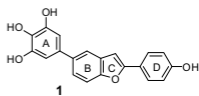


31E09-pm10S

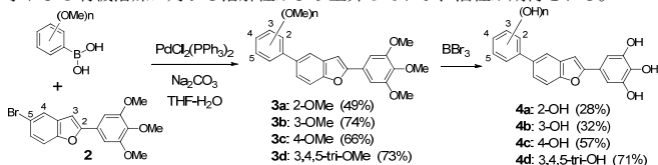
アルツハイマー病治療薬を目的としたアミロイドベータ凝集阻害剤の開発：2,5-ジアルキルベンゾフランの多価フェノール誘導体

鈴木 英治¹, 矢島 聖也¹, 中越 雅道³, 津吹 政可³, 石神 昭人², 氷川 英正¹, 横山 祐作¹ (¹東邦大薬, ²東京都健康長寿医療セ研, ³星薬大)

【目的】我々はアミロイドβ (Aβ) の凝集阻害剤がアルツハイマー病の根本的治療薬になりうると考え研究している。今回は 2-phenylbenzofuran の A 環上の多価フェノール誘導体 **1** に強い Aβ 凝集阻害活性があることを見出した¹⁾。今回は D 環上の多価フェノール誘導体 **4** を合成し、それらの活性の比較を目的とした。



【方法・結果】2-トリメトキシフェニルベンゾフラン **2** の 5 位への Suzuki Coupling で各種メトキシ体 **3** を得た。カップリング反応は明らかに置換基の影響を受け、特に 2-MeO 体は反応性が低かった。次に BBr₃ で **3** を脱メチル化し目的とした多価フェノール体 **4a-4d** を得た。特にヘキサヒドロキシ体 **4d** は **1** 及び **4a-4c** に比べ、水および有機溶媒に対する溶解性がより上昇しており、活性が期待される。



発表ではこれらの Aβ 凝集阻害活性についても述べる予定である。