

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

研究テーマ	健康増進効果が期待されるハイブリットポリフェノールの合成				
研究組織	代 表 者	所属・職名	静岡県立大学薬学部・准教授	氏名	稲井 誠
	研究分担者	所属・職名	静岡県立大学薬学部・教授	氏名	濱島 義隆
		所属・職名		氏名	
		所属・職名		氏名	
	発 表 者	所属・職名	静岡県立大学薬学部・准教授	氏名	稲井 誠

講演題目
シリビン類の合成研究
研究の目的、成果及び今後の展望 静岡の特産品である温州ミカンや静岡茶は、健康増進に効果的なポリフェノールを多く含有しており、生活習慣病の予防や健康寿命の延伸に大きく貢献している。これらポリフェノールには、分子内に複数のリグナンやネオリグナン骨格を持つ複合（ハイブリット）型ポリフェノールが存在し、興味深い生物活性を示す。その例として、サプリメントとして市販されているマリアアザミ（シリマリン）に含まれるシリビン類が知られている。シリビン類は、サプリメントとして肝保護作用や皮膚老化の抑制作用を有している他、低酸素誘導因子-1 (HIF-1) の阻害作用に起因する抗腫瘍活性など医薬品として期待される生物活性も報告されている。しかし、シリビン類は、精製困難であるため <i>in vivo</i> 試験が実施できる量を天然資源より供給することは困難であり、化学合成による供給が望まれている。本研究では、超高齢化の進む現代社会において課題となっている「健康寿命の延伸」に寄与すると期待される (+)-シリビン A (1) の効率的な合成経路の確立に取り組んだ。 実際の合成では、まず、容易に合成可能な環化前駆体 2 を酸性条件に付すことでベンゾジオキサン 3 を合成した。一方、<i>m</i>-NPT-スルホン 6 は、フロログルシノール (4) を出発原料に、アルコール 5 を経由して合成した。得られた 3 と 6 を当研究グループにて開発した改良 Julia-Kocienski 反応により連結し、スチレン誘導体 7 へと高い選択性 (<i>trans/cis</i> =>20:1) にて変換した。最後に、Sharpless 不斉ジヒドロキシ化により立体化学を構築した後、酸性条件にてフラバノール骨格を構築することで(+)-シリビン A (1) の全合成を達成した。 