

光免疫療法薬剤に関する合成研究 (Ⅱ): 二機能性シリコンフタロシアニンの合成

(埼玉大院理工¹・埼玉先端ラボ²・埼玉戦略研究³) ○斎藤栞奈¹・松下隆彦^{1,2,3}・小山哲夫¹・幡野健^{1,2,3}・松岡浩司^{1,2,3}

Synthetic Studies of Photoimmunotherapeutic Agents (II): Synthesis of Bifunctional Silicon Phthalocyanines(¹Grad. Sci.&Engin. Saitama University, ²Adv. Inst. Innov. Tech. Saitama University, ³Strategic Res. Ctr. Saitama University) ○Kanna Saito¹, Takahiko Matsushita^{1,2,3}, Tetsuo Koyama¹, Ken Hatano^{1,2,3}, Koji Matsuoka^{1,2,3}

Photoimmunotherapy is a cancer treatment for head and neck cancer. In this treatment, a drug called IR700, which has a silicon phthalocyanine, is combined with IgG antibodies and administered to cancer patients. The drug then binds to EGFR on the surface of cancer cells, and irradiation of 690 nm light causes a photochemical reaction. The active oxygen released at this time promotes necrosis and disappearance of the cancer cells. The advantage of this treatment is that it suppresses side reactions because of causing a photochemical reaction at the side of cancer cells, and research is being conducted as a new cancer treatment. However, the difficulty of preparation of the drug and its low water solubility are problems. In this study, we aim to solve these problems by using selective reactions and synthesizing protein-containing silicon phthalocyanine derivatives.

A biotin-containing compound Pc4 was prepared in 25% yield by the condensation reaction of silicon phthalocyanine Pc2 and biotin. The binding of this compound Pc4 to streptavidin was also confirmed.

Keywords : Silicon phthalocyanine; Photoimmunotherapy; Streptavidin; Multivalent

光免疫療法は頭頸部癌を対象としたがん治療である。この光免疫療法はシリコンフタロシアニン骨格をもつ IR700 という物質と IgG 抗体が結合している薬品をがん患者に投与する。その後薬品が、がん細胞表面に存在する EGFR に結合し、690 nm の光を照射することで、がん細胞付近で光化学反応を起こさせる。このとき発生する活性酸素によって、癌細胞の壊死、消滅を促すものである。がん細胞付近で反応させることによって、副反応が抑えられることが利点として挙げられ、新たながん治療として研究が進められている¹⁾。しかし、薬品自体の合成が難しい、水溶性が低いことが問題点となっている。本研究では、選択的な反応を用いること、タンパク質を含むシリコンフタロシアニン誘導体の合成によって、問題点の解決を目指している。

シリコンフタロシアニン **Pc2** とビオチンの縮合反応により、収率 25% でビオチンを含む化合物 **Pc4** を合成することに成功した。この化合物 **Pc4** とスト렙トアビジンの結合も確認された。本発表では、その詳細について報告する。



1) Dong Li, *et al.*, *ACS Applied Materials & Interfaces.*, 2019, 11(40), 36435-36443.