

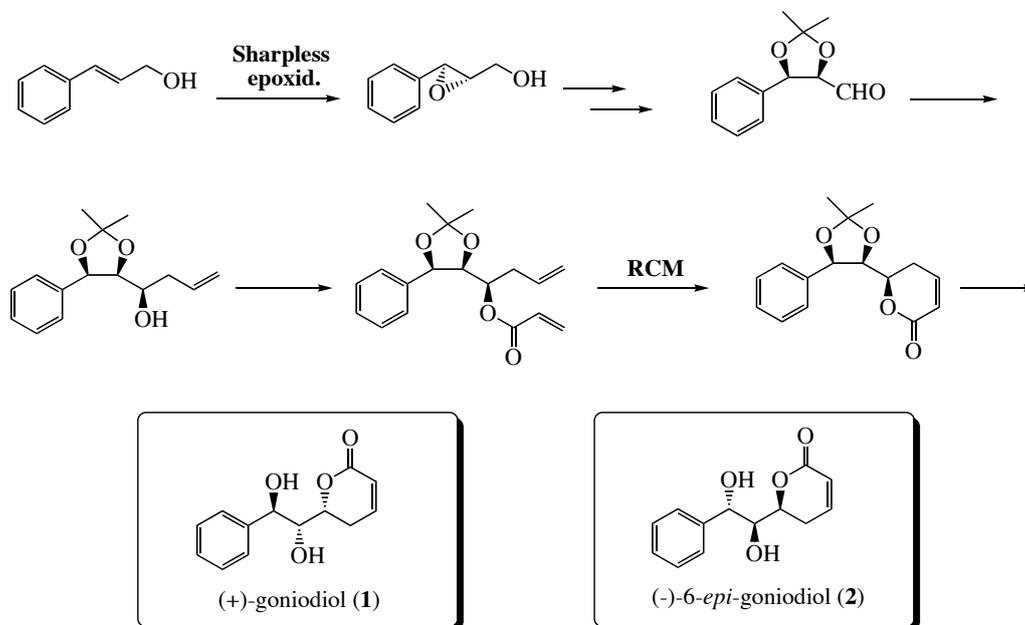
## ゴニオジオールおよび 6-エピゴニオジオールの 両鏡像異性体の合成と生理活性

(分析化学教室) ○菊池直樹、中島勝幸、通 元夫

当研究室では、従来の Grubbs 試薬や近年開発された第 2 世代の Grubbs 試薬を用いるオレフィンメタセシス反応を用いた閉環反応をキーステップとし、種々の天然物合成を検討してきた。

(+)-Goniodiol (**1**)は *Goniothalamus giganteus* から単離され、adriamycin と比べて若干ではあるがヒトの肺ガンに対して選択的に細胞毒性がある。すでにいくつかの合成例が報告されているが、我々はこの活性に興味をもち、(+)-Goniodiol (**1**)のみならずその他の異性体もオレフィンメタセシス反応を用いて合成することを計画し、標記の化合物の合成を達成した。

今回、これまで行ってきた合成ルートを改良し、以下のルートで立体選択性の向上を目指した。また、(+)-goniodiol (**1**) およびその誘導体の活性を明らかにするために、(+)-**1**、(-)-**1**、(-)-**2**、および(+)-**2**の全合成を達成し、さらに HL-60 細胞に対する細胞毒性を測定した。その結果、(+)-**1** および (-)-**1** は共に細胞毒性を示したが、(+)-**2** および (-)-**2** はいずれも全く活性を示さなかった。



謝辞 HL-60 の活性試験では佐藤政男先生始め公衆衛生学教室の皆様にお世話になりました。ここに感謝申し上げます。