

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¹, 西川 彩花¹, 藤井 友貴¹, 増井 悠¹, 高橋 孝志¹, 梶原 康宏¹, 梶原 正宏¹(¹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、¹³C 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 (β -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-[1-¹³C]-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-[1-¹³C]-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-[1-¹³C]-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 β -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-[1-¹³C]-ラクツロースの合成を行う予定である.

