

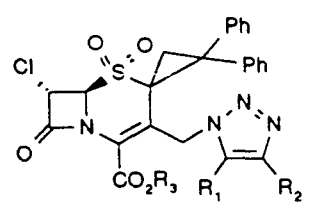
* 분류번호 I-P-32

제 목	2-and 3-Substituted Cephalosporin Sulfones 유도체의 합성 및 Human Leukocyte Elastase 억제작용에 관한 연구
연구자	임 채욱 ¹ , 임 철부 ¹ , Samarendra N. Maiti ³ , Ronald G. Micetich ^{2,3} , Mohsen Daneshtalab ^{2,3} , Kevin Atchison ³
소 속	1. 중앙대학교 약학대학 약화학교실 2. 캐나다 알버타대학교 약학대학 3. Synphar 연구소
내 용	

Human leukocyte elastase(HLE)는 폐와 피부, 혈관등의 Connective tissue의 주요 구성물인 elastin을 분해하는 효소로서, 백혈구의 식균작용에도 관여한다. 그러나 이효소가 과다하게 분비되면 pulmonary emphysema와 adult respiratory distress syndrome, rheumatoid arthritis를 유발한다고 알려지고 있다. 지금까지 HLE억제제로 시판되는 의약품은 없으나, 최근에 Cephalosporin유도체가 이 효소의 억제제로 우수한 효과가 있다는 보고가 있은후, HLE억제제로써 이들의 유도체가 개발되고 있다.

연구자들은 다음일반식에서 2번과 3번위치에 치환기를 도입시킨 수종의 Cephalosporin Sulfone의 유도체들을 합성하고 이들의 HLE억제효과를 Spectrophotometer방식을 이용하여 측정하였다.

합성화합물중 몇가지는 우수한 HLE억제효과를 보여주었고, 2번위치에 diphenylcyclopropyl ring과 같은 부피가 큰 치환체를 도입하면 효소억제력이 증가되었다.



- | | | |
|----|----------------------|----------------------|
| a, | $R_1 = H$ | $R_2 = H$ |
| b, | $R_1 = H$ | $R_2 = CO_2CH_2CH_3$ |
| c, | $R_1 = CO_2CH_2CH_3$ | $R_2 = H$ |
| d, | $R_1 = CO_2CH_3$ | $R_2 = CO_2CH_3$ |
| e, | $R_1 = H$ | $R_2 = CHO$ |
| | $R_3 = CH(Ph)_2$ | |