

СИНТЕЗ И БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ ФЛУОРЕСЦЕНТНЫХ ПОЛИЭДРИЧЕСКИХ ГИДРИДОВ БОРА ДЛЯ БОР-НЕЙТРОНОЗАХВАТНОЙ ТЕРАПИИ РАКА

Мезенцев И.А., Друзина А.А., Сиваев И.Б., Брегадзе В.И.

Институт элементорганических соединений РАН

119334, г. Москва, ул. Вавилова, д. 28, стр. 1

Бор-нейтронозахватная терапия (БНЗТ) является современным подходом к лечению злокачественных новообразований, который базируется на поглощении клетками опухоли изотопа ^{10}B с дальнейшим облучением тепловыми нейтронами для локальной деструкции раковых опухолей. Основным ограничением метода остаётся низкая селективность доставки борсодержащих соединений к мишени. Визуализация распределения терапевтических агентов *in vitro* и *in vivo* возможна с использованием флуорофоров, таких как VODIPY, которые обладают высоким клеточным проникновением. В связи с этим разработка бифункциональных структур, которые сочетают борный кластер, отвечающий за терапевтический эффект, и флуоресцентную метку для детекции накопления, представляет собой перспективное направление в создании новых препаратов для БНЗТ.

В представленной работе синтезированы конъюгаты полиэдрических гидридов бора с VODIPY, различающиеся строением соединяющего звена. Получение целевых соединений осуществлялось по реакции нуклеофильного раскрытия циклических оксониевых производных борных кластеров гидроксильной группой VODIPY, а также по Cu(I)-катализируемой реакции 1,3-диполярного циклоприсоединения алкинов к азидам (см. схему). Исследованы биологические свойства полученных конъюгатов.

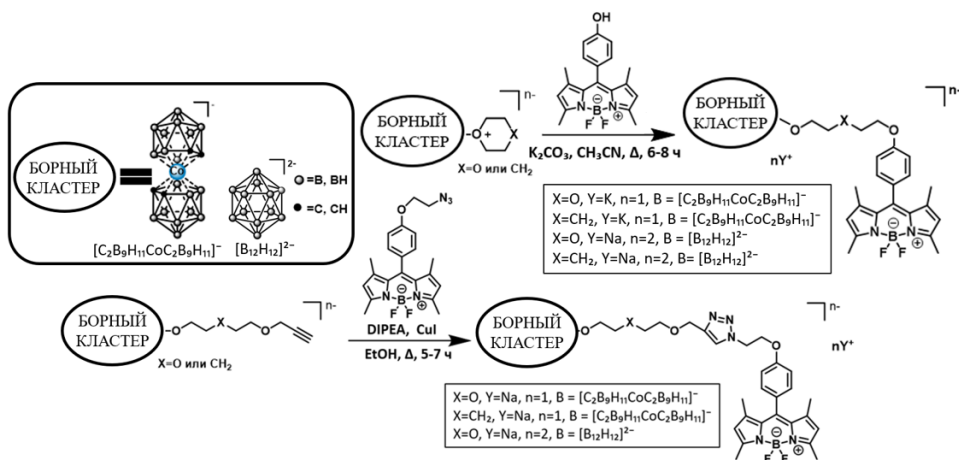


Схема синтеза конъюгатов полиэдрических гидридов бора с VODIPY

Работа выполнена при поддержке РФФ (Проект № 24-73-10090).