

エピガロカテキンガレートをリード化合物とするセラノスティクス薬剤の合成研究

(東京工業大学¹・東京都健康長寿医療センター²・九州大学³) ○劉 紫昀¹・多胡 哲郎²・西岡 成汰³・熊添 基文³・立花 宏文³・豊原 潤²・田中 浩士¹

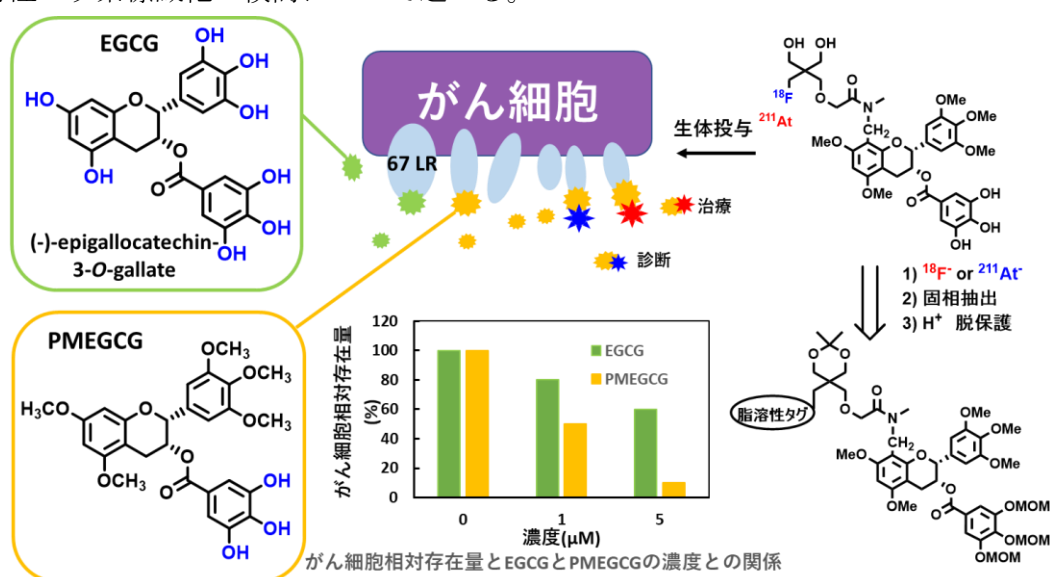
Synthetic study of theragnostic agents based on a structure of epigallocatechin gallate

(Tokyo Institute of Technology¹, Tokyo Metropolitan Geriatric Hospital and Institute of Gerontology², Kyushu University³) ○Ziyun Liu¹, Tetsuro Tago², Seita Nishioka³, Motofumi Kumazoe³, Hirofumi Tatibana³, Jyun Toyohara², Hiroshi Tanaka¹

Epigallocatechin gallate (EGCG) is a biofunctional polyphenol contained in tea leaves. In our laboratory, we have found that partially methylated EGCG shows high tumor action in vivo from the synthesis of methylated combinatorial library using solid-phase synthesis method and the evaluation of biofunctionality of the library compound¹⁾. Therefore, with the aim of developing a theragnostic drug based on methylated EGCG, we decided to synthesize 18F and 211At-labeled methylated EGCG derivatives using the neopentyl universal halogen labeling being researched in our laboratory. In this study, we describe the synthesis of a common labeling precursor and the study of radioactive fluorine labeling using it.

Keywords : Theragnostic Agents, 18F Labeling, Catechin

エピガロカテキンガレート(EGCG)は、茶葉に含まれる生体機能性ポリフェノールである。当研究室では、これまでに固相合成法を用いたメチル化コンビナトリアルライブラリーの合成と、そのライブラリ化合物の生物機能性評価より、部分メチル化 EGCG が *in vivo* で高い腫瘍作用を示すことを見出している¹⁾。そこで、メチル化 EGCG をリードとしたセラノスティクス薬剤の開発を目指して、当研究室で、研究を進めているネオペンチルユニバーサルハロゲン標識を利用した 18F および 211At で標識したメチル化 EGCG 誘導体の合成を行うこととした。本研究では、共通標識前駆体の合成とそれを利用した放射性フッ素標識化の検討について述べる。



1) (a) H. Tanaka et. al, *Angew. Chem., Int. Ed.* **2007**, 46, 5934. (b) Tanaka, H, *Chem. Asian J.*, **2010**, 5, 2231.