

2-アジドアクリル酸エステルを用いた逐次分子連結法の開発

(東理大先進工) ○廣政涼乃・濱田真代・織本雅久・吉田優

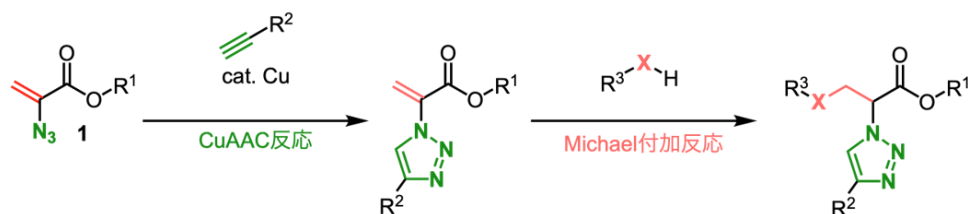
Sequential Conjugation Methods of 2-Azidoacrylate Esters (*Tokyo University of Science*)

○ Suzuno Hiromasa, Mayo Hamada, Gaku Orimoto, Suguru Yoshida

Multicomponent assembling methods with platform molecules are awaited. We have disclosed unique reactivities of 2-azidoacrylamides. Herein, we found that the reactivity of alkene moieties in Michael additions was significantly enhanced by formation of a triazole ring with 2-azidoacrylate esters.

Keywords: Click reaction; Platform; Azide; Michael addition

プラットフォーム分子を用いて、多成分を短工程で集積させる手法が強く望まれている^{1,2)}。特に、クリック反应用の官能基を複数配置したコンパクトなプラットフォーム分子を用いた逐次連結によって、多様性に富んだ化合物ライブラリーを簡便に構築できると期待される。これまでに我々は、2-アジドアクリルアミドの特異な反応性を明らかにしてきた^{3,4)}。これに対して、今回我々は、2-アジドアクリル酸エステル **1** に注目し、逐次分子連結法の開発に取り組んだ。検討の結果、トリアゾール形成によってアルケン部位の Michael 受容能が著しく向上することを明らかにした。具体的には、2-アジドアクリル酸エステルに対して、銅触媒を用いるアジド-アルキン環化付加反応 (CuAAC) 反応によりトリアゾール形成したのちに Michael 付加反応を行ったところ、効率よく反応が進行した。このとき、トリアゾール形成によって Michael 付加反応におけるアルケン部位の反応性が著しく向上することを明らかにできた。



1) D. Sato, Z. Wu, H. Fujita, J. S. Lindsey, *Organics* **2021**, 2, 161.

2) H. Takemura, G. Orimoto, A. Kobayashi, T. Hosoya, S. Yoshida, *Org. Biomol. Chem.* **2022**, 20, 6007.

3) H. Takemura, S. Goto, T. Hosoya, S. Yoshida, *Chem. Commun.* **2020**, 56, 15541.

4) S. Ariyasu, H. Hayashi, B. Xing, S. Chiba, *Bioconjugate Chem.* **2017**, 28, 897.