

## Calothrixin A、B とその *N*-アルキル置換誘導体の合成と 抗マラリア活性

松本考司、町支臣成、宝来麻衣、座間味義人\*、  
佐々木健二\*、安部 匠\*、石倉 稔\*、波多江典之\*、  
岩村樹憲\*\*、遠山茂雄、延廣順子、日比野侑

*Bioorg. Med. Chem. Lett*, **22**, 4762-4764 (2012)

### Synthesis and Antimalarial Activity of Calothrixins A and B, and their *N*-Alkyl Derivatives

Kohji Matsumoto, Tominari Choshi, Mai Hourai, Yoshito Zamami\*,  
Kenji Sasaki\*, Takumi Abe\*\*, Minoru Ishikura\*\*, Noriyuki Hatae\*\*,  
Tatsunorri Iwamura\*\*\*, Shigeo Tohyama, Junko Nobuhiro, and Satoshi Hibino

**ABSTRACT:** We synthesized calothrixin B using our developed biomimetic method and derived *N*-alkyl-calothrixin A and B. The *in vitro* antimalarial activity of the calothrixin derivatives, including calothrixins A and B, against the *Plasmodium falciparum* FCR-3 strain was evaluated. All test compounds exhibited antimalarial activity over a concentration range of  $6.4 \times 10^{-6} \sim 10^{-7}$  M.

**抄録** Calothrixin A 及び B を我々が報告した生合成経路により合成し、そのインドール環窒素原子へのアルキル誘導化を行った。合成した calothrixin A 及び B とその誘導体について、*Plasmodium falciparum* FCR-3 に対する抗マラリア活性を評価した。すべての化合物が  $6.4 \times 10^{-6} \sim 10^{-7}$  M の濃度で抗マラリア活性を示した。

\* Faculty of Pharmaceutical Sciences, Okayama University

岡山大学薬学部

\*\* School of Pharmaceutical Sciences, Health Science University of Hokkaido

北海道医療大学薬学部

\*\*\* Faculty of Pharmaceutical Sciences, Matsuyama University

松山大学薬学部