

# 創薬を志向したカルバゾール系化合物の新規合成法開発と 医薬素材の探索研究

西山卓志

*YAKUGAKU ZASSHI*, **141**, 1281-1288 (2021).

## Development of New Synthetic Methods for Carbazole Compounds Aimed at Drug Discovery and Exploratory Research on Pharmaceutical Materials

Takashi Nishiyama

**ABSTRACT** We are developing the synthesis of biologically interesting carbazole compounds, including natural products by tandem cyclic reactions. In this report, we describe the new synthesis of carbazole-1,4-quinones as follows; 1) the synthesis of carbazole-1,4-quinones using a tandem ring closing metathesis (RCM)-dehydrogenation reaction, 2) a novel one-pot synthesis of carbazole-1,4-quinone by consecutive Pd-catalyzed cyclocarbonylation, desilylation, and oxidation reactions. Two new synthetic strategies were applied to the synthesis of carbazole-1,4-quinone alkaloids and ellipticine quinones, and then the antiproliferative activity against HCT-116 and HL-60 cells of the synthesized compounds were evaluated.

**抄録** この論文は、1) タンデム閉環メタセシス (RCM) -脱水素反応を用いたカルバゾール -1,4- キノン合成、2) Pd 触媒存在下でのシクロカルボニル化反応、脱シリル化反応、次いで酸化反応が連続して進行する新規ワンポット合成法によるカルバゾール -1,4- キノン合成の新しい2つの合成法を開発し、カルバゾール -1,4- キノンアルカロイドとエリプチシンキノンの誘導体合成を行った。そして、合成した化合物による HCT-116 および HL-60 細胞に対する細胞増殖抑制活性を評価し、まとめた内容である。

この論文は、2020 年度中国四国支部奨励賞の受賞講演の内容である。