

がんで選択的に生じるジアゾ化合物を用いた生理活性物質の合成

(東工大物質理工¹・理研 開拓研究本部 田中生体研²・カザン大 A.ブトレロフ研 生体研³) ○奥村 昂也¹・Ambara R. Pradipta¹・田中 克典^{1,2,3}

Synthesis of a bioactive compound by using diazo derivatives (¹*School of Materials and Chemical Technology, Tokyo Institute of Technology*, ²*Biofunctional Synthetic Chemistry Laboratory, Cluster for Pioneering Research, RIKEN*, ³*Biofunctional Chemistry Laboratory, Alexander Butlerov Institute of Chemistry, Kazan Federal University*) ○Koya Okumura,¹ Ambara R. Pradipta,¹ Katsunori Tanaka^{1,2,3}

Previously, we have reported that acrolein is overexpressed in cancer cells but negligible in healthy cells. Furthermore, we also found that aryl azide compounds could react with the acrolein of cancer cells to give diazo derivatives (Fig. 1).¹⁾ Herein, we discovered that molecular transformation was possible when a metal catalyst was present in the systems. Therefore, using this in vivo synthetic method, we envisaged synthesizing antitumor compounds in cancer cells selectively in vivo. The details will be discussed in the symposium.

Keywords : *Therapeutic in vivo synthetic chemistry; Acrolein; Cancer; Metal catalyst; Aryl azide*

我々の研究室ではこれまでに、がん細胞でアクロレインが大量に発生していることを発見した。それに加えて、アクロレインとアリールアジドが反応することにより、ジアゾ化合物が生成することも明らかになっている(図1)。¹⁾ 本研究ではこの生成したジアゾ化合物と金属触媒を反応させることによって、分子変換が可能であることを見出した。さらに今回の生体内合成化学を利用することで、抗がん活性を持つ化合物をがん細胞で選択的に合成することを検討したので、これらの経緯について報告する。

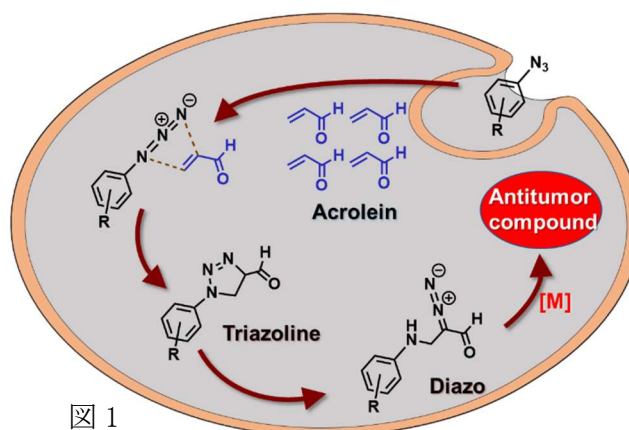


図 1

1) Cascade Reaction in Human Live Tissue Allows Clinically Applicable Diagnosis of Breast Cancer Morphology. A. R. Pradipta, K. Tanaka, et al., *Adv. Sci.* **2019**, 6, 1801479.