

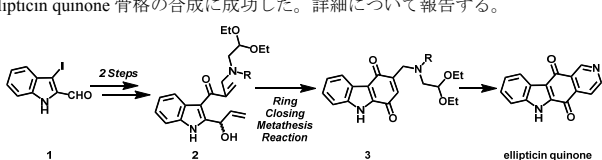
27PB-am004

RCM 反応を用いた Ellipticin 誘導体の合成研究

○西山卓志¹, 町支 臣成¹, 波多江 典之², 日比野 俐¹ (¹福山大薬, ²北医療大薬)

【目的】 Ellipticin 及びその誘導体は、古くから抗腫瘍活性を有する生理活性化化合物として知られており、多くの研究グループにより全合成及び構造活性相関研究が行われてきた。近年、Bernardo らは、ellipticin 誘導体を用いたヒトがん細胞に対する細胞増殖抑制試験を実施し、特に ellipticin quinone が高い細胞増殖抑制作用を示すことを報告している¹⁾。我々は、ellipticin quinone 骨格に着目し、簡便な骨格合成法の開発および ellipticin の全合成を検討したので報告する。

【方法・結果】当研究室では、これまでにビスアリルインドールに対する Ring Closing Methasesis (RCM) 反応を行うことで、環化 - 脱水素化反応が連続して進行する簡便なカルバゾール-1,4-キノン骨格合成法を報告している²⁾。そこで 3-iodoindole (1) から 2 工程でビスアリルインドール 2 を合成し、Grubbs 触媒を用いた RCM 反応を行うことで 3 位にジエチルアミノアセタールを持つカルバゾール-1,4-キノン 3 を合成した。最後に酸触媒存在下、Pomeranz-Fritsch 反応に付すことで 4 工程での ellipticin quinone 骨格の合成に成功した。詳細について報告する。



1) P. H. Bernardo *et al.* *J. Med. Chem.* **2004**, *47*, 4958.

2) T. Nishiyama *et al.* *Tetrahedron Lett.*, **2011**, *52*, 3876.