

## 選択的アザイリド形成にもとづく 3 分岐プラットフォームの合成

(東理大院先進工) ○濱田 真代・織本 雅久・吉田 優  
 New Trivalent Platforms for Sequential Conjugation Methods Based on Selective Azaylide Formations (Tokyo University of Science) ○Mayo Hamada, Gaku Orimoto, Suguru Yoshida

Recently, trivalent platform molecules with three clickable functional groups have gained attention in pharmaceutical sciences. Previously, we succeeded in the selective azaylide formation by differentiating two azides based on reaction rate difference. Herein, we developed a trivalent platform with terminal alkyne and two types of azides, and achieved the construction of a multifunctional molecule.

**Keywords :** Click Chemistry; Azide; Phosphine; Iminophosphorane; Platform

有機化学だけでなく、生命科学をはじめとする幅広い分野において 2 分子を連結できる反応が大きな役割を果たしている。これまで、高度な機能性分子を創製するために、複数の機能性部位を繋ぎ合わせる手法が利用されてきた。以前に、幅広い機能性分子同士の連結に利用できる手法として、嵩高く、電子求引性のクロロ基やフルオロ基を両オルト位に有する芳香族アジドがトリアリールホスフィンと速やかに反応し、安定なアザイリドを形成することが明らかになった<sup>1,2</sup>。以前に我々は、2 種の芳香族アジドを用いて、安定アザイリド形成における反応速度の違いを利用することで 2 種のアジドを区別できることを明らかにし、ジアジドの 2 度のアザイリド形成が逐次的に進行することに成功した(図 1)。今回私たちは、これらの反応と CuAAC 反応を併用でき、ジアジドとアルキンを併せ持つ 3 分岐プラットフォームを用いて、3 成分を効率的に集積できることを明らかにした。実際に本手法を利用することで、3 つの機能性分子の集積に成功した(図 2)。

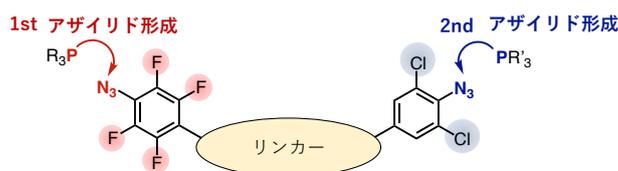


図 1

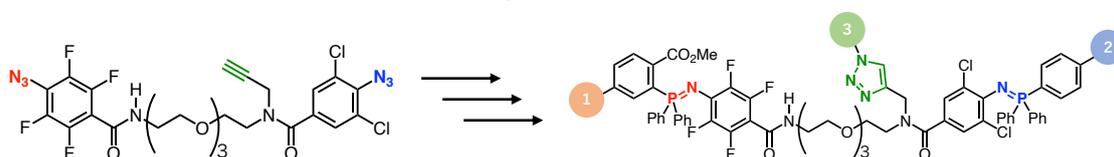


図 2

1) T. Meguro, N. Terashima, H. Ito, Y. Koike, I. Kii, S. Yoshida, T. Hosoya, *Chem. Commun.* **2018**, 54, 7904.

2) M. Sundhoru, S. Jeon, J. Park, O. Ramström, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2017**, 56, 12117