マンノシルエリスリトールリピッド類縁体の合成と肌荒れ改善活性

(慶大理工[1]・産総研[2]) ○安井 ちひろ[1]・近藤 孝則[1]・森田 友岳[2]・高橋 大介[1]・戸嶋 一敦[1]

Synthesis of Mannosylerythritol Lipid Derivatives and Their Recovery Effects on the Damaged Cultured Human Skin Cells

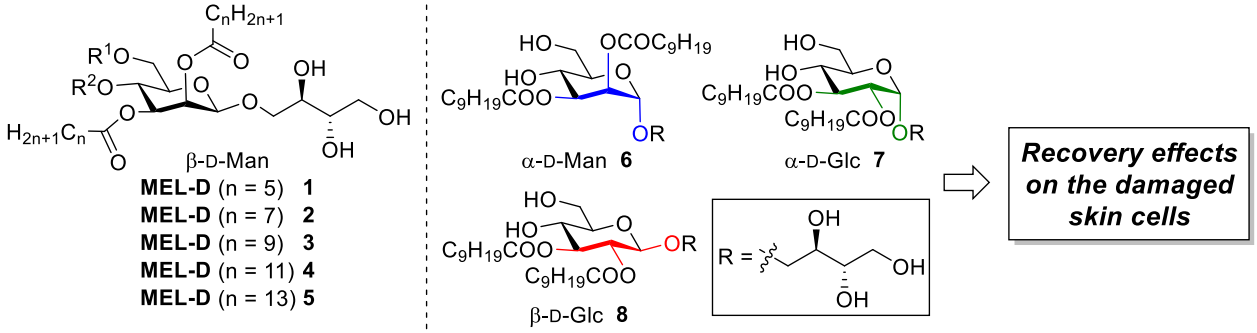
([1]*Faculty of Science and Technology, Keio University*, [2]*National Institute of Advanced Industrial Science and Technology*) ○Chihiro Yasui[1], Takanori Kondo[1], Tomotake Morita[2], Daisuke Takahashi[1], Kazunobu Toshima[1]

Mannosylerythritol lipid (MEL) derivatives with different sugar structures of MEL-D were synthesized, and their recovery effects on the damaged cultured human skin cells were evaluated. As the results, it was found for the first time that the recovery effect was strongly influenced by the configuration of the two fatty chains on the pyranose ring.

Keywords : Mannnosylerythritol Lipid (MEL); Glycolipid; β-Mannoside; Recovery Effect on the Damaged Skin Cells; Structure-Activity Relationship

マンノシルエリスリトールリピッド(MEL)は、抗菌活性などの興味深い生物活性、優れた界面活性及び保湿効果を有することから、化粧品素材として近年注目を集めている[1)]。このような背景の中、当研究室では、マンノース 2 位及び 3 位の脂肪鎖長が異なる（n = 5, 7, 9, 11, 及び 13）計 5 種類の MEL-D **1-5** の肌荒れ改善活性を評価し、n = 9 の脂肪鎖を有する **3** が優れた活性を有することを見出している[2)]。本研究では、**3** の糖構造が異なる MEL 類縁体を精密化学合成し、肌荒れ改善活性を評価した。

まず、**3** の糖構造（β-D-Man)が異なる類縁体、α-D-Man **6**、α-D-Glc **7**、及びβ-D-Glc **8** をデザイン後、ホウ素媒介アグリコン転移(BMAD)反応[3)] を駆使することで効率的に合成した。次に、SDS で肌荒れを誘引したヒト三次元培養表皮に **6-8** を塗布し、MTT アッセイにより細胞生存率を評価した。その結果、活性の発現にはピラノース環上の 2 本の脂肪鎖の立体配置が重要であることを初めて見出した。最後に、物理化学的性質として臨界凝集濃度(CAC)に着目し、肌荒れ改善活性との相関を評価したので、本発表で報告する。



1) Review: Morita, T.; Fukuoka, T.; Imura, T.; Kitamoto, D. *J. Oleo Sci.* **2015**, *2*, 133.
2) Kondo, T.; Yasui, C.; Banno, T.; Asakura, K.; Fukuoka, T.; Ushimaru, K.; Koga, M.; Minamikawa, H.; Saika, A.; Morita, T.; Takahashi, D.; Toshima, K. *ChemBioChem*, in press, doi: org/10.1002/cbic.202100631.
3) Review: 高橋大介, *有機合成化学協会誌*, **2018**, *76*, 470.

© The Chemical Society of Japan