

# タキソール及びその中間体の大量生産法

企業 / 神戸天然物化学（株）

研究者 / 安東政義（新潟大学工学部化学システム工学科教授）



タキソールおよびタキシニン

タキソール(Taxol)は太平洋イチイ(*Taxus brevifolia*)の樹皮から単離された物質であり、優れた抗腫瘍活性を有する。本物質は進行性卵巣癌、乳癌、非小細胞肺癌などに対して有効な治療薬として知られているが、伐採した1本のイチイの樹皮から抽出されるタキソールはごく僅かであり、1回の投与に必要な量の半分しか得られない。また化学的に合成する場合においても60以上の複雑な工程を経る必要があり、収率も低いことから治療に十分な量を供給することは困難であった。現時点では西洋イチイ(*Taxus baccata*)の葉や小枝から10-デアセチルバッカチン を抽出し、それを原料にしてタキソールを合成している。

この医療現場から緊急に求められているタキソールの安定供給を目指したところ、本課題において北海道旭川産の日本イチイ(*Taxus cuspidata* Sieb. et. Zucc.)の針葉部から直接タキソール及びその中間体を効率よく単離することが出来る大量生産システムを構築した。本法はまず日本イチイ針葉部を有機溶剤で抽出し、その濃縮抽出物を酸・アルカリで振り分けることによりイチイ中性部を得た。続いてシリカゲルオープンカラム、中圧LC、洗浄および再結晶により化合物の分離精製を行った。このシステムにより、抽出のためにイチイを伐採することなく、再生可能な針葉部 294.5kg からタキソール 7.8g (LC 純度 98%以上)、その中間体であるタキシニン(taxinine)70 g を得ることに成功した。