

二世代型光増感剤の合成と物性評価

(米子高専物質工学科¹・鳥大医生命²・国立台湾中興大学理学部化学³) ○原 望実¹・坂本 啓太¹・加藤 有紀¹・小沼 邦重²・岡田 太²・Ping-Shan Lai³・梶間 由幸¹

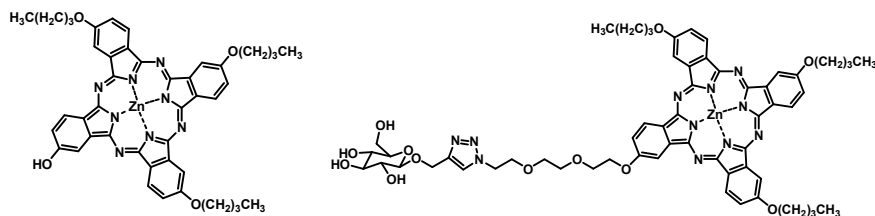
Synthesis and physical evaluation of second-generation photosensitizers

(¹National Institute of Technology, Yonago College, Department of Materials Science, ²Faculty of Medicine Tottori University, School of Life Science, ³National Chung Hsing University, Faculty of Science Chemistry) ○Nozomi Hara,¹ Keita Sakamoto,¹ Yuki Kato,¹ Kunishige Onuma,² Futoshi Okada,² Ping-Shan Lai,³ Yoshiyuki Uruma¹

Photodynamic therapy (PDT) with light and a photosensitizer is an excellent cancer treatment. When a photosensitizer is irradiated with light of a specific wavelength, the generated singlet oxygen causes necrosis of cancer cells. However, PDT has the problem of low water solubility and cell selectivity of photosensitizers. Therefore, in 2016, it was revealed that the introduction of glucose into the photosensitizer has an improving effect.¹⁾ However, PDT has There is an additional problem that it applies only to superficial cancers. In this study, zinc Pc with a butoxy group was synthesized as a photosensitizer to prevent Pc from forming layers, facilitate synthesis, and shift the absorption wavelength to a longer wavelength. In fact, in the presence of butanol, DBU was used as a base and reacted at elevated temperatures to synthesize the BuO-ZnPc OH compound in 16.5% yield. We also aimed to synthesize glucose-containing BuO-ZnPc using the Huisgen reaction as a key reaction.

Keywords : Photodynamic therapy; Photosensitizer; Cancer treatment

優れた癌治療法として光と光増感剤を用いた光線力学療法 (PDT) がある。光増感剤に特定の波長の光を照射し、発生した一重項酸素によって癌細胞を壊死させる。しかし PDT には光増感剤の水溶性・細胞選択性が乏しいという問題点がある。そこで我々は 2016 年に光増感剤にグルコースを導入することで改善効果があったことを明らかにした。¹⁾ しかしながら、PDT には表在性の癌にのみ適用されるという更なる問題がある。本研究ではさらに細胞深部の癌細胞に適応させるため生体の窓とされる近赤外域に吸収帯を有するフタロシアニン (Pc) を光増感剤として用いた。そして Pc が層状になるのを防ぎ合成が容易になること、また吸収波長をさらに長波長にシフトさせるためブトキシ基のついた亜鉛 Pc を光増感剤として合成した。実際に、ブタノール存在下、DBU を塩基として用い、高温下で反応させ収率 16.5% で BuO-ZnPc OH 体を合成した。また、Huisgen 反応を鍵反応としてグルコース含有 BuO-ZnPc の合成を目指した。



Scheme1 BuO-ZnPc OH compound

glucose-containing BuO-ZnPc

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