

【1RF-1601】海洋生物の防御機能を模倣したバイオマス循環型船底付着阻害剤の合成的探索研究 (H28-29 6,065 千円)

研究代表者 梅澤 大樹 (北海道大学)

1. 研究実施体制

(1) 各種グルコサミンイソニトリルの合成と生物活性試験 (北海道大学)

2. 研究開発目的

本研究では、船底に付着するフジツボなどの生物に対し、付着阻害活性を有する有機化合物を合成し付着阻害試験を経て、有望化合物(シーズ)を見出すことを目的とする。

研究代表者は、ウミウシなどの海洋生物から得られる有機化合物が強い付着阻害活性と低毒性を併せ持つことに着目した。海洋生物は、このような化合物を付着生物に対する防御物質としていていると考えられている。これら化合物の中にはイソニトリル基が含まれているものがあり、イソニトリル含有化合物はいずれも付着阻害活性を有することを過去の研究から明らかにした。本研究では、カニなどの外殻から得られるバイオマスであるグルコサミンにイソニトリル基を導入する。グルコサミンから短工程かつ安価に付着阻害化合物を合成し、船底を保護、劣化後は海洋へ流出、グルコサミンがカニなどに再取込みされれば、バイオマスとはいえ循環できる理想的な付着阻害剤が創出できる。このように、海洋中の防御機能を模倣し、循環できる化合物を創生できれば、本課題に対する究極的な解決法を提案できる。なお、本助成期間外となるが、有機合成の手法を駆使することで、見出す化合物に更なる機能を付与することで、付着メカニズムを明らかにすることも計画している。

3. 本研究により得られた主な成果

(1) 科学的意義

安価かつ大量に入手可能なバイオマスであるグルコサミン(あるいは市販のグルコサミン誘導体)から、3から6工程で付着阻害活性を有する多様なイソニトリル化合物を合成することができた。この少ない工程数は、「2. 研究開発目的」の項で述べた、研究代表者らによる過去のイソニトリル含有天然有機化合物合成(27工程)と比較すると明白である。効率的な合成法の開発は、実用的に化合物供給にとって不可欠である。

多様な化合物の合成の中で、種々の官能基をグルコサミンに導入し、付着阻害活性を調べた結果、科学的に有用な知見が得られた。これらの知見は、分子レベルでの付着阻害メカニズムに影響を与えることが予想される。有機合成を駆使すれば、メカニズムを調べるための機能を付与した化合物(プローブ)も合成できる。本研究で得られた知見をもとに、プローブを合成し、メカニズムを明らかにすることで、より最適な化合物を今後創生する。また、付着阻害化合物は、塗料に混ぜて使われることになるので、塗料分

子と結合を作るような分子設計も可能となる。

本研究により、現在用いられている付着阻害剤に匹敵する活性を持つ化合物を見出すこともできた。上記のように、科学的に意義ある傾向を見出したものの、更なる最適化の余地を十分に残しているため、今後はより強力なイソニトリル化合物を創出する。

(2) 環境政策への貢献

本研究（付着生物の阻害剤）に関する環境問題として、一昔前の有機スズ化合物や現在も用いられる銅や亜鉛などの重金属が船底などから海洋中へと流出する問題が挙げられる。海洋生物に悪影響を与えることはもとより、食物連鎖の結果として人類の健康に対する悪影響も指摘されている。重金属以外の付着阻害剤も使用されるが、大部分は生物殺傷（バイオサイド）型に属するため海洋環境への効果が懸念されている。また、このような付着阻害剤を利用しないと、船底に生物が付着する結果、付着除去に莫大な費用を要するだけでなく、燃費が悪化し二酸化炭素の排出増加を引き起こす。

一方、フジツボなどの付着生物はウミウシなどの海洋生物も付着の対象としているが、これら海洋生物は前述したイソニトリル化合物をはじめとする有機化合物で付着を防御している。これらの有機化合物は強力かつ低毒性が特徴である。この海洋生物の防御機能を模倣できれば、上述の問題を究極的に解決することが期待できる。本研究では、この生物模倣による付着生物の阻害剤に関する究極的な解決を目指して、イソニトリルを海洋産バイオマスであるグルコサミンに導入した各種化合物を合成した。合成品の付着阻害剤試験により、強力な付着阻害活性と低毒性を両立することが示された。海洋中で使用されるグルコサミンイソニトリルは、最終的には海洋へと流れ出る。これらが生物に取り込まれ再び抽出されて付着阻害剤になれば、バイオマスであっても循環する理想的な付着阻害剤となりうる。このような化合物が実用化できれば、SDGsでも掲げられている「14. 海洋と海洋資源の保全・持続可能な利用」に資するものとなり得る。

<行政が既に活用した成果>

特に記載すべき事項はない。

<行政が活用することが見込まれる成果>

本研究では、バイオマス循環を提案する付着阻害剤開発の可能性を示した。バイオマスであっても循環するような化合物が実用化できれば、SDGsでも掲げられている「14. 海洋と海洋資源の保全・持続可能な利用」に資するものとなり得る。

4. 委員の指摘及び提言概要

海洋生物が生成する付着阻害物質を模倣することで、現行の付着阻害剤よりも安全で、従来のものに匹敵する活性をもつ化合物を合成しており、短期間で所期の成果をあげた

と評価できる。ただし、まだ最適化へ向けて発展段階にあり、潜在的な可能性を示しているという段階である。当然のことながら、成果の実用が重要であり、付着メカニズムの検討と共に、社会実装のためのさらなる展開を期待する。

5. 評点

総合評点：A