

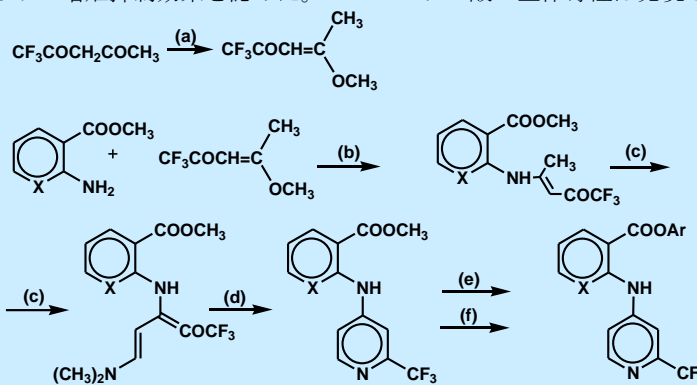
1,1,1-Trifluoroacetylacetone

(1,1,1-トリフルオロアセチルアセトン:略号 TFAcAc)

CF₃COCH₂COCH₃

Purity	99%
CAS Number	367-57-7
Molecular Formula	C ₅ H ₅ F ₃ O ₂
Molecular Weight	154.09

TFAcAc からフルフェナム酸類似の 2-トリフルオロメチル-ピリジン骨格を持つ各種誘導体合成法を開発。各種癌細胞の増殖抑制効果を *in vitro* で NCI full cancer cell line によりスクリーニング、*in vivo* で human cancer cell のマウスへの異種移植による効果を確認。67%の増殖抑制効果を認めた。フルフェナム酸の生体毒性は発現せず。



(a) CH(OCH₃)₃, MeOH, p-TsOH, 55°C, (b) 120°C, (c) DMF-DMA 3eq, Toluene, reflux, (d) CH₃COONH₄ 2eq, DMF, reflux, (e) 10% aq-NaOH, reflux, acidify, (f) ArOH, DCC, CHCl₃

Application

表-1 ; 癌細胞の増殖抑制効果(*in vitro*) NCI Full Cancer Cell Lines (pGI₅₀)

No.	白血病 K562	非小細胞肺 NCI-H23	結腸 SW-620	中枢神経系 SF628	黒色腫 UACC62	腎 SN12C	胸 MFC7
1	7.37	7.44	7.39	6.48	6.54	7.15	7.34
2 _{nd}	7.29	6.59	6.44	5.65	6.51	6.48	6.55

No.1; Ar=pyridin-3-yl, X=CH, No.2; Ar=2-chlorophenyl, X=CH

表-2 ; 異種移植における No.1 化合物の抗腫瘍性と生体毒性

No.	投与量	腫瘍重量% (24 日後)	腫瘍増殖 抑制率	体重減 Max	死亡率
3	100	27%	67%	No wt loss	0
4	67	75%	15%	No wt loss	0

注 ; (1) Number of mice=10, (2) 皮下注射、(3) 投与量 ; mg/kg/day, (4) 24 日後、体重比

(a) ARKIVOC 2011(1) P246-328, (b) CHEMIC nr-4, tom-65, 2011, p278-283, (c) Chem. Pharm. Bull. 49(6), 2001, p703-706, (d) Bioorganic & Med. Chem. 14, 2004, p5787-5791, (e) J. Med. Chem. 2005, 48, p8245-8252

Properties:

Appearance	Liquid
Boiling point, °C	107

Capacity: 150kg/month

Packing: -

UN, PG: -