

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

研究テーマ	みかん含有フラボノイド類の短工程合成法開発と機能性探索研究				
研究組織	代表者	所属・職名	食品栄養科学部・助教	氏名	繁田 堯
	研究分担者	所属・職名	食品栄養科学部・客員准教授	氏名	海野 けい子
		所属・職名		氏名	
		所属・職名		氏名	
	発表者	所属・職名	食品栄養科学部・助教	氏名	繁田 堯

講演題目	みかん含有フラボノイド類の短工程合成法開発と機能性探索研究
研究の目的、成果及び今後の展望	<p>みかんは様々なファイトケミカルを有する健康に良い果物である。主要なみかんの産地である静岡県三ヶ日町では 10 年間の栄養疫学調査によってみかんの健康効果と含有成分との関係が明らかになった。また三ヶ日みかんは含有成分に関して網羅的に解析されている。一方で生物活性の報告があるフラボノイドのうち、みかんの機能性表示成分として認められた物質は存在しない。みかんは植物に一般的なフラボノールや、柑橘系に見られるフラバノン・フラボンなど多数のフラボノイドが含まれるが、各成分は混在しており個々の活性が評価し難い。フラボノイドの簡便合成法を開発すれば、フラボノイド類の活性を個別に解明できる。みかんの健康効果が明らかになることで、静岡県の地域産業活性化や県民の健康寿命延伸に繋がる。本研究ではみかん由来フラバノンとフラボンの合成法を開発し、化合物の脳機能に対する生物活性を評価する。フルオロベンゼン <b>1</b> に対しカルボニル等価体 <b>2</b> を反応させて環化前駆体を合成する。続いて改良した芳香族求核置換反応 (<math>S_NAr</math> 反応) を用い多様なフラボノイドの短工程合成法を開発する。合成法を確立後、複数のユニットを組み合わせみかん含有フラボノイドのライブラリーを構築する。作成したライブラリーは、マウスの学習能力に与える影響のスクリーニングに使用し、フラボノイドが持つ未知の機能性を明らかにする。</p> <p>令和 5 年度の研究成果として、リチウム-ハロゲン交換反応によって <b>1</b> のアリールリチウムを調整後、芳香環上に置換基を持たない <b>2</b> (<math>R^2 = H</math>) を加えて反応を行い、カップリング体 <b>3</b> を合成した。これまでに改良型 <math>S_NAr</math> 反応の研究を進める中でシリル系保護基で保護されたヒドロキシ基が <math>S_NAr</math> 反応の求核種として利用可能であることを明らかにしたため、<b>3</b> を環化前駆体として <math>S_NAr</math> 反応の検討を進めている。最適条件を決定後に種々の環化前駆体を合成し、フラバノンのライブラリーを構築する。また酸化反応を経由してフラバノンからフラバンの合成を試みる。</p> 