

ラジカル化学種の発生手法開拓

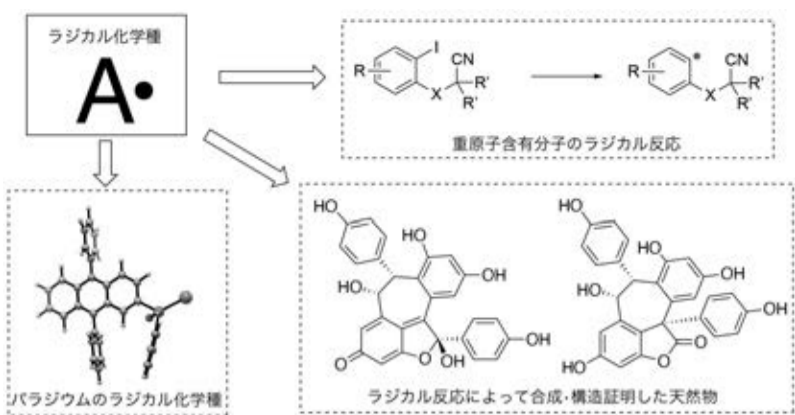
および合成化学展開

千葉大学大学院薬学研究院助教 中島 誠也

われわれの身の回りに存在している物質は分子でできている。分子は原子の集合体であり、原子と原子の結合は電子によって形成されている。電子が動く際には一般に二つがペアで移動し、分



ラジカル化学種を発生



奨励賞受賞研究



18〜21面

私たちは、D-グルコースおよびシクロペンタン環を含む構造が複雑な生物活性化合物の合成研究を行っている。その際、それら二つの部分構造の特性を生かした新規合成手法を開発し、確立した方法を標的分子の合成に応用する、ことを大きなコンセプトに掲げている。

D-グルコースは糖鎖だけでなく、エラシタンニンや配糖体など様々な

子の新たな結合の生成や結合の開裂が生じる。一方で、ペアがいない一つの電子は「ラジカル化学種」と呼ばれ、高い反応性を有している。そのため、ラジカル化学種の制御は医薬品などの物質を化学合成する「ものづくり」において重要である。このような観点から筆者は、ラジカル化学種を活用する研究を展開してきた。

さける代表的な方法として「光照射」がある。分子に光を吸収させると、ラジカルが二つ別々に存在する「ヒラジカル」状態になる。そこで筆者は

取り扱いが容易な可視光によるラジカル化学種の発生方法を模索した。その結果、重い原子を含有する分子が、特殊なメカニズムによって光を吸収

し化学反応を引き起こしていることを証明することに成功し、医薬品開発の基礎になり得る物質の化学合成や蛍光成分合成に応用した。また、可視光を照射することで、金属のラジカル化学種を効率的に発生させる配位子(金属に結合する原子)をコンピュータ計算でデザインし、実際に作り出すことに成功した。

自然界では、植物の中で合成される様々な分子の変換経路をコンピュータにより計算した。その結果、複数の分子において提唱されている化学構造が誤っていると算出された。

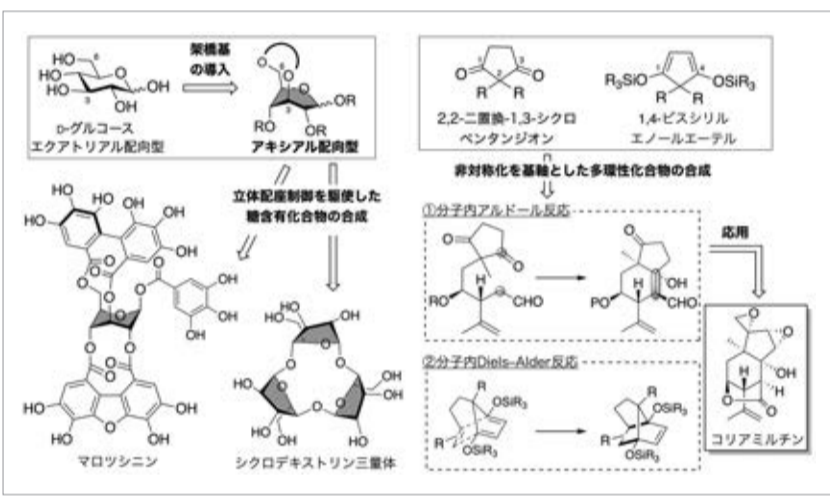
本研究成果のように、ラジカル化学種に関する研究は物質創成技術の基礎となる。日本の「ものづくり」の発展に寄与することを目標とし、これからも研究に邁進する所存である。

構造特性を利用する新規合成手法の開発と天然物合成への応用

名古屋市立大学大学院薬学研究科講師 池内 和忠

天然物に含まれている主要構造である。一般的にグルコース誘導体はエクアトリアル配向したイソ形配座を好むが、その安定配座と異なる配座を持つ化合物も存在する。特に、ポリフェノールに分類されるエラシタンニンの中にグルコースの立体配座がアキシアル配向型となっているものがいくつか見られる。私たちは、グルコース3,6位ヒドロキシ基に架橋基を導入することでヒラノース環の立体配座をアキシアル配向型に制御することに成功し、エラシタンニンの一つであるマロツシニンの合成に応用した。この本方法論を発展させ、こ

れまで合成不可能と考えられていたシクロペナントリニ三量体の初の化学合成に成功した。一方で、シクロペンタン環はテルペノイドを合



例えは、植物毒として知られているコリアミルチンの二環性骨格を、分子内アルドール反応を利用して立体的に構築することに成功し、本方法をコリアミルチンの合成に応用した。また、1,3-シクロペンタンジオン部位を1,4-ビスシリルエノールエーテル構造に変換し、その分子内Diels-Alder反応によって特異的な構造を持つ三環性化合物を合成した。

祝 日本薬学会 第143年会

(順不同)



神戸薬科大学

〒658-8558 神戸市東灘区本山北町四一一九一
電話 〇七八(四五三)〇〇三一



兵庫医科大学薬学部

〒650-8530 神戸市中央区港島一三三
電話 〇七八(三〇四)三〇〇〇

第一薬科大学

〒815-8511 福岡市南区玉川町二二一
電話 〇九二(五四一)〇一六一



公益社団法人 日本薬剤師会

〒160-8389 東京都新宿区四谷三三三
電話 〇三(三三五三)一一七〇番



一般社団法人 日本病院薬剤師会

〒150-0002 東京都渋谷区渋谷二二二
電話 〇三(三四〇六)五三〇三番

一般社団法人 愛知県病院薬剤師会

〒460-0002 名古屋市中区丸の内三二四
電話 〇五二(七四四)二六七四



一般財団法人 日本医薬情報センター

〒150-0002 渋谷区渋谷二二二
電話 〇三(五四六六)一八一一番



Pharmaceutical and Medical Device Regulatory Science Society of Japan
一般財団法人 医薬品医療機器レギュラトリーサイエンス財団

〒150-0002 東京都渋谷区渋谷二二二
電話 〇三(三四〇〇)三二一五番