

研究成果報告書

(国立情報学研究所の民間助成研究成果概要データベース・登録原稿)

研究テーマ (和文) AB	サンドイッチ天然物の創出と機能評価				
研究テーマ (欧文) AZ	Development and evaluation of sandwich natural products				
研究氏 代表名 者	カタカナ CC	姓) クラモチ	名) コウジ	研究期間 B	2017 ~ 2018 年
	漢字 CB	倉持	幸司	報告年度 YR	2018 年
	ローマ字 CZ	Kuramochi	Kouji	研究機関名	東急理科大学
研究代表者 CD 所属機関・職名	東京理科大学理工学部応用生物科学科・准教授				

概要 EA (600 字~800 字程度にまとめてください。)

Juglomycin C (2) から Juglorubin (1) へのワンポット変換法を開発し、Juglorubin (1) の世界初の全合成を達成した (図)。Juglomycin C (2) の二量化反応を検討した結果、リン酸緩衝液 (pH 8.5) 中、酸素存在下で所望の反応が進行し、Juglorubin 前駆体 3 が得られた。反応条件の最適化を行い、ヨウ化ナトリウム (NaI) と 2-methyl-2-butene を添加する条件で、反応の収率及び選択性の向上に成功した。また Juglorubin 前駆体 3 の側鎖水酸基の脱水は酢酸-メタノール中で進行した。最終的に二段階の反応を集約し、Juglorubin (1) のワンポット合成に成功した (収率 48%)。これにより前例のない五環性骨格を有する Juglorubin (1) の効率的合成法を確立した。また Juglomycin C (2) から Juglorubin 前駆体 3 への変換が緩衝液中で自発的に進行したことから、生合成においても同様の反応が非酵素的に進行している可能性が示された。つまり Juglorubin (1) の化学合成を通して生合成に関する知見を得た。さらに合成した Juglorubin (1) の紫外・可視吸収スペクトルと蛍光スペクトルを測定した。蛍光スペクトルは 630 nm を極大とし、近赤外領域に及んだ。Juglorubin 類が蛍光を発することは報告されておらず、今回の発見は新規蛍光材料の開発等にもつながる成果である。以上の研究成果は国際誌 *Organic Letters* に発表した。またつい最近、juglorubin 誘導体が枯草菌に対して強い抗菌活性を有し、がん細胞の増殖を抑制することも見出した。現在、juglorubin の鉄錯体の形成を検討している段階である。

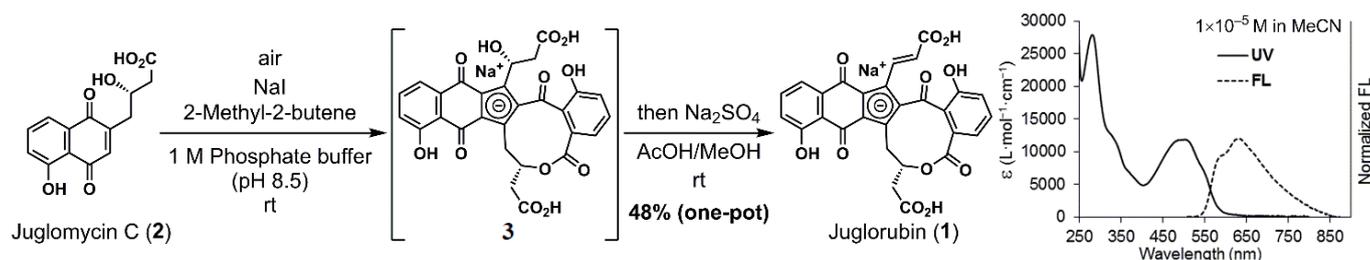


図. Juglorubin (1) のワンポット合成と、紫外・可視吸収スペクトル (実線) および蛍光 (破線)

キーワード FA	天然物	1,4-ナフトキノン	サンドイッチ化合物	二量化
----------	-----	------------	-----------	-----

(以下は記入しないでください。)

助成財団コード TA					研究課題番号 AA					
研究機関番号 AC					シート番号					

発表文献（この研究を発表した雑誌・図書について記入してください。）									
雑誌	論文標題 ^{GB}	Bioinspired Synthesis of Juglorubin from Juglomycin C							
	著者名 ^{GA}	Shogo Kamo, Kouji Kuramochi, Kazunori Tsubaki	雑誌名 ^{GC}	Organic Letters					
	ページ ^{GF}	1082~1085	発行年 ^{GE}	2	0	1	8	巻号 ^{GD}	20
雑誌	論文標題 ^{GB}								
	著者名 ^{GA}		雑誌名 ^{GC}						
	ページ ^{GF}	~	発行年 ^{GE}					巻号 ^{GD}	
雑誌	論文標題 ^{GB}								
	著者名 ^{GA}		雑誌名 ^{GC}						
	ページ ^{GF}	~	発行年 ^{GE}					巻号 ^{GD}	
図書	著者名 ^{HA}								
	書名 ^{HC}								
	出版者 ^{HB}		発行年 ^{HD}					総ページ ^{HE}	
図書	著者名 ^{HA}								
	書名 ^{HC}								
	出版者 ^{HB}		発行年 ^{HD}					総ページ ^{HE}	

欧文概要 EZ

The synthesis of juglorubin, a natural red dye, from juglomycin C, a plausible biogenetic precursor, has been accomplished. Sequential intermolecular and intramolecular Michael additions of juglomycin C, oxidation, and skeletal transformation proceeded in phosphate buffer to afford an undehydrated derivative of juglorubin. Subsequent dehydration of the secondary alcohol afforded juglorubin. The one-pot synthesis of juglorubin from juglomycin C was also achieved. The photophysical properties of synthetic juglorubin and its derivatives were evaluated. Furthermore, the antibacterial and cytotoxic activity of five synthetic compounds were evaluated. Among them, some juglorubin derivatives show the antibacterial activity against *Bacillus subtilis*, and cytotoxic activity against human cancer cells.