## フッ化フェニルエチニル基を導入したチオウリジン誘導体の 光化学特性

(青学大院理) ○佐藤 輪・柏原 航・西原 達哉・田邉 一仁・鈴木 正 Photochemical properties of thiouridine derivative having a fluorophenylethynyl group (*Graduate School of Science and Engineering, Aoyama Gakuin University*) ○Rin Sato, Wataru Kashihara, Tatsuya Nishihara, Kazuhito Tanabe, Tadashi Suzuki

Thionucleobases, in which the oxygen atom of a nucleobase is replaced by a sulfur atom, have high biocompatibility and are known to have the ability to generate singlet oxygen. Therefore, thionucleobases are expected to be used as photosensitizers in photodynamic therapy (PDT). Important properties of photosensitizer were to absorb long-wavelength light, and to have the higher quantum yield of intersystem crossing for the larger formation quantum yield of singlet oxygen. In this study, the thiouridine derivate having a fluorophenylethynyl unit in 5-position (FPETUrd, Fig. 1) was investigated. It was found that FPETUrd has an absorption band at longer wavelengths than conventional thionucleobases. Fluorescence of FPETUrd was observed. The quantum yield of singlet molecular oxygen of FPETUrd was the largest among thionucleobases reported previously. The UVA-induced toxicity of FPETUrd was also examined. The potential of FPETUrd as a photosensitizer for PDT will be discussed. *Keywords: Nucleobase, Photodynamic therapy, Singlet molecular oxygen, Cell toxicity* 

光線力学療法(PDT)は副作用の負荷が少ないがん治療法として注目されている。ウラシルやグアニンといった核酸塩基の酸素原子を硫黄原子に置換したチオ核酸塩基は生体親和性が高く、一重項酸素生成能を持つことが知られているため、光線力学療法の光増感剤への応用が期待されている。光増感剤は吸収帯が長波長側にあること、高い項間交差量子収率、高い一重項酸素生成量子収率を持つことが求められる。そこで、5位にフッ化フェニルエチニル基を導入したチオウリジン(FPETUrd, Fig. 1)の光化学特性を調べた。

FPETUrd は従来のチオ核酸塩基よりも長波長に吸収帯を持つことが分かった。また、チオウリジンにはまれな蛍光を発することが明らかとなり、フッ化フェニルエチニル基の導入により、チオウリジンの電子状態や緩和過程が変化したことがわかった。FPETUrd は報告されているチオ核酸塩基の中で最も高い一重項酸素生成量子収率を持つことが明らかとなった。発表ではFPETUrd の光照射下における細胞毒性の結果もあわせて報告する。FPETUrd の電子励起状態を詳細に議論し、光線力学療法の光増感剤としてのポテンシャルを評価する。

S NH N COO OAC

Fig. 1. The molecular structure of FPETUrd.