

## 糖含有次世代型光増感剤の開発・研究

(米子高専物質<sup>1</sup>・鳥大医生命<sup>2</sup>・台湾中興大学理学部化学<sup>3</sup>) ○遠藤聖也<sup>1</sup>・加藤有紀<sup>1</sup>・坂本啓太<sup>1</sup>・小沼邦重<sup>2</sup>・岡田太<sup>2</sup>・Ping-Shan Lai<sup>3</sup>・梶間由幸<sup>1</sup>

*Development and research of next-generation photosensitizers containing sugar*

(<sup>1</sup>Department of Materials Science, National Institute of Technology, Yonago College, <sup>2</sup>Faculty of Medicine Tottori University, School of Life Science, <sup>3</sup>Department of Chemistry, National Chung Hsing University) ○Seiya Endo,<sup>1</sup> Yuki Kato,<sup>1</sup> Keita Sakamoto,<sup>1</sup> Kunishige Onuma,<sup>2</sup> Futoshi Okada,<sup>2</sup> Ping-Shan Lai<sup>3</sup>, Yoshiyuki Uruma<sup>1</sup>

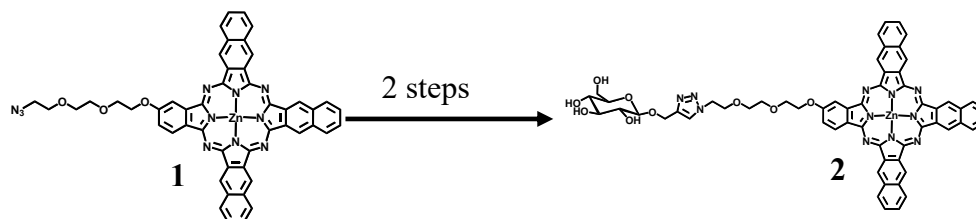
Photodynamic therapy (PDT) is a cancer treatment method that combines light and photosensitizers. However, PDT has disadvantages such as low penetration of the light used for treatment and low selectivity for tumor cells.

In this study, we aimed to improve the therapeutic efficiency by using naphthalocyanine, which has an absorption wavelength of 700-900 nm. In the molecular design of the photosensitizer, we took advantage of the knowledge gained from the 2016 synthesis of a photosensitizer containing glucose in a solaren molecule, which showed specific phototoxicity [1]. The naphthalocyanine azide derivative **1**, a precursor of the target **2**, was obtained in 23 % yield by refluxing at 150 °C for 16 h in the presence of DBU. Desired compound **2** was synthesized in two steps using the Huisgen reaction as a key reaction.

**Keywords :** Photodynamic therapy; Photosensitizer; Naphthalocyanine; Cancer treatment

光線力学療法(PDT)とは、光と光増感剤を組み合わせた癌治療法である。しかし、PDT には治療に使用する光が細胞に対し透過性が低いこと、腫瘍細胞への選択性が低いなどの欠点があり、現在ではより長波長で活性化することに加えて、腫瘍特異性を有する光増感剤の開発が行われている。

本研究では吸収波長が 700-900 nm にあるナフタロシアニンを用いることで治療効率の向上を目指した。また、光増感剤の分子設計では、2016 年ソラレン分子にグルコースを包含した光増感剤を合成し特異な光毒性を見出すことに成功しており、得られた知見を活かした分子設計を行った<sup>1)</sup>。DBU 存在下 150℃で 16 時間加熱還流し目的物 **2** の前駆体であるナフタロシアニンアジド誘導体 **1** を収率 23 %で得た。目的物 **2** は Huisgen 反応を鍵反応として 2 段階で合成を目指した。



Scheme Glucose-containing naphthalocyanine

[1]Uruma, Y.; Nonomura, T.; Yoong P.M.Y.; Edatani, M.; Yamamoto, R.; Onuma, K.; Okada, F. *Bioorg. Med. Chem.* **2017**, 25, 2372-2377.