

N-アルキル共役イミン 光学活性物質の原料に

が 研 究 開 発
環 反 応

理化学研究所の田中克典准主任研究員、アンバラ・ラクマット・プラディプタ特別研究員らの研究グループは、生体内で分解しやすい化合物を新たな光学活性物質の原料(反応基質)にする環反応を開発した。生体内で合成される化合物「N-アルキル共役イミン」をホルムアルデヒドを共存させて合成すると、環化合物(6員または8員)に変換する。これを反応

基質に活用することで多種類の光学活性性ジアミン誘導体が合成できる。N-アルキル共役イミンは多彩な生命機能を担っていると考えられるが、不安定なため反応基質はもとより、生体内機能発現機構や化学的特性の本格的な検討も行われてこなかった。N-アルキル共役イミンは窒素原子にアルキル基を持つ共役イミン(炭素と窒素の二重結

合を一つ持ち、さらに異なる多重結合を併せ持つ化合物)。生体内に存在する共役アルデヒドと一級アルキルアミン(アミノアルコール)との反応で生成する。しかし、加水分解しやすく、酸や熱に対して極めて不安定とされている。

今回、共役アルデヒドとアミノアルコールに加え、ホルムアルデヒドとともに常温で混合したところ、100%環化合物に変換することを明らかにした。さらに6員環化合物と8員環化合物はN-アルキル共役イミン

(中間体)の置換基の種類によって作り分けられることも分かった。

また、これらの環化合物は共役アルデヒドの置換基に対して特定の立体異性体を選択的に生成することに着目。数工程の反応を経ることで、合成が難しかった40種類以上の光学活性ジアミン誘導体を得ることに成功した。これらの誘導体は金属触媒の配位子や生理活性物質の合成だけでなく、生体内アミンの挙動を調べる標的分子の原料としても重要な化合物とされる。