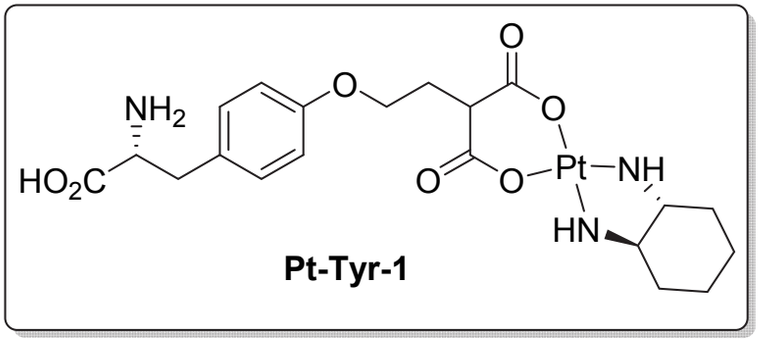
23PO-am094S

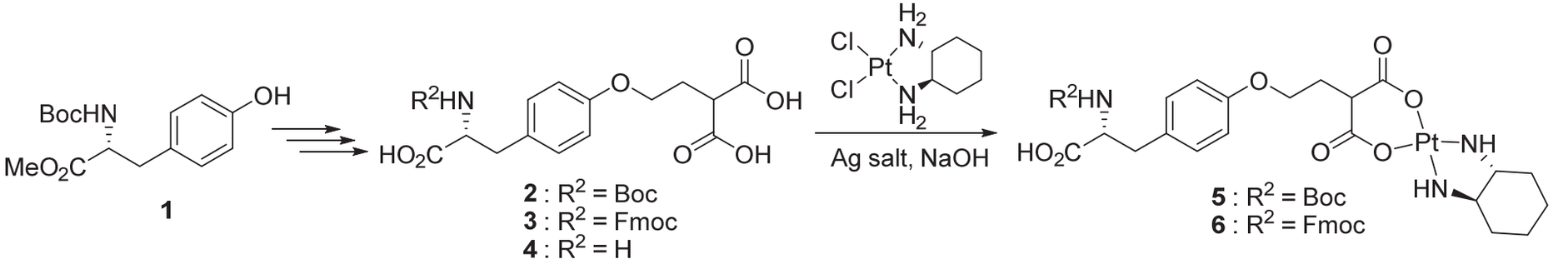
がんへの集積性向上を指向とした新規白金錯体の開発研究

○石神 有梨[1], 有光 健治[1], 屋木 祐亮[1], 河嶋 秀和[1], 安井 裕之[1], 木村 寛之[1] ([1]京都薬大)

【目的】シスプラチンなどの白金製剤は、現在もがん治療に幅広く使用されている。しかしながら、腎毒性などの重篤な副作用や耐性を誘発しやすいことが臨床の現場で問題となっている。今回、がん集積性を高めることで抗腫瘍効果の向上や副作用の低減が期待できる新規の白金製剤の開発を目的として、がんのアミノ酸代謝の亢進を利用した ^{18}F 標識フルオロエチルチロシン ([^{18}F] FET) などの ^{18}F 標識アミノ酸放射性トレーサーの構造を基に、チロシンを母体とした白金錯体の設計と合成を検討した。



Pt-Tyr-1

【方法・結果】[^{18}F]FET のフルオロエチル部位を Pt とのキレート部位に置き換えられると考え、チロシンのフェノール性ヒドロキシ基にリンカーを介してマロン酸を導入し、Pt とキレートした化合物 **Pt-Tyr-1** を設計した。

市販のチロシン誘導体 **1** から誘導体化できるマロン酸誘導体 **2-4** を用いて、Pt とのキレート形成を検討したところ、**2** および **3** からのみ白金錯体 **5** および **6** を得る事ができた。本発表では、脱保護による **Pt-Tyr-1** の合成検討や **5** および **6** を用いたインビトロでの殺細胞活性評価の結果を合わせて報告する。