

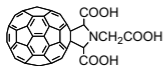
28N-pm05

シクロペンタンを有する新規水溶性フラーレン誘導体の合成

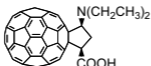
○近藤 祥子¹, 高橋 恭子¹, 中村 成夫¹, 増野 匡彦¹(¹慶応大薬)

【目的】当研究室では、脂溶性の高いフラーレン (C₆₀) に種々の水溶性基を付加させることで様々な水溶性フラーレン誘導体を合成し、生理活性の検討を行ってきた。そして、ピロリジンを基盤とするプロリン型は HIV 逆転写酵素 (HIV-RT) 阻害活性、また、カチオン性を示すピロリジニウム型は、アポトーシスによるがん細胞増殖抑制効果を示すことを明らかにした。今回、新規骨格を有するフラーレン誘導体を合成する目的で、5員環内に窒素原子を含まないシクロペンタンがフラーレンに縮合した誘導体 **1**、**2** をデザインした。**1** は、プロリン型類似化合物であり、シクロペンタンの置換基として第三級アミンを導入した。**2** は、ピロリジニウム型類似化合物であり、シクロペンタンの置換基として第四級アンモニウムを導入した。

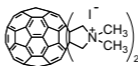
【方法・結果】C₆₀ を *o*-dichlorobenzene (ODCB) に溶解し、triethylamine と、ethyl glyoxylate を加え 1 時間還流し、**1** の前駆体であるエチルエステル体を得、続いて sodium hydride と反応させ **1** を得た。また、C₆₀ を ODCB に溶解し、triethylamine を加え 2 時間還流し、得られた **2** の前駆体を methyl iodide により *N*-メチル化し、**2** を得た。合成した **1**、**2** について、HIV-RT 阻害活性及びがん細胞増殖抑制効果を検討した。



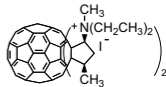
プロリン型



1



ピロリジニウム型



2