

## グルコースユニットを有する新規ケージドニトロキシドの合成とその反応

(広島大理<sup>1)</sup> ○中野 晃大<sup>1</sup>・安倍 学<sup>1</sup>

Synthesis and reaction of a new caged nitroxides with glucose units (<sup>1</sup>School of Science, Hiroshima University)

○Kodai Nakano<sup>1</sup>, Manabu Abe<sup>1</sup>

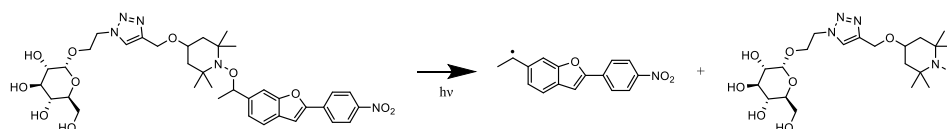
*Caged compounds are known as substances that are biologically inactive by protecting bioactive compounds with a photolabile protecting group. The bioactivity can be regenerated spatiotemporally by light irradiation. Since light irradiation can be controlled spatiotemporally, the regeneration of bioactivity is expected to be applied in the medical field. However, ultraviolet light has the disadvantage of low cell permeability in addition to high cytotoxicity. Therefore, our laboratory designed a compound with a nitrobenzofuran skeleton based on a trans-stilbene unit with two-photon absorption activity, to generate nitroxyl radicals with anticancer properties upon photoirradiation. However, its low water solubility made it difficult to put it into practical use.*

*In this study, we designed and synthesized a caged nitroxide with a glucose unit to improve the selectivity to cancer cells and to ensure water solubility. The photolysis of newly synthesized caged nitroxide was conducted to see if, nitroxyl radicals is formed under photoirradiation.*

**Keywords :** Caged compounds, Radicals, Photochemistry

生物活性物質を光解離性保護基で保護することで生物不活性とし、光照射により時空間的に制御してその生物活性を発現できる物質としてケージド化合物が知られている。光は時空間的に制御が可能であることから、医療分野での応用が期待されている。しかし、紫外光では細胞毒性が大きいことに加えて細胞透過性が低いという欠点がある。そこで、当研究室では二光子吸収性を有するトランススチルベン骨格を応用したニトロベンゾフラン骨格を有する化合物をデザインし、その光物性を測定したところ、光照射によって抗がん性を有するニトロキシラジカルが発生に成功した<sup>1)</sup>。しかし、水溶性が低く、実用化には困難であった。

そこで本研究では、がん細胞への選択性の向上と水溶性の確保のためグルコースユニットを有するケージドニトロキシドをデザインし、その合成、ならびに、光照射によるニトロキシラジカルが発生研究を行った。



1) *Beilstein J. Org. Chem.* **2019**, *15*, 863–873