

1-(ω -アジドアルキル)-2-(2,2-ジハロビニル)アレーンを用いる多環性トリアゾール誘導体の合成

(東工大生命理工) 小林一貴・笠倉望路・○秦 猛志・重田雅之・占部弘和

Preparation of Polycyclic Triazole Derivatives from 1-(ω -Azidoalkyl)-2-(2,2-dihalovinyl)arenes (School of Life Science and Technology, Tokyo Institute of Technology)
Kazuki Kobayashi, Nozomi Kasakura, ○Takeshi Hata, Masayuki Shigeta, Hirokazu Urabe

1,2,3-Triazole is one of the most widely used heterocycles in various functional molecules such as pharmaceuticals, dyes, and polymer materials. In particular, 1,2,3-triazole-fused heterocycles are the backbone of various biologically active molecules, and there is a need to establish a simple method for their synthesis. In this study, we report a synthesis of polycyclic triazole derivatives from halogen-substituted 1,2,3-triazoles obtained by intramolecular Huisgen cycloaddition of 1-(ω -azidoalkyl)-2-(2,2-dihalovinyl)arenes. As an example, a DMF solution of azide **1** with 2,2-dibromovinyl group was refluxed to afford bromo-substituted tricyclic triazole derivative **2** in a good yield. From this compound, triazole-fused polycyclic compound **3** was conveniently synthesized by the Mizoroki-Heck reaction for carbon chain elongation and intramolecular Friedel-Crafts reaction.

Keywords : Alkyl Azide; Dihalovinyl Group; Triazole; Intramolecular Cyclization; Carbon Chain Elongation

1,2,3-トリアゾールは、医薬、染料、高分子材料をはじめ様々な機能分子に広く利用されているヘテロ環の1つである。中でも、1,2,3-トリアゾールが融着したヘテロ環は、種々の生物活性分子に含まれている骨格であり、その簡便な合成法の確立が求められている。本研究では、1-(ω -アジドアルキル)-2-(2,2-ジハロビニル)アレーンの分子内ヒュスゲン環化付加により得られたハロゲン置換 1,2,3-トリアゾールから多環性トリアゾール誘導体が合成できたので報告する。具体例としては、以下のスキームに示すように、分子内に 2,2-ジブロモビニル基を有するアジド **1** を DMF 中で加熱還流すると、ブロモ置換 3 環性トリアゾール **2** が収率良く得られた。次に、溝呂木-HECK 反応による炭素鎖伸長および分子内フリーデル・クラフツ反応により、トリアゾール環が融着した多環性化合物 **3** に誘導できた。

