Synthesis of polysubstituted imidazoles using α,γ -diazido- α,β -unsaturated esters (¹*Graduate School of Science and Engineering, Aoyama Gakuin University*) ○Keita Matsushima,¹ Shota Tanaka,¹ Taisei Koide,¹ Ikuo Sasaki,¹ Hideyuki Sugimura¹

Compounds containing imidazole ring possess various biological activities, and the substitution patterns of the imidazole ring have a huge impact on biological activities of the resultant molecules. Therefore, various synthetic methods of polysubstituted imidazoles have been developed. In 2015, Yu *et al.* reported the synthetic method using vinyl azides and imidates¹⁾. In our laboratory, the synthetic method of α,γ -diazido- α,β -unsaturated esters **1** containing a vinyl azide moiety was reported²⁾. In this study, we applied Yu's method to the diazide compounds **1** and optimized the reaction conditions. As a result, it was found that the polysubstituted imidazole **3** was obtained in good yield when the reaction was performed in the presence of molecular sieves 5A as an additive in *t*-BuOH at 110 °C for 3 h. With the optimized conditions in hand, the substrate scope was investigated. Furthermore, to demonstrate the synthetic utility, transformations of the azido group of the obtained polysubstituted imidazoles were carried out.

Keywords : *Heteroaromatic Compounds; Imidazoles; Vinyl Azides; Imidates*

イミダゾール環を含む化合物は様々な生物活性を示し、その置換様式は生物活性に大きく影響を与えることから、今までに様々な多置換イミダゾールの合成法が開発されてきた。2015年には、Yu らによってビニルアジドとイミデートを利用した多置換イミダゾールの合成法が報告された¹⁾。一方、当研究室ではビニルアジド構造を持つ α,γ -ジアジド- α,β -不飽和エステル **1** の合成法を報告している²⁾。そこで、本研究ではこのジアジド化合物 **1** に対して Yu らの多置換イミダゾールの合成法を適用し、反応条件の最適化を行ったところ、添加剤として molecular sieves 5A を用い *t*-BuOH 中、110 °C で3時間反応を行うと、多置換イミダゾール **3** が良好な収率で得られることが分かった。さらに、この最適反応条件を用いて基質適用範囲の調査を行った。また、この合成法の有用性を示すために、得られた多置換イミダゾールが有するアジド基の変換反応の検討を行った。



1) Y. Yu *et al.* *RSC Adv.* **2015**, 5, 55808-55811.

2) H. Sugimura *et al.* *Tetrahedron Lett.* **2015**, 56, 2813-2816.