

# 強效抗癌藥物BO-1978單獨使用或用於聯合治療小細胞肺癌和其他癌症

## 本院覽號

12A-1050527

## 公告日期

## 智財權狀態

美國臨時案已申請、PCT已申請、台灣(發明)已申請、美國已申請、中國已申請、歐盟已申請

## 摘要

本發明設計並合成了一系列氮茛並[6,7-b]吡啶衍生物，其設計為 b-咪啉（拓撲異構酶I和II的抑制部分）和雙（經甲基）吡咯（DNA的交聯部分）之雜合分子。我們發現這些雜合分子在體外和在腫瘤異種移植模型具有強效的抗腫瘤活性，並具多重模式之作用機制，即具有抑制拓撲異構酶I及拓撲異構酶II之活性及誘導DNA交聯的作用。由這些衍生物中，我們發現化合物BO-1978不論單獨使用或與其他藥物組合使用時不僅可顯著抑制異種移植和原位模型的各種人非小細胞肺癌經（NSCLC）的生長，尚可有效地抑制在體外和動物模型中的各種小細胞肺癌（SCLC）細胞之生長。經移植有小細胞肺癌（SCLC H526）細胞的裸鼠，以BO-1978單獨治療或以BO-1978與irinotecan合併治療後分別發現有長期活存（>430天），或腫瘤完全消失的情形。本專利申請包括單獨使用BO-1978或BO-1978與其他抗癌藥物合併使用以為於治療小細胞肺癌。

## 技術優勢

BO-1978的抗小細胞肺癌藥效優於cisplatin，etoposide或irinotecan。經移植有小細胞肺癌（SCLC H526及H211）細胞的裸鼠，以BO-1978單獨治療或以BO-1978與irinotecan合併治療後分別發現有長期活存（>430天），或腫瘤完全消失的情形。這些優點顯示BO-1978發展為臨床治療小細胞肺癌及對標靶抑制劑已產生抗藥性的小細胞肺癌具有很高潛力。

## 應用範圍

治療在臨床上難治療的小細胞肺癌。

## 創作人

李德章、蘇燦隆



中央研究院  
ACADEMIA SINICA