

21PO-pm021

スウェルチアマリンの酵素加水分解によるゲンチアニンオキシドの選択的合成
○藤井 幹雄¹, 倉持 大樹¹, 中久喜 雄飛¹, 紺野 奇重¹, 平井 康昭² (¹国際医福大薬,
²昭和大富士吉田教育部)

【目的】スウェルチアマリンはセンブリの苦味配糖体で、生薬中 2~10%含まれている。スウェルチアマリンが酵素加水分解を受けるとドミノ反応が起こり、エリスロセントaurinやゲンチアニンなど様々な化合物を与えることから、この反応をうまく制御すれば複雑な構造を持つ化合物を容易に合成できると考えられる。今回、我々はスウェルチアマリンの酵素加水分解について検討を行い、ヒドロキシルアミンを共存させることでゲンチアニンオキシドを選択的に得る条件を見出したので報告する。

【結果および考察】スウェルチアマリンをβ-グルコシダーゼで加水分解すると、反応性の高いアグリコンが生成する。このアグリコンが共存するヒドロキシルアミンと反応し、ピリジンオキシド環を形成する。この反応条件を検討することにより、ゲンチアニンオキシドを収率 81%で得ることができた。本発表では、ゲンチアニンオキシドの生成機構についても報告する。ゲンチアニンは、糖尿病治療薬として期待されており、スウェルチアマリンから 1 工程でゲンチアニンオキシドが得られることは、今後の創薬研究の発展につながるものと期待している。

