

コンパクトな 1,3-ジイニルスルフィド型トリアルキンプラットフォーム分子の開発と多成分集積への応用

(医科歯科大生材研) ○徳永健人・田口純平・細谷孝充

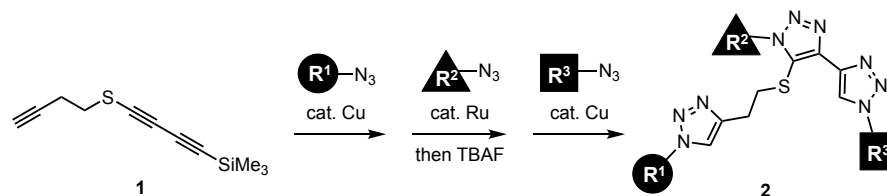
Development of Compact 1,3-Diynyl Sulfide-Type Triyne Platform Molecules and Application to the Multicomponent Assembly (*IBB, Tokyo Med. & Dent. Univ.*)

○Kento Tokunaga, Jumpei Taguchi, Takamitsu Hosoya

Platform molecules with multiple connectable groups are useful for the synthesis of diverse compounds by the multicomponent assembly. In particular, small platform molecules are superior because they allow access to compounds with a wide range of molecular weights. However, there are few numbers of reports on trifunctional platform molecules with small molecular weight. Herein, we designed new triyne platform molecule **1**, which have 3-butyryl and 4-trimethylsilyl-1,3-butadiynyl groups on a sulfur atom. Using this platform molecule, we succeeded in sequential assembly of three azide compounds through the copper-catalyzed triazole formation at the terminal alkyne moiety, the ruthenium-catalyzed triazole formation at the thioalkyne moiety¹⁾, and the copper-catalyzed triazole formation after deprotection of the silyl-protected alkyne moiety. The method was successfully applied to the construction of a molecular library consisted with trisubstituted triazoles with small molecular weight. Furthermore, we have achieved in synthesizing multifunctional compounds with middle molecular weight by the assembly of three functional azide compounds.

Keywords : Platform Molecule; Alkyne; Azide; Sulfide; Click Reaction

複数の連結部位を有するプラットフォーム分子は、多分子集積により多彩な化合物の合成を可能にするため有用である。特に、分子量の小さいプラットフォーム分子は、幅広い分子量分布の化合物群が合成できる点で優れているものの、分子量の小さな3官能性プラットフォーム分子の報告例は限られていた。今回我々は、3-ブチニル基と4-トリメチルシリル-1,3-ブタジイニル基が硫黄原子を介して連結された分子 **1** の、トリアルキンプラットフォーム分子としての利用に取り組んだ。その結果、初めに末端アルキン部における銅触媒を用いたトリアゾール形成、続いて、チオアルキン部におけるルテニウム触媒によるトリアゾール形成¹⁾、最後にシリル保護アルキン部の脱保護と銅触媒によるトリアゾール形成を行うことで、3種類のアジド化合物の逐次的な集積に成功した。本プラットフォームの応用として、分子量が小さく、反応相手に全てアジドを用いるという特徴を活かし、小分子化合物ライブラリーの構築を行った。さらに、3種の機能性アジドの集積による中分子多機能化合物の合成にも成功した。



- 1) Destito, P.; Couceiro, J. R.; Faustino, H.; López, F.; Mascareñas, J. L. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2017**, *56*, 10766.