

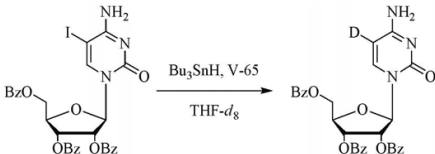
26H-pm15

THF- d_8 を重水素源とした Bu_3SnH によるピリミジン・プリン誘導体の簡便重水素化法

○睦見 友信^{1,2}, 丸橋 和夫², 門口 泰也¹, 佐治木 弘尚¹ (¹岐阜薬大, ²大鵬薬品)

【目的】重水素標識化合物は薬物動態研究あるいは構造解析等の分野で広く利用されており、より簡便で選択的な重水素標識化法の開発が強く望まれている。重水素導入法の一例として、 Bu_3SnD を重水素源としラジカル的に I-D や Br-D 交換反応を行う方法があるが、今回我々は、 Bu_3SnH を用いる、THF- d_8 を重水素源としたヨウ化ピリミジン及びプリン誘導体への位置選択的重水素導入法を開発した。¹⁾

【実験・結果】ヨウ素を置換基とするピリミジン核やプリン核に対して、THF- d_8 中イニシエーターとして 2,2'-アゾビス(2,4-ジメチルバレロニトリル) (V-65) を添加し Bu_3SnH 存在下ラジカル的 I-D 交換反応を検討したところ、効率的 (>90%) に重水素が導入されることを見出した。また、重水素源となる溶媒に関する検討により、アルコールやエーテル系溶媒を使用したときに重水素化率が高く、特に酸素原子に隣接する炭素上の重水素が転写されていることが明らかとなった。



1) Mutsumi, T; Maruhashi, K; Monguchi, Y; Sajiki, H. *Synlett* **2008**, 2811.