

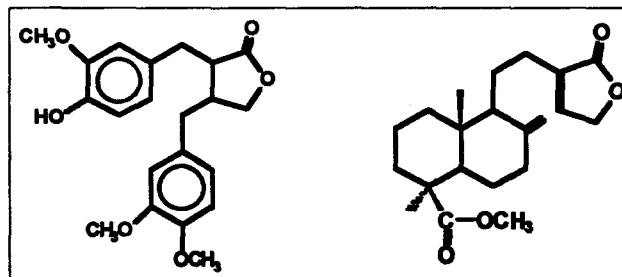
Structure Activity Relationships of PAF Receptor

Binding Antagonists from Natural Products

B.H. Han, H.O. Yang, Y.C. Kim, Y.H. Kang^o, H. J Go and D.-Y. Suh

Natural Products Research Institute, Seoul National University

새로운 혈소판 활성화인자 (PAF) 수용체 결합 저해활성 유효성분인 pinusolide ($IC_{50}=2.5 \times 10^{-7}M$)와 arctigenin($IC_{50}=5.2 \times 10^{-6}M$)을 측백엽(*Biota orientalis*)과 우방자(*Arctium lappa*)로 부터 분리하여 이미 보고한 바 있다. PAF 수용체에 대한 구조활성 상관관계를 규명하고자 또한 용해도가 우수한 강력한 PAF 길항제를 개발하고자 이 길항제들의 유도체들을 다양한 유기화학반응을 이용하여 합성하였고 *in vitro* PAF receptor binding assay로 그 활성의 강도를 비교 검토하였다. 그 결과, lactone ring 부분은 unsaturated lactone이 saturated lactone보다 활성이 강하였고 ring이 개열되면 활성이 현저히 감소하였다. pinusolide 경우 exocyclic double bond 부분은 sp^2 구조의 hydrophobic한 유도체가 활성이 강하였으며, methyl ester 부분은 hydrophobic한 유도체가 활성이 강하였다. Arctigenin의 경우 aromatic unit 가 hydrophobic할수록 활성이 강하였다.



Arctigenin

Pinusolide