

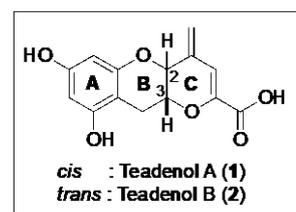
研究区分	教員特別研究推進 地域振興
------	---------------

研究テーマ	静岡県産発酵茶成分 Teadenol 類の合成研究				
研究組織	代表者	所属・職名	薬学部・助教	氏名	大内 仁志
	研究分担者	所属・職名	薬学部・准教授	氏名	吉村 文彦
		所属・職名	薬学部・講師	氏名	稲井 誠
		所属・職名		氏名	
	発表者	所属・職名	薬学部・助教	氏名	大内 仁志

講演題目	静岡県産発酵茶成分 Teadenol 類の合成研究
------	---------------------------

研究の目的、成果及び今後の展望

静岡の特産品である緑茶は古くから健康増進に効果的な飲料として日本人に親しまれている。緑茶に含まれるカテキン類はすぐれた効能を有しており、さらには食品に含まれる成分であることからその安全性が担保されている。近年、静岡酵母による微生物発酵茶葉中からアディポネクチン分泌促進作用や PTP1B 発現抑制作用を示す新規ポリフェノール Teadenol A (1) 及び B (2) が見出された。今回申請者は、1 及び 2 の作用機序解明のためのプローブ分子合成を目的として、まず本化合物の効率的合成法を確立すべく研究を行った。



Teadenol 類には、2 位の立体化学に依存してシス体とトランス体が存在するため、合成にあたっては 2 位の立体制御が鍵となる。そこで B 環の構築において Pd を触媒とした環化反応を利用することで、これらの作り分けが可能となる方法を開発した。まずフロログルシノール (3) より導いたアルデヒド 4 に対する不斉 α -アミノオキシ化反応により 3 位の不斉中心を構築後、共通中間体 6 を合成した。シス体の合成では、あらかじめ C 環を構築した 7 に対して環化反応を行うことで、ラクトン環の側鎖と同じ方向からフェノール性水酸基の求核攻撃が進行し、対応する 8 を立体選択的に得た。トランス体の合成では、C 環が開環した 9 に対し、酢酸存在下反応を行うことで、対応する 10 を立体選択的に得た。シス体 8 とトランス体 10 は、それぞれ後の変換により teadenol A (1) 及び B (2) へと変換可能であった。しかしながら、最終工程の塩基による脱保護において収率が非常に低くなってしまった。この理由として、teadenol 類は塩基性条件において速やかに多量化する性質を持っているのではないかと考えている。今後はこの予測を踏まえて合成ルートの改善による収率向上を行い、プローブ分子の合成を行っていく計画である。

