

# 29amL-126

13C- 標識を目指したラクツロースの合成研究

○中野 博貴<sup>1</sup>, 西川 彩花<sup>1</sup>, 藤井 友貴<sup>1</sup>, 増井 悠<sup>1</sup>, 高橋 孝志<sup>1</sup>, 梶原 康宏<sup>1</sup>, 梶原 正宏<sup>1</sup>(<sup>1</sup>横浜薬大)

【目的】副作用が少なく、各個人に適したオーダーメイド医療（個別化医療）の新たな展開をもたらすため、<sup>13</sup>C 標識ラクツロースを用いた呼吸検査法による過敏性腸症候群（IBS; Irritable Bowel Syndrome）の診断薬開発研究を実施する。ラクツロースは、人工の二糖類（ $\beta$ -D-galactopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-D-furcto-furanose）であり、日本薬局方（第 16 局）にも記載されている医薬品である。ただし、その純度は 50.0 ~ 56.0% である。このため今回、D-[1-<sup>13</sup>C]-ラクツロースの合成ルートの確立を目指すこととした。

【方法】D-[1-<sup>13</sup>C]-フルクトースと D-ガラクトースを原料とし、それぞれの各水酸基を選択的に保護し、グリコシド結合の形成後、脱保護により、D-[1-<sup>13</sup>C]-ラクツロースを得る計画である。本合成ルートの確立のため、まずは安価な無標識の D-フルクトースを用いて種々の検討を行う。

【結果】D-フルクトースの 1,2,3,6 位のヒドロキシ基を効果的に保護するため、2 位のアノマー位をメトキシ基で押さえ、1,3 位でアセトナイドを形成させ、次いで 6 位の選択的な保護を行った。

一方、D-ガラクトースからは糖供与体としてトリクロロアセトイミデートを 1 位に導入し、D-フルクトースの 4 位と  $\beta$ -O-グリコシド結合させ、順次、脱保護を行うことで D-ラクツロースを得た。

今後、本合成ルートの最適化をさらに進め、D-[1-<sup>13</sup>C]-ラクツロースの合成を行う予定である。

