• 系統編號	RN9611-5401		
• 計畫中文名稱	台灣地區砷暴露居民尿中無機砷代謝型態及基因型研究---族聚集及病例對照相關研究(II)		
• 計畫英文名稱	The Rational Design and Synthesis of N-Arylsulfonamide Series Compounds as Anti-Cancer Agents (II)		
• 主管機關	行政院國家科學委員會	• 計畫編號	NSC95-2320-B038-008
• 執行機構	台北醫學大學藥學系		
• 本期期間	9508 ~ 9607		
• 報告頁數	6 頁	• 使用語言	中文
• 研究人員	劉景平 Liou, Jing-Ping		
• 中文關鍵字	--		
• 英文關鍵字	--		

• 中文摘要

我們根據亞培藥廠的 ABT-751(phase II)化合物，進行藥物設計並合成出一系列具 N-Aryl-1-sulfonamides 骨架的雜環化合物，其中化合物 2-5, 9, 10, 14 在抑制癌細胞生長活性試驗中(KB line)，具中等的活性，其 IC50 在 278-886 nM 之間。化合物 7, 11, 13 則展現出和 ABT-751 相當的活性，其 IC50 在 150-200 nM 之間，而最有活性的化合物 8，在人類口腔上皮腫瘤細胞株(KB)的 IC50 達到 80nM。這樣的新骨架 sulfonamide 化合物，鼓舞我們繼續研究其 N-Aryl-1-sulfonamides 衍生物之最適化和其作用機轉

• 英文摘要

A new series of N-Aryl-1-sulfonamides was prepared and identified as potent antiproliferative agents based on ABT-751 (phase II, Abbot) as a template. Compound 2-5, 9, 10, and 14 displayed moderate cytotoxicity with IC50 values of 278-886 nM. Compound 7, 11, and 13 showed substantial activity with IC50 values of 150-200 nM comparable to the parent compound ABT-751. The most potent compound 8 demonstrated strong cytotoxicities with IC50 values of 80 nM against human KB oral epidermoid carcinoma cell line. These findings have encouraged us to extensively explore the novel N-Aryl-1-sulfonamides derivatives and further investigate their mode of action and mechanism.