

# 28L-am10

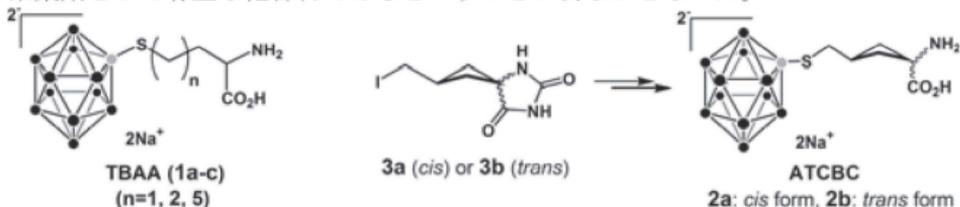
負イオン性ホウ素クラスター含有  $\alpha, \alpha$ -シクロアルキルアミノ酸の BNCT 用ホウ素薬剤としての評価

○服部 能英<sup>1</sup>, 日下 慎太郎<sup>2</sup>, 椋本 麻里<sup>1</sup>, 大田 洋一郎<sup>3</sup>, 竹中 宏志<sup>3</sup>, 上原 幸樹<sup>3</sup>, 浅野 智之<sup>3</sup>, 鈴木 実<sup>4</sup>, 増永 慎一郎<sup>4</sup>, 小野 公二<sup>4</sup>, 切畑 光統<sup>1</sup>  
(<sup>1</sup>大阪府立大21機構, <sup>2</sup>大阪府立大院生命環境, <sup>3</sup>ステラファーマ, <sup>4</sup>京大原子炉実験所)

【目的】近年、<sup>10</sup>B 原子と中性子との核反応を利用するホウ素-中性子捕捉療法 (BNCT) が、悪性の脳腫瘍などに対する新たな可能性を秘めた治療法として注目を集めている。これまでに我々は、BNCT 用のホウ素薬剤の開発を継続的に行ってきた。その中で、アミノ酸の側鎖部位にホウ素クラスターを導入した TBAA (1) を合成し、これが BNCT 用のホウ素薬剤として高い効果を示すことを明らかにしている。<sup>1)</sup> 本研究では、グリオーマなどの悪性脳腫瘍を標的とした ATCBC (2) の合成および BNCT 用ホウ素薬剤としての評価について報告する。

【方法】ATCBC は、これまでに確立したホウ素クラスターアミノ酸の合成法を利用し、対応するヒダントイン誘導体 (3) から合成した。そして、ヒトグリオーマ細胞 (U87Δ) などを用いて、腫瘍細胞への集積性や細胞内分布、中性子照射による殺細胞効果などの評価を行った。

【結果】上記試験の結果、ATCBC は複数の脳腫瘍の細胞に対し、BNCT の臨床薬である L-BPA よりも高い腫瘍細胞集積性と高い殺細胞効果を示し、BNCT 用ホウ素薬剤として有望な化合物であるということが明らかとなった。



1) Hattori, Y. et al., *J. Med. Chem.*, **2012**, 55, 6980-6984.