

29P1-am164

L-トリプトファン芳香環内への位置特異的¹³C標識法の開発
○高取 和彦¹, 李明希¹, 梶原 正宏¹(明治薬大)

【目的】アミノ酸は多くの生体内生理活性物質の前駆体として重要な機能を果たしている。アミノ酸を用いたトレーサー実験を行うことで、生体内における代謝、蓄積、排泄などの動態と代謝異常疾患などの疾病についての深い解明が行なえると考えられる。既に演者らは、Dellaria のオキサジノン **1** を用いた種々の光学活性アミノ酸の位置特異的 ¹³C 標識合成法を報告している。今回は、トリプトファンのインドール環内への位置特異的 ¹³C 標識合成法の開発を行った。

【実験、結果】[2-¹³C]酢酸ナトリウムから誘導した **2** をピロン **3** との逆電子要請型 Diels-Alder 反応とそれに続く脱炭酸、芳香化の工程に付し **4** を合成した。これを Curtius 転位、アリル化によって **5** とし、Heck 反応に付してインドール環を構築し **6a** とした。一方、**4** から誘導した **9** をアンモニア-メタノール中、マイクロ波照射することで閉環させインドール **6b** とした。**6a, 6b** は **7a, 7b** を経て **1** と反応させることで L-トリプトファン **8a, 8b** に誘導できる。

