

学 会 参 加 報 告

日本薬学会 第142年会 - 5-ヨードピリドイミダゾイソキノリニウムの合成とその誘導体の蛍光特性

○川久保暢人、稲熊祐子、伊納義和、村田裕基、松村実生、古野忠秀、安池修之

愛知学院大学薬学部

【概要】

2022年3月25—28日、オンライン(名古屋)で開催された「日本薬学会 第142年会」に参加し、以下の研究内容を口頭発表した。

【目的】

イミダゾ[1,2-a]ピリジン誘導体は蛍光特性を持つ化合物が多く報告され、その物性や活用に注目が集まっている。しかし、イミダゾピリジンを縮環させたカチオン性の四環式複素環であるピリドイミダゾイソキノリニウムの合成例は非常に少なく、基礎物性も明らかにされていない。そこで今回、アルキル側鎖を持つイミダゾピリジンに対してヨウ素を用いた分子内閉環反応を利用して表題化合物の合成に取り組んだ。また、得られた5-ヨード体に対して、各種ボロン酸を用いた鈴木カップリングを施すことで5,6-二置換体へと誘導するとともに、得られた化合物群の蛍光特性を解析した。

【結果と考察】

2-(2-ヨードフェニル)イミダゾピリジンを菌頭反応に付し合成したアセチレン誘導体**1**に対してDCE溶液中、ヨウ素を作用させると、6-endo-dig型の閉環反応が進行し、6位にアリールならびにアルキル側鎖を持つ6種の新規化合物**2**を62—99%の良好な収率で得ることができた。**2a** ($R^1 = p\text{-Tol}$)はX線結晶構

造解析からピリドイミダゾイソキノリニウム構造をとっていること、四環性の母核部分の平面性が非常に高いことなどが判明した。さらに、得られたキノリニウム塩**2a**に対して各種ボロン酸**3**を用いた鈴木カップリングを行ったところ、18—67%の収率で5位の R^2 にアリール基やビニル基を持つ**4**に誘導することができた。得られた化合物**4**は蛍光発光を示し、蛍光スペクトルを測定したところ、13—54%の量子収率で420—454 nmに発光極大を持つことも判明した。さらに、得られた化合物**4**をヒト子宮頸がん細胞(HeLa細胞)に添加し、細胞内分布を共焦点レーザー顕微鏡で観察したところ、ビニルフェニル基を持つ化合物**4**が最も細胞内蛍光強度が強く、特に小胞体に局在することがわかった。

【感想】

今回は新型コロナウイルスの関係で、オンライン(Live形式)での学会発表を初めて経験しました。学外の先生方から質問やアドバイスをいただき、改めて自分の研究を見直すことができ、今後の研究課題も見つかりました。また、日本薬学会年会ということもあって非常に多くの高度な研究発表を聞くことができ、大変勉強になりました。

最後になりましたが、このような機会を与えていただいた愛知学院大学薬学会に感謝いたします。

