

アニオンカーゴの細胞膜透過を志向したカチオン性リンカーを有するホウ素クラスターキャリアの開発

(信大繊維¹・オーフス大学²・信大 RISM³) 中島陸登¹・山本哲士¹・北沢太郎²・木村睦^{1,3}・北沢裕³

Development of Boron Cluster Carriers with Cationic Linkers for the Transport of Anionic Cargo Across Cell Membranes

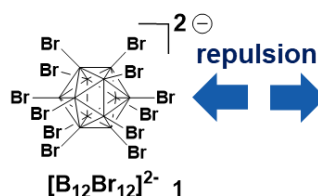
(¹Faculty of Textile Science and Technology, Shinshu University, ²Aarhus University, ³Research Initiative for Supra Materials) Rikuto Nakajima,¹ Satoshi Yamamoto,¹ Taro Kitazawa,² Mutumi Kimura,^{1,3} Yu Kitazawa³

In recent years, halogenated dodecaborates $B_{12}X_{12}^{2-}$ ($X = Cl, Br, I$) (**1**) have been reported as novel cell membrane transport carriers based on chaotropicity. However, unlike conventional amphiphilic molecular carriers, anionic boron cluster carriers face electrostatic repulsion with anionic cargo. This limitation restricts their use to neutral or cationic cargo. In this study, we report a new molecule ($[B_{12}Br_{11}O(CH_2)_4NH_3]^-$) (**2**) in which a linker with cationic sites is introduced into the boron cluster, aiming to enhance interactions with anionic cargo.

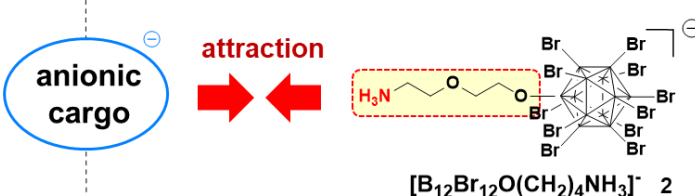
Keywords : Boron cluster, Dodecaborate, Carborane, Membrane transport, Chaotropic

細胞膜透過技術は、ドラッグデリバリーシステムの重要な技術として注目されている。近年、ハロゲン化ドデカボレートが持つカオトロピック性を利用した細胞膜透過への応用が報告された。¹⁾この分子は、高い水溶性、クラスター分子内での電荷の非局在化、水和水構造を乱すカオトロピック性によって、従来の両親媒性分子キャリアで課題となっていた凝集や非特異的な膜溶解を抑制できる特徴を持つ。^{1,2)}しかし、ハロゲン化ドデカボレートはジアニオン分子であるため、アニオン性カーゴに対して静電反発が問題となり、現状ではカチオン性カーゴや中性カーゴの輸送に限られている。¹⁾本研究では、臭素化ドデカボレート($[B_{12}Br_{12}]^{2-}$) (**1**)にリンカーを導入し、その末端にカチオン部位を付与した分子($[B_{12}Br_{11}O(CH_2)_4NH_3]^-$) (**2**)を合成した。また、合成した分子の細胞膜透過試験も行ったので、その結果を本発表で報告する。

Previous work



This work (Hypothesis)



1) Barba-Bon, A. *et al. Nature* **2022**, 603, 637–642.

2) Fischer, P. M. *Cellular Medicinal Research Reviews* **2007**, 27 (6), 755–795.