

マイトマイシンC-アルブミン結合体の合成とその性質

金尾義治, 田中哲郎, 井口定男

Chemical & Pharmaceutical Bulletin, 38 (9), 2614-2616 (1990).

Preparation and Properties of a Mitomycin C-Albumin Conjugate

Yoshiharu KANEO, Tetsuro TANAKA and Sadao IGUCHI

ABSTRACT Mitomycin C, an anti-neoplastic agent, was covalently attached to bovine serum albumin through various kinds of spacers such as glutaryl, succinyl, *trans*-aconityl, methylsuccinyl and the trimellityl group. The prior acylation of albumin not only prevented protein polymerization in the presence of carbodiimide, but also increased the extent of conjugation of the drug. The conjugate of mitomycin C-glutarylated albumin showed the best properties among the conjugates prepared in meeting the requirements for a high yield of nonpolymerized product with an adequately high mitomycin C content and stability as a macromolecular prodrug.

抄録 抗腫瘍薬であるマイトマイシンCを、種々のスペーサーを介して血清アルブミンに共有結合させた。あらかじめアルブミンをアシル化することにより、カルボジイミドを用いた反応で惹き起こされる蛋白質同士の高分子化を防ぐだけでなく、高い薬物結合量を得ることが可能となった。合成した5種の結合体の中で、マイトマイシンC-グルタル化アルブミン結合体は、特に高い薬物含量と十分な安定性を示した。