

HCT-116 細胞に対する細胞増殖抑制活性をもつ N- ω -フェニルアルキル-4-(p-クロロフェニル) ピペリジン-4-オールアナログの合成研究

波多江典之*、久次米永子**、矢野圭吾*、木塚真美*、
芦田莉那*、町支臣成、西山卓志、岡田知晃*、
岩村樹憲**、吉村昭毅*

Heterocycles, **97**, 560-568 (2018).

Synthesis of N- ω -Phenylalkyl-4-(p-Chlorophenyl)-Piperidin-4-ol Analogues with Potent Antiproliferative Activity Against HCT-116 Cells

Noriyuki Hatae, Eiko Kujime, Keigo Yano, Mami Kizuka,
Rina Ashida, Tominari Choshi, Takashi Nishiyama, Chiaki Okada,
Tatsunori Iwamura, and Teruki Yoshimura

ABSTRACT Some opioid analogues, such as morphine and loperamide, were reported to exhibit weak antiproliferative activity against tumor cells. In a study of loperamide analogues, we found that adding an N- ω -phenylalkyl group onto the 4-arylpiperidin-4-ol unit can have important effects on the antiproliferative activity of such compounds against HCT-116 cells. We optimized the distance between the phenyl group and 4-arylpiperidin unit to promote such activity.

抄録 モルヒネやロペラミドなどの一部のオピオイド類似体は、腫瘍細胞に対して弱い抗増殖活性を示すことが報告されている。ロペラミド類似体の研究で、4-アリールピペリジン-4-オールユニットにN- ω -フェニルアルキル基をもつ化合物は、HCT-116細胞に対する抗増殖活性を示すことが明らかとなった。このような活性を促進するために、フェニル基と4-アリールピペリジンユニット間の炭素鎖の距離を最適化する目的で、その誘導体を合成研究した内容である。

*北海道医療大学薬学部

School of Pharmaceutical Sciences, Health Science University of Hokkaido

**松山大学薬学部

College of Pharmaceutical Sciences, Matsuyama University