

# 氏名 西井良典

## 目的別テーマ：高次機能創出加工

### 15年度研究テーマ

15-3-21：生理活性繊維を目指した光学活性有機化合物（モノマーおよびポリマー）の合成

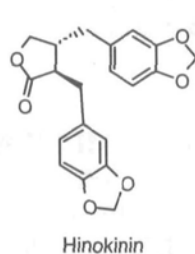
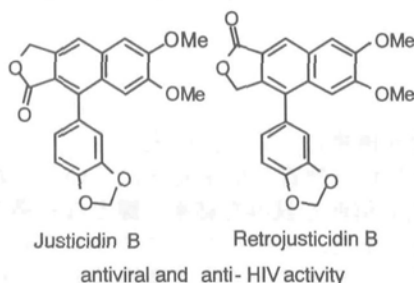
### ABSTRACT

We are going to apply optically active organic compounds having biological activity, for example, antiviral, anti-HIV, anti-PAF, anti-malarial, anti-fungal, anti-tumor activity, to biologically active textile. In order to create the polymer, we synthesize several natural compounds as biologically active monomers. These monomers are applying to connect on the polymer chain next. The other purpose is to find the new methods and new reactions for preparing monomers and polymers.

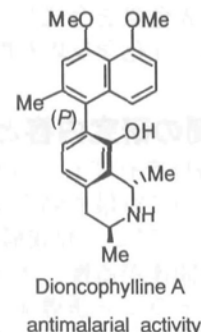
### 研究目的

現在市販されている防虫繊維・抗菌繊維の活性持続性は十分に長くはなく、既存の殺虫剤や抗ウイルス剤と同等の生理活性に至っていない。そこで長期持続性あるいは半永久的な生理活性作用（防虫作用・抗ウイルス作用など）を有する繊維の開発を目的とし、従来の活性を上回る生物活性化合物（モノマー）を合成する。また、モノマーをオリゴマー・ポリマーへ拡張し、ナノスケールで防虫・抗菌・抗ウイルス活性を有する超分子を合成する。それぞれモノマーのリード化合物は天然有機化合物をモデルに選定する。

### 一年間の研究内容と成果



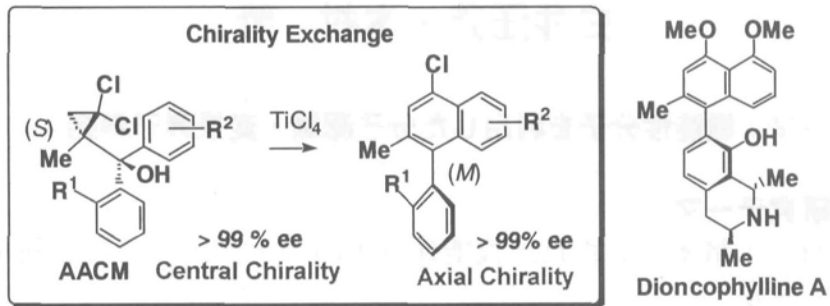
antiviral, antifungal, pesticidal activities



リグナンラクトン類は天然に数多く存在する化合物群で、血小板凝結抑制、抗 HIV 活性、抗ウイルス活性、抗腫瘍活性、抗菌活性 など広範囲の生理活性を有する天然物であることが明らかになってきた。リグナンラクトン類の中で、Justicidin B (抗ウイルス活性)、Retrojusticidin B (抗 HIV 活性)、Dehydrodesoxydopodophytotoxin (抗腫瘍活性) の合成を達成した (Scheme 1)。さらに、光学活性リグナンラクトン：Hinokinine (ヒノキから抽出される天然物で、強力な抗ウイルス活性、抗菌活性、殺虫活性を有する。天然成分として安全性が高く、環境に優しい農薬としても注目されている。) の鍵中間体を合成したが、現在合成途中である。

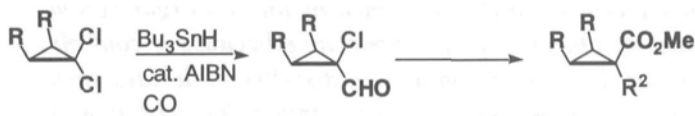
抗マラリア活性を有する軸不斉アルカロイド Dioncophylline A のモデル化合物合成も検討した。現在、鍵反応となる中心不斉から軸不斉への高度なキラリティー変換反応を見出した (Scheme 2)。不斉収率は 99% ee を達成した。また、この鍵反応を使って、軸不斉アルカロイド Dioncophylline A の全合成を行っている。この生理活性化合物の合成途中で、いくつかの新規有機合成反応を見出した。例えば、従来、難しいとされていた C-Cl 結合の脱塩素-リチオ化反応 (Scheme 4) や脱塩素ホルミル化反応 (Scheme 3) を見出した。これらは、環境問題になっている有機塩化物の脱塩素反応に応用でき、さらに有用有機化合物への変換例を示した。

Scheme 2



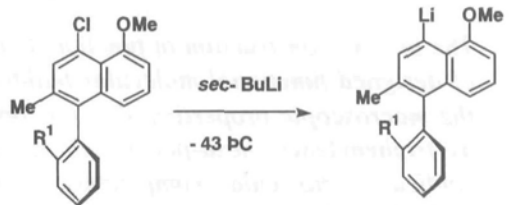
Scheme 3

Dechlorination Reaction



Scheme 4

Dechlorination Reaction



## 展望

今後、現在合成途中の生理活性化合物 Hinokinin, Dioncophylline A の全合成を達成したい。いくつかの生理活性を有する光学活性モノマーを繊維に担持させて、生理活性を測定する予定である。一方で、合成途上で見出した新規有機合成反応を一般化し、実用的有機反応にしたい。環境問題になっている有機塩化物の脱塩素反応に応用できる。