

9-アミノアントラセン誘導体の蛍光特性を利用したがん細胞イメージングへの応用

(北里大理¹・北里大院医療²) ○上田 寛治¹・山浦 貴久¹・板倉 誠²・松沢 英世¹・鍵谷 豪²・川上 文貴²・内山 洋介¹

Application for cancer cell imaging by utilizing fluorescence of 9-aminoanthracene derivatives (¹*School of Science, Kitasato University*, ²*Graduate School of Medical Sciences, Kitasato University*) ○Kanji Ueda,¹ Yamaura Takahisa,¹ Itakura Makoto,² Hideyo Matsuzawa,¹ Kagiya Go,² Fumitaka Kawakami,² Yosuke Uchiyama¹

We aim to apply 9-aminoanthracene (**9AA**) as a new fluorescence reagent by taking advantage of a green fluorescence emission of **9AA**. In order to avoid the dimerization of **9AA** under the UV light and to obtain water soluble **9AA**, we synthesized a **9AA** derivative (**MeO9AA**) bearing a trimethoxyphenyl group {2,4,6-(MeO)₃C₆H₂} by the reduction of 9-nitro-10-(2,4,6-trimethoxyphenyl)anthracene with SnCl₂ in MeOH at 60 °C, according to the synthetic method of mesityl derivative (**Mes9AA**) (Fig.1, Scheme 1).¹ 9-Nitro-10-(2,4,6-trimethoxyphenyl)anthracene was prepared by the nitration of 9-(2,4,6-trimethoxyphenyl)anthracene in AcOH-MeOH at below 10 °C (Scheme 1). We are investigating dealkylation of **MeO9AA** to yield a water soluble **9AA** derivative.

Keywords : Cell imaging; 9-Aminoanthracene; Green fluorescence material; Dimerization; Water solubility

9-アミノアントラセン (**9AA**) の蛍光特性を活用した新規がん細胞イメージング剤の開発を目指している。今回、光照射下での **9AA** の二量化を防ぎ、水溶性を示す **9AA** 誘導体の合成を目的とし検討した。まず、9-アミノ-10-メシチルアントラセン (**Mes9AA**) の合成法¹と同様の方法で9-アミノ-10-(2,4,6-トリメトキシフェニル)アントラセン (**MeO9AA**) を合成した (Fig.1, Scheme 1)。すなわち、9-(2,4,6-トリメトキシフェニル)アントラセンを酢酸-メタノール中、10 °C以下でニトロ化し、SnCl₂の還元反応をメタノール中、60 °Cで行うことで**MeO9AA**を得た (Scheme 1)。現在、**MeO9AA** の脱メチル化により、水溶性 **9AA** 誘導体の合成を検討している。

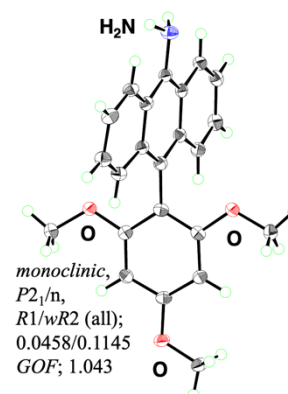
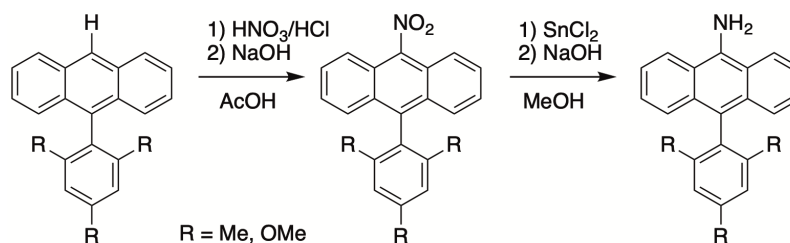


Fig.1: Crystal structure of MeO9AA



Scheme 1: Synthesis of **9AA** derivatives, **Mes9AA** and **MeO9AA**.

1) "Preparation of 9-aminoanthracene derivatives as reagents for detection of oxygen". Y. Uchiyama, M. Itakura, R. Watanabe, T. Kurotaki, *JP 6942337, B2*, 2021.9.29.