

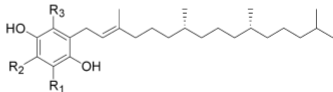
26PE-am150

イソプレナムを基盤としたトコフェロール生合成前駆体フィチル化キノールのLDL抗酸化剤分子設計

○白井 齊¹, 宇都 義浩¹, 大津木 護¹, 大友 直紀¹, 中田 栄司¹, 永澤 秀子², 堀 均¹ (徳島大学院ソシオテクノサイエンス研究部,²岐阜薬大)

【目的】動脈硬化の原因として、LDLの酸化が関係していると言われており、動脈硬化を予防するために、LDL抗酸化剤の開発が求められている。ビタミンEは抗酸化剤として知られているが、その前駆体であるフィチル化キノールが生合成経路においてどの程度存在するのか、また、抗酸化活性を示すのかについては報告されていない。そこで、フィチル化キノールに着目したアナログを分子設計し、LDL抗酸化活性について検討した。

【結果及び考察】メチル置換フェノールをフィチル化し、フレミー塩を用いた酸化反応によりキノン化した後、水素化ホウ素ナトリウムによる還元反応により各種フィチル化キノール TX-2254, TX-2247, TX-2242, TX-2231 を合成し、TBARS解析による LDL 抗酸化活性を評価した。結果から、トコフェロールではメチル基の違いにより抗酸化活性に大きな差があることが知られているが、フィチル化キノールではその差はほぼないことが示唆された。また、非天然型のフィチル化キノールについても LDL 抗酸化活性を探るべく、分子設計を進めた。



- TX-2254 (R₁ = R₂ = R₃ = CH₃)
- TX-2247 (R₁ = R₃ = CH₃, R₂ = H)
- TX-2242 (R₁ = R₂ = CH₃, R₃ = H)
- TX-2231 (R₁ = CH₃, R₂ = R₃ = H)
- Designed compound (R₁ = R₃ = H, R₂ = CH₃)