

氏 名	西 永 俊 也 にし なが とし なり
学 位 の 種 類	薬 学 博 士
学 位 記 番 号	薬 博 第 87 号
学位授与の日付	昭 和 47 年 1 月 24 日
学位授与の要件	学 位 規 則 第 5 条 第 1 項 該 当
研 究 科 ・ 専 攻	薬 学 研 究 科 薬 学 専 攻
学 位 論 文 題 目	フッキソウ <i>Pachysandra terminalis</i> Sieb. et Zucc. のアル カロイド研究補遺
論文調査委員	(主 査) 教 授 犬 伏 康 夫 教 授 藤 田 栄 一 教 授 井 上 博 之

論 文 内 容 の 要 旨

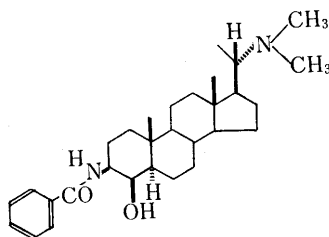
すでに富田, 菊池, 上尾らによりツゲ科 Buxaceae 植物フッキソウ *Pachysandra terminalis* Sieb. et Zucc. から多数の新アルカロイドが単離され, その内, 大部分の構造が解明された。

著者は, 構造未解決の 2 種の塩基を検討し, その化学構造を明らかにすることができた。更に ergosterol より pachysandrine 型塩基及び pachystermine 型塩基への変換も行った。

(1) Epipachysandrine-A の構造

フッキソウの副アルカロイドの一つである epipachysandrine-A について種々の化学反応, 並びに分光学的データから, これが (I) 式で示されることを証明した。

本塩基は, フッキソウの主塩基の一つである pachysandrine 類 (IV, V, VI: 3α 配置) に比べて C_3 位のアミノ置換基が逆の立体配置を有し, また(3)に述べる pachystermine 類 (VIII, IX) および窒素を含む 7 員環ラクトンを持つ pachysantermine-A と同じ立体配置を有し, 生合成的に興味深い。



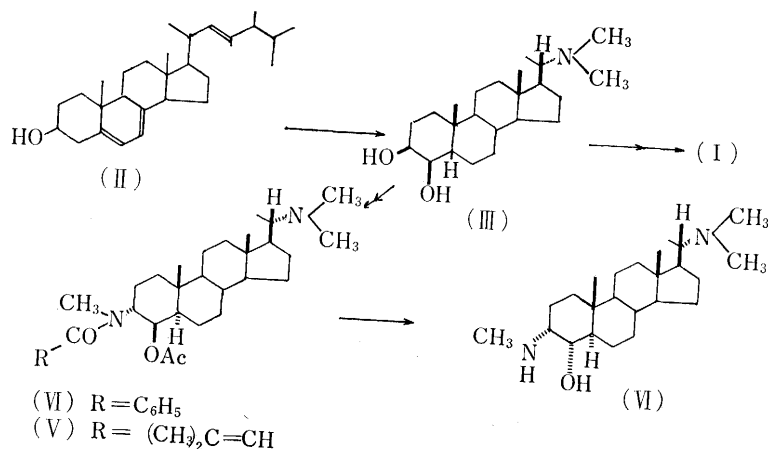
(I)

(2) Pachysandrines 及び epipachysandrine-A の合成

フッキソウ塩基の内, pachysandrine-A (IV), -B(V), -C(VI) 及び epipachysandrine-A (I) は C_4 位に酸素官能基を有する pregnane 型アルカロイドで, 天然から最初に見出された例である。

著者は, 3β , 4β -diol (III) を出発原料として, これらの塩基を立体特異的に合成した。なお diol (III)

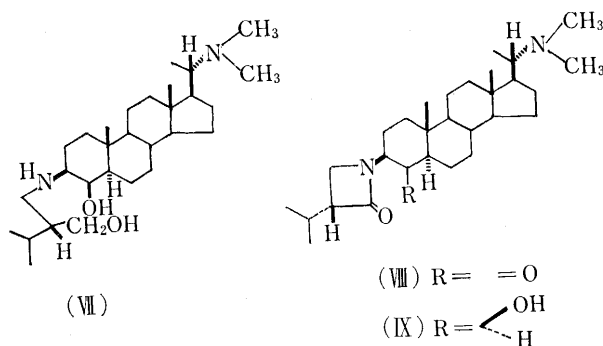
はすでに ergosterol より誘導されているので、上記4種のアルカロイドは ergosterol より合成されたことになる。



(3) Epipachysandrine-A より pachystermine-A, -B への変換

Pachystermine-A (VIII) 及び -B (IX) は、天然有機化合物としては特異な β -ラクタム環を有する pregnane 型アルカロイドである。

著者は、これらの塩基を、比較的簡単な構造を有する epipachysandrine-A (I) から pachystermine-diol (VII) を経て合成した。Epipachysandrine-A は、前述の如く ergosterol (II) から合成されたので、pachystermine-A, -B が ergosterol から合成されたことになる。



(4) Spiropachysine の構造

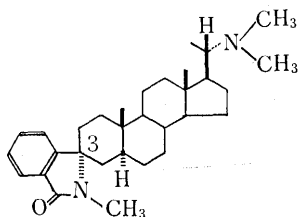
Spiropachysine (X) は、フッキソウの全草を抽出した際に副塩基の一つとして単離され、Base VI と仮称して報告されたアルカロイドである。

著者は今回、フッキソウの葉部を検索し、本アルカロイドが、葉部の主アルカロイドであることを確認した。

次いで、その構造研究に着手し、分解反応、合成反応などにより、本塩基が zo α -dimethylaminopregnane 型アルカロイドであり C₃ 位にスピロ型ラクタム環を有するものであることを明らかにした。

更に CD を測定し、phenyl 発色団に基づく Cotton 効果を検討し、C₃ 位の立体化学を決定した。

以上の結果, spiropachysine は (X) 式で示されることを決定した。



論文審査の結果の要旨

ツゲ科に属するフッキソウは古来アイヌが民間薬として用いて来た植物であるが、本植物からは既に多数の塩基が単離され、構造が確定しているものも多い。

著者はなお未解決に残されていた2種の塩基の構造について種々の化学反応並びに分光学的データをもとにその構造を確定した。このうちスピロパキシンはプレグナン系塩基でははじめの3位にスピロ型ラクタム構造をもつ塩基である。また構造の確定しているこの系統の4種の塩基をエルゴステロールから合成するルートをも完成した。

これらの研究はプレグナン系塩基の化学に関して新知見を加えたものである。

よって、本論文は薬学博士の学位論文として価値あるものと認める。