

# HDAC & PI3K阻害活性を有する抗がん剤

## ナノオーダーで抗がん活性を有する低分子化合物

### 概要

PI3K / AKT経路は細胞の生存と増殖に関わる主要なシグナル伝達経路であるが、様々ながん腫において、その異常な活性化が生じていることが報告されており、がん治療における有力な標的と考えられている。そこで、発明者らは数百種類の化合物を用いてPI3K阻害活性を有する化合物をスクリーニングしたところ、既にHDAC阻害剤として知られるロミデプシン(FK228)およびその類縁体にPI3K阻害活性があることを見出した。

### 効果・応用例

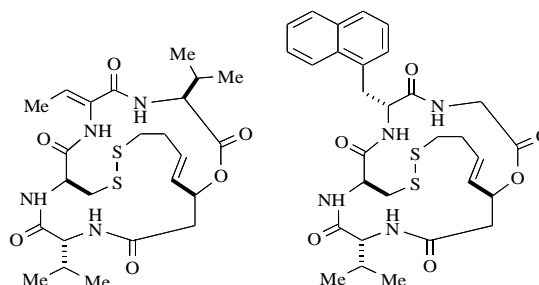
大腸がん細胞を用いた*in vitro*でFK228およびその類縁体の殺細胞効果を評価した。その結果、類縁体のいくつかは、HDAC阻害剤に感受性を有する細胞(HCT116)だけでなくHDAC阻害剤に抵抗性を有する細胞(RKO、CO115)に対してもナノオーダーで殺細胞効果を示し、SAHA(HDAC阻害剤)とLY294002(PI3K阻害剤)の併用よりも高い殺細胞効果を示した。なお、この濃度においては、非がん細胞であるKMST6細胞は顕著な細胞死を生じなかった。

### 特許データシート

特許番号: WO2013/047509

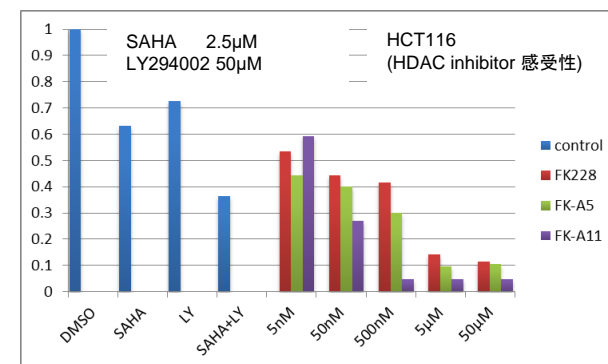
発明者: 西條 憲、石岡 千加史、加藤 正

### ①化合物および類縁体の構造

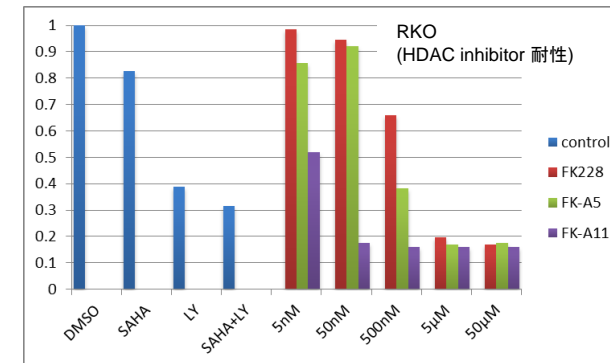
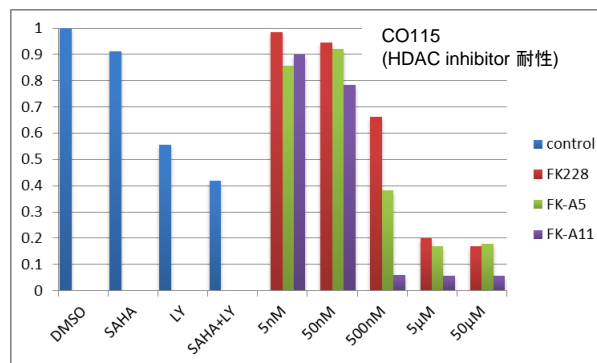


ロミデプシン(FK228) 類縁体(FK-A11)

### ②大腸癌細胞(HCT116)に対する殺細胞効果



### ③大腸癌細胞(RKO、CO115)に対する殺細胞効果



### 連絡先

株式会社 東北テクノアーチ

TEL 022-222-3049 FAX 022-222-3419

お問い合わせは、[こちら](#) からお願い致します。