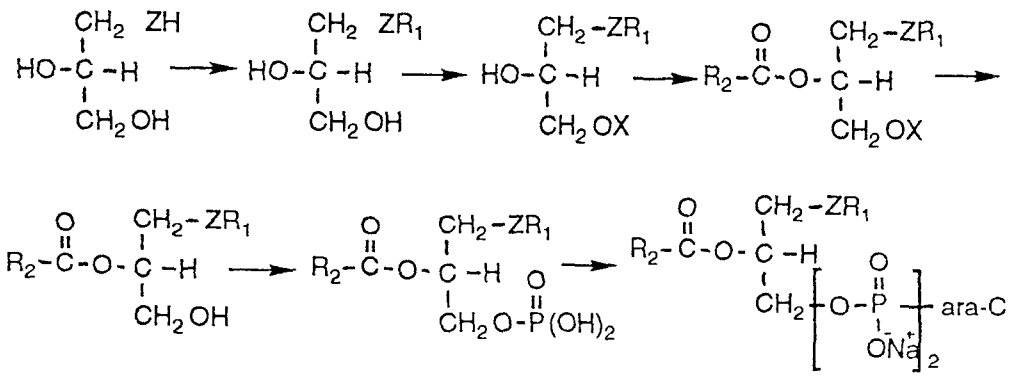


제 목	항암제 Ara - C 유도체의 합성에 관한 연구
연구자	서정진 ¹ , 홍청일 ² , 박우일 ¹ , 손홍규 ¹ , 강신철 ¹ , 임종석 ¹ , A.J. Kirisits ² , Rakesh Vig ²
소 속	¹ 신용제약중앙연구소, ² Roswell Park Cancer Institute
내 용	

Thioglycerol과 Glycerol을 출발물질로 1번 탄소(C) 위치의 산소(O), 또는 황(S)에 octadecyl기로 alkylation한 후, 2번 탄소(C)위치 산소(O)를 palmitoyl기로 acetylation시켜 만든 thioether lipid 및 ether lipid유도체를 인산화시킨 rac-1-S-octadecyl-2-O-palmitoyl-1-S-thioglycerol-3-phosphate (DL-PTBA-P)와 rac-1-O-octadecyl-2-O-palmitoylglycerol-3-phosphate (DL-PBA-P)등을 합성하였다.

이들 thioether lipid 및 ether lipid유도체는 그 자체로도 in vitro와 in vivo에서 anti-neoplastic property를 가지고 있는데, 이들 중간체를 핵산 화합물로서 역시 강한 항암 작용에도 불구하고 독성등 부작용이 문제가 되고있는 Ara-C (일명 Cytarabine)의 인산화물인 ara-CMP morpholidate와 conjugation시켜 최종물질로서 ara-CDP-DL-PCA, ara-CDP-DL-PBA, ara-CDP-DL-PTCA 및 ara-CDP-DL-PTBA등을 합성하였다. 이들 중 ara-CDP-DL-PTBA가 본 과제와 관련하여 항암제로서 최종 개발하고자하는 주요 물질인 Cytosos이다.



단) Z = S 또는 O
X = Si(CH₃)₂C(CH₃)₃