

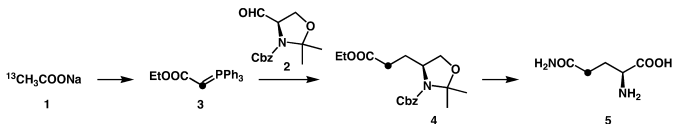
28PE-pm137

L-[4-¹³C]グルタミンの合成

○高取 和彦¹, 長澤 心¹, 梶原 正宏¹(明治薬大)

【目的】 演者らは、*Dellaria* のオキサジノンを用いて様々な光学活性 ¹³C 標識アミノ酸の合成を行ってきた。既に、この方法を用いて光学活性グルタミンの全ての炭素に自由に ¹³C 標識できる合成法を報告しているが¹⁾、今回は 4 位にのみ位置特異的に ¹³C 標識するための簡便な合成法の開発を行った。

【方法・結果】 標識原料は[2-¹³C]酢酸ナトリウム (**1**) とし、これをグルタミンの 4,5 位に導入する。1-3 位の炭素ユニットにはセリンを用いる。官能基変換の容易さからセリンの 1 位をグルタミンの 3 位に当てることとし、出発原料は D-セリンとした。D-セリンから **2** を調製し、これと **1** から調製した **3** を Wittig 反応に付した。生じた ¹³C 標識 α, β - 不飽和エステルを還元して **4** を合成し、アセトニドの加水分解によって生じた 1 級水酸基をカルボキシル基に酸化し、L-[4-¹³C]グルタミン酸誘導体とした。5 位をアミドに変換後、Cbz 基を除去して L-[4-¹³C]グルタミン (**5**) の合成に成功した。HPLC-CD 分析の結果、光学純度は 96%ee 以上であった。



1) K. Takatori, T. Sakamoto, M. Kajiwara, *J. Labelled Compd. Radiopharm.*, **49**, 445-453 (2006).