

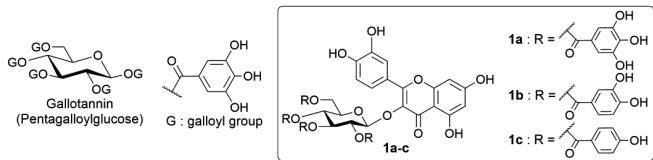
27PA-pm045

抗腫瘍活性・抗 MRSA 活性を志向したケルセチン配糖体の合成

前野 ひとみ¹, ○西岡 弘美², 黒田 照夫³, 森田 大地³, 波多野 力², 坂上 宏⁴, 竹内 靖雄²
(¹岡山大薬, ²岡山大院医歯薬, ³広島大院医歯薬保, ⁴明海大歯)

【目的】ケルセチンは抗酸化作用をもつフラボノールであり¹⁾, これまでに MRSA などに対して抗菌活性を有するケルセチン配糖体が数多く合成されている²⁾。また、当研究室においてガロタンニンやその類縁体が抗腫瘍活性、抗 MRSA 活性を示すことが明らかとなっている。そこで、抗 MRSA 活性・抗腫瘍活性を志向し、ガロタンニンを含むケルセチン配糖体の合成に着手した。

【結果・考察】ケルセチン配糖体 **1a-c** を設計し、合成した。これらの活性評価を依頼し、**1a-c** が弱い抗 MRSA 活性を有することが分かった。また、**1a-c** はガロタンニンである pentagalloylglucose より高い腫瘍細胞毒性を示した。特に、**1c** には既存の抗癌剤であるメルファランと同程度の腫瘍細胞毒性が認められた。



ref.1) M. Kajjout, R. Zemmouri, C. Rolando, *Tetrahedron Letters*, **2011**, 52, 4738-4740.

ref.2) A. M. L. Hossion, N. Otsuka, R. K. Kandahary, T. Tsuchiya, W. Ogawa, A. Iwado, Y. Zamami, K. Sasaki, *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, **2010**, 20, 5349-5352.