オマエザレン誘導体の合成研究

Synthetic study on omaezallene derivatives

水谷央、梅澤大樹、松田冬彦(北大院環境)

オマエザレン (1)は、ソゾ属の紅藻から単離された。1 は特徴的な3種の臭素原子を有することが特徴である。また、海中構築物に多大な損害を与えるタテジマフジツボのキプリス幼生に対し、強い付着阻害活性(EC50)を示す反面、低毒性である。付着阻害剤として使用されてきた毒性の強い有機スズ化合物に比べると対照的であり、環境保護の観点から本化合物をリードとした新規付着阻害剤として期待されている。当研究室では、構造決定を伴う1と9-epi-オマエザレン (2)の全合成を達成し、これらの活性試験の結果、2の活性が低下したことから、

Omaezallene(1) : EC_{50} = 0.46 $\mu g/mL$ [α]_D -88.2 (c 0.91, CHCl₃)

2 : EC_{50} = 1.1 µg/mL [α]_D +108 (c 0.23, CHCl₃)

立体配置と活性の相関に興味が持たれる。一方、1のブロモアレンの絶対配置は、比旋光度をもとに推定され、全合成により決定されている。これは Lowe 則と呼ばれており、R の時は負の値を、S の時は正の値を示す。Lowe 則には、2 のような他の置換基に由来する例外が指摘されており、例外のない決定法の開発が望まれている。

以上の研究背景から、活性測定とブロモアレンの配置決定法開発のためのサンプル供給に向けて、1の鏡像異性体(ent-1)と、そのブロモアレン部の異性体(ent-1-epi-1)の合成を進め、ブロモアレン 4a および 4b へと導いた。また、ブロモアレンの絶対立体配置の決定法として、真空紫外(VUV)領域の高エネルギー遷移に基づく CD スペクトル(VUVCD)が有用であることを、各ブロモアレン中間体を用いた測定から明らかにした。

発表者紹介

氏名 水谷央(みずたになかば)

所属 北海道大学大学院環境科学院

環境物質科学専攻生体物質科学コース

学年 M2

研究室 松田研究室

E-mail mizutani0214@eis.hokudai.ac.jp

