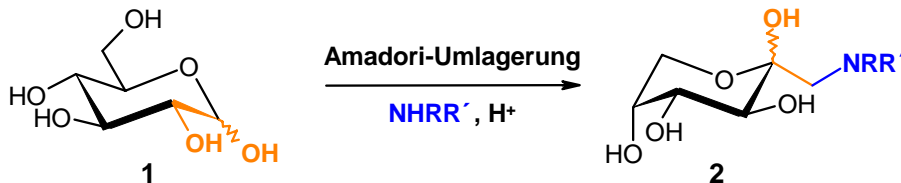


Ein vergessener Schatz: Die Amadori-Umlagerung als Schlüsselreaktion für die Synthese biologisch aktiver Kohlenhydratanaloga

Die Amadori - Umlagerung wurde 1925 von Mario Amadori untersucht, aber schon von Emil Fischer im Zuge seiner Untersuchungen der Osazone von Kohlenhydraten beobachtet. Es handelt sich dabei um die Reaktion von Aldosen **1** mit Aminverbindungen zu den korrespondierenden 1-Aminodesoxyketosen **2**.



In der Literatur gibt es so gut wie keine präparativen Anwendungsbeispiele für diese sehr interessante Reaktion, da die isolierten Ausbeuten des Umlagerungsprodukts im allgemeinen schlecht sind. Wir konnten zeigen, dass diese Umlagerung an ausgewählten Startmaterialien zu quantitativen Ausbeuten führen kann. Einerseits können ausgehend von 5-Azido-D-glucofuranose über die Umlagerung und folgende intramolekulare reduktive Aminierung 1-Aminoderivate **3** des starken β -Glucosidaseinhibitors DMDP dargestellt werden. Iminozucker sind von großer Bedeutung sowohl als Diagnostika als auch Therapeutika bei lysosomalen Speicherkrankheiten, Diabetes, Krebs oder HIV. Andererseits, konnten wir zeigen, dass sich die Amadori Umlagerung als Schlüsselreaktion für eine neue Methode der Proteinmodifizierung eignet (**4**). (Das Anbringen von Kohlenhydratresten an therapeutische Peptide und Proteine führt ja bekanntlich zu verbesserten pharmakokinetischen Eigenschaften)

