

25PA-am010S

プロテインキナーゼ C 抑制活性を有する staurosporinone の効率的合成法の開発
○宮野 茉奈¹, 西山 卓志¹, 町支 臣成¹ (¹福山大薬)

【目的】 Indolopyrrolocarbazole 骨格を有する staurosporinone (**1**)は、生理活性としてプロテインキナーゼ阻害活性を有することが報告されている。当研究室では、近年 2-アリルインドール **2** に対し、一酸化炭素気流中、Pd 触媒とスズ試薬存在下、反応を行うと孤立したアルケンに対して cyclocarbonylation 反応が進行し、4-hydroxycarbazole **3** が生成することを見出している。そこで今回演者は、本法を活用した staurosporinone (**1**)の効率的な合成ルートの開発を目的とした合成研究を行ったので報告する。

【方法・結果】 3-Iodoindole-2-carbaldehyde より 3 工程で 2-アリルインドール **2** へ誘導後、**2** に対し本研究の鍵反応である cyclocarbonylation 反応を行うことで 4-hydroxycarbazole **3** を合成することができた。次いで、4 位水酸基をトリフレート化後、鈴木-宮浦カップリング反応でアミノメチル基を導入すると、隣接するエステル部との分子内環化反応が一挙に進行し、ラクタム環が形成された四環性 pyrrolocarbazole **5** を合成できた。さらに 1 位水酸基を手がかりにアニリンを導入後、酸化環化によりもう 1 つのインドール部を形成することで、indolopyrrolocarbazole **6** を合成することができた。以上の経緯について述べる。

