

アズレン化合物およびその応用

木村崇知*†

*甲南化工(株) 大阪府高槻市中川町5-21 (〒569-0066)

† Corresponding Author, E-mail: kimura@konankako.co.jp

(2019年2月14日受付, 2019年3月26日受理)

要 旨

アズレン化合物は、化学的、物理的性質から多分野で応用されている。また、ベンゼン、チオフェンなどの芳香族環が縮環した芳香族縮環アズレンもアズレン同様興味深い性質・機能の発現が期待されている。本稿では、原薬として利用される水溶性アズレンの紹介と新規アズレン誘導体の応用例を紹介する。

キーワード：アズレン、水溶性アズレン、芳香族縮環アズレン、光学活性アズレンアルコール、がん細胞阻害薬、アズレニウム色素

1. はじめに

トロピリウムイオン、トロポロン等の共役7員環化合物は、芳香族としての性質と反応性に富むπ電子系としての両面をもち、構造有機化学的に面白い構造である。不飽和7員環を構造にもつアズレンは、共役7員環と共役5員環とが縮環した典型的な非ベンゼン系芳香族炭化水素であり、有機合成化学のターゲットとしても興味深い。アズレンおよびその誘導体は、その縮環構造に基づく高い電子供与性能（エネルギーの高いHOMO準位）と高い電子受容性能（エネルギーの低いLUMO準位）を備えた特異な反応電子系をもつため化学的、物理的な諸性質に関し、従来から広範な研究がなされてきた。

また、アズレンにベンゼンやチオフェンなどの芳香族が縮環した芳香族縮環アズレンもアズレン同様、あるいはそれ以上に興味深い性質・機能の発現が期待されるが、芳香族縮環アズレンの合成は合成の難易度が高く、現在、十分に研究が進んでいない。

2. アズレンについて

アズレンはベンゼン系の最も簡単な縮環化合物であるナフタレンの異性体であるが、ナフタレンとはきわめて異なった性質を示す。このことは、ナフタレンが非極性であるのに対して、アズレンは炭化水素でありながらπ電子の不均一な分布によって極性構造をとることに起因する。このとき、アズレンは7員環から5員環方向へ1.08Dの双極子モーメントを有する。

アズレンの共鳴構造は、図-1に示したような周辺10π系の構造

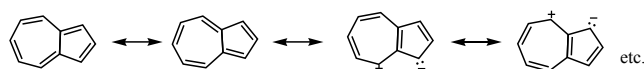


図-1 アズレンの共鳴構造

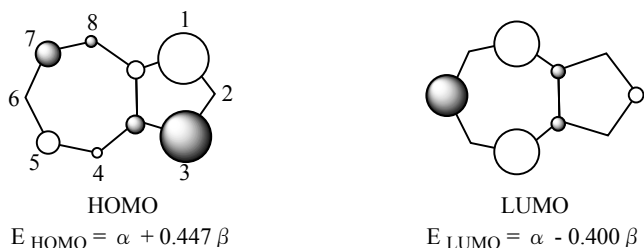


図-2 アズレンのHOMOとLUMO

と分極したイオン構造との寄与があり、この分極構造に基づく分子内CT遷移により、アズレンは濃青色を有している。また、アズレンの反応性は、上の共鳴構造式およびHOMOとLUMOの係数から明らかのように、5員環部分の1,3位は求電子置換を受けやすく、7員環部分の4,6,8位は求核置換を受けやすい（図-2）。

さらに、硫酸やトリフルオロ酢酸などの強酸中ではアズレンはアズレニウムイオンとなり、溶解する特徴がある。

3. アズレンの消炎作用と医薬品への応用

3.1 グアイアズレンおよび水溶性アズレンについて

カミツレは古くから薬用として用いられ、その薬効はとくに優れていることが知られている。薬用としては、胃腸薬、風邪薬、目薬、浴湯料、ぜん息、湿しん、紫外線による皮膚炎、各種炎症による急性皮膚炎に対し消炎、抗アレルギー、組織再生剤として優れた効果を発揮する。このカミツレの有効成分はカマアズレンと言われる青色の7員環構造の炭化水素であることが知られている。その後、グアイアク樹（癒瘡木）から得られるグアイアズレンが従来のカマアズレンとまったく同じ薬理効果を有することが発見された。このグアイアズレンは、多くの精



〔氏名〕 きむら たかとも
〔現職〕 甲南化工(株)試験室 室長
〔趣味〕 魚釣り
〔経歴〕 1992年岡山理科大学生物化学科卒業、同年甲南化工(株)に入社。2007年神戸大学大学院自然科学研究科博士後期課程修了。理学博士。日本化学会正会員。