

31-0049 W6-4

新規ウラシル誘導体合成法の開発

○西嶋 剣一¹, 佐ノ木 公人¹, 久下 裕司², 玉木 長良³, 関 興一³, 大倉 一枝¹
(¹北医療大薬,²京大院薬,³北大院医)

【目的】これまで、ウラシル環はウレアおよびチオウレア誘導体を用いるカップリング反応によって合成されてきた。カルボニル化試薬として活性なホスゲン類を用いれば、より簡便に緩和な条件で収率よくウラシル環の形成が可能であると考え、今回、我々は β -アミノメタクリルアミドとトリホスゲンとの反応によるチミンの合成について検討することとした。さらに核医学診断薬剤合成に応用することを目的として、 $[^{11}\text{C}]$ ホスゲンとの反応についても検討した。

【方法・結果】ethyl α -formylpropionate **1** と NH_3 とのシッフ塩基を經由し β -アミノメタクリルアミド誘導体 **2** を合成した。ジアミド体 **2** とトリホスゲンとの環化反応を実施したが反応はまったく進行せず、原料回収に終わった。そこで **2** をアルカリ金属塩とすることにより活性化し、トリホスゲンとの反応を実施したところ、定量的にチミンを与えた。 $[^{11}\text{C}]$ ホスゲンとの反応では、one pot で簡便迅速に $[2-^{11}\text{C}]$ チミンが合成されることが明らかになり、本反応の核医学診断薬剤合成への有用性が示された。

