

琉球大学学術リポジトリ

[記事](研究発表会要旨)ゲットウ精油成分を原料とした環状有機リン化合物の合成と生物活性

メタデータ	言語: 出版者: 南方資源利用技術研究会 公開日: 2014-10-26 キーワード (Ja): キーワード (En): 作成者: 平良, 栄彦, 多和田, 真吉, 小波本, 直忠, 安田, 正昭, 当山, 清善, 宮里, 正 メールアドレス: 所属:
URL	http://hdl.handle.net/20.500.12000/0002017298

ゲットウ精油成分を原料とした環状有機リン化合物の合成と生物活性

琉球大学農学部 ○平良榮彦・多和田真吉・小波本直忠・

安田正昭・当山清善

琉球産経(株)

宮里 正

[目的]

ゲットウは、鹿児島県佐多岬を北限とし沖縄、小笠原、台湾、東南アジアに分布するショウガ科の多年生植物で沖縄では県内いたるところに自生している熱帯・亜熱帯の生産性の高い未利用のバイオマス資源である。その葉や根茎、種子も香料・色素、防虫・防腐、農薬、あるいは医薬となる有用成分を含み、多様な可能性を秘めた重要な産業資源となり得るものと期待されている。本研究は、より活性の高い化合物を合成することを目的として、L-アミノ酸とゲットウ精油成分をリン剤で閉環し新規1,3,2-オキササ[△]ホスフォリシ[△]ン類を合成した。その生物活性を調査し、化学構造と活性の相関関係を検討した。

[方法]

始めに塩化チオニルを用いてL-アミノ酸からL-アミノ酸メチルエステルを合成し、これを水素化ホウ素ナトリウムで還元して2-アミノアルコール類を合成した。これを塩化チオホスホリルで閉環させた後、ゲットウ精油成分と反応させ、1,3,2-オキササ[△]ホスフォリシ[△]ン類を合成した。化合物の化学構造式についてはIR吸収スペクトル、マススペクトル、¹H-NMR、¹³C-NMRスペクトルを解析することにより決定した。植物病原菌に対する抗菌活性は薬剤混入寒天培地に菌を接種し3日後の菌糸の発育面積を調べ阻害率を算出した。イエシロアリに対する殺蟻活性は薬剤処理したろ紙をシャーレの底に敷きイエシロアリ職蟻30頭を投入して2週間後の死亡虫数を観察した。

[結果]

25種類の新規1,3,2-オキササ[△]ホスフォリシ[△]ン類を合成した。フェニルアラニンとロイシン誘導体はピシウム菌と炭そ病菌について試験しバリン、イソロイシン、アラニン誘導体はピシウム菌と白絹病菌について試験した。ピシウム菌に対する阻害試験では100ppm濃度で4-Isopropyl-2-geranioxy-1,3,2-oxazaphospholidine 2-sulfide (Val-PS-G) が68.2%、4-Isopropyl-2-citronelloxy-1,3,2-oxazaphospholidine 2-sulfide (Val-PS-C) が87.3%の抗菌活性を示し、炭そ病菌に対しては100ppm濃度で4-Isobutyl-2-thymoxy-1,3,2-oxazaphospholidine 2-sulfide (Leu-PS-T) が59.2%の抗菌活性を示し、白絹病菌に対しては100ppm濃度でVal-PS-Gが68.6%の抗菌活性を示した。抗菌活性についてはバリンから誘導された化合物は他のアミノ酸から誘導された化合物より比較的強い阻害活性を示した。イエシロアリに対する殺蟻活性試験では1.0mg/ろ紙(径8.5cm)濃度で、

4-Isobutyl-2-geranioxy-1,3,2-oxazaphospholidine 2-sulfide (Leu-PS-G) ,

4-Isobutyl-2-citronelloxy-1,3,2-oxazaphospholidine 2-sulfide (Leu-PS-C) ,

4-Isobutyl-2-phenethoxy-1,3,2-oxazaphospholidine 2-sulfide (Leu-PS-PA)

が100%の殺蟻活性を示した。