



# 2014台灣藥學會藥物化學研討會 2014 PST Medicinal Chemistry Symposium

## 論文摘要集

2014年1月21日至23日  
花蓮東華大學壽豐校區

主辦單位：台灣藥學會藥物化學組  
財團法人臺北市王光昭教授學術教育基金會  
承辦單位：國立臺灣大學藥學專業學院藥學系  
國立東華大學海洋科學學院海洋生物科技研究所



股票代號

# 2014 年台灣藥學會藥物化學研討會 籌辦工作人員名錄

大會主席：曾誠齊

委員：王光昭、陳基旺、顧記華、忻凌偉、王惠珀、  
林淑娟、劉景平、蘇燦隆、李安榮、胡明寬、  
蕭明熙、郭盛助、莊聲宏、張誌祥、李冠漢、  
呂玉玲、曾誠齊、楊世群、陳義龍、高佳麟、  
謝博銓、陳意莉、簡敦誠

召集人：顧記華

總幹事：忻凌偉

學術組：謝皓宇、許琇卿

會場組：王筱雯、楊慧怡、吳昆達

總務組：余佳純、徐瑞苓

網路組：何雨蓁

聯絡人：許琇卿

Shiang

## All Previous PST Medicinal Chemistry Symposiums

No	Date	Organizing Unit	Place
1	84.03.31-84.04.02	臺灣大學 國防醫學院	臺北淡水洲子灣
2	85.03.08-85.03.10	臺北醫學院	臺南曾文水庫青年活動中心
3	86.02.13-86.02.16	高雄醫學院	高雄澄清湖青年活動中心
4	87.07.19-87.07.22	臺灣大學	臺大醫學院
5	88.05.07-88.05.09	國防醫學院	南投日月潭青年活動中心
6	89.07.12-89.07.14	大仁技術學院	大仁技術學院 屏東原住民文化園區
7	90.04.19-90.04.21	工研院生醫工程中心	工研院光復園區 新竹小叮噹遊樂區
8	91.02.04-91.02.06	中國醫藥大學	臺南南元休閒農場
9	93.03.05-93.03.07	高雄醫學院 大仁科技大學	高雄醫學院 大仁科技大學
10	94.09.04-94.09.06	臺北醫學大學	南投溪頭青年活動中心
11	95.09.04-95.09.06	大仁科技大學	大仁科技大學
12	96.05.18-96.05.20	臺灣大學	南投溪頭台大實驗林
13	97.04.25-97.04.27	國防醫學院 臺灣大學	南投溪頭台大實驗林
14	98.06.28-98.06.30	中國醫藥大學 臺灣大學	南投溪頭台大實驗林
15	99.02.01-99.02.05	高雄醫學大學 大仁科技大學	高雄醫學大學 大仁科技大學
16	100.04.03-100.04.05	嘉南藥理科技大學	南投溪頭自然教育園區
17	101.05.05-101.05.07	臺北醫學大學	南投溪頭自然教育園區
18	102.01.22-102.01.24	大仁科技大學 國立海洋生物博物館	屏東H會館 國立海洋生物博物館
19	103.01.21-103.01.23	臺灣大學 東華大學	花蓮東華大學

# 會議議程/Agenda

Tuesday - Jan 21, 2014

時間/Time	內容/Events		Location
13:00 -14:30	註冊、報到/Registration		
14:30 - 14:50	OR-01	<b>Chi-Wei Chen</b> (陳季緯, 中央研究院) Combination of Indolizino[6,7- <i>b</i> ]indole and Gefitinib synergistically suppresses the growth of EGFR-mutant NSCLC cells Chairperson: Hsiao-Wen Wang	活動中心 演講廳
14:50 - 15:10	OR-02	<b>Hsueh-Yun Lee</b> (李學耘, 臺北醫學大學) Application of ring transformation in the A-ring modification of antitubulin agents Chairperson: Chi-Wei Chen	
15:10 - 15:30	OR-03	<b>Chia-Yu Wu</b> (吳佳瑀, 臺灣大學) Design and Synthesis of Quinazolinone Derivatives as Potential HDAC Inhibitors Chairperson: Hsueh-Yun Lee	
15:30 - 15:50	OR-04	<b>Fong-Pin Liang</b> (梁峰賓, 中國醫藥大學) Development of emodin analogs as ErbB2-targeting agents Chairperson: Chia-Yu Wu	
15:50 - 16:10	Coffee Break		
16:10 - 16:30	OR-05	<b>You-Ren Chen</b> (陳宥任, 高雄醫學大學) Discovery of Benzo[ <i>f</i> ]indole-4,9-dione Derivatives as New Type of Anti-inflammatory Agents Chairperson: Fong-Pin Liang	活動中心 演講廳
16:30 - 16:50	OR-06	<b>Chia-Chung Lee</b> (李佳駿, 國防醫學院) Design, Synthesis and Biological Evaluation of Salicylanilides as Potent Inhibitors of Osteoclastogenesis and Bone Resorption Chairperson: You-Ren Chen	
16:50 - 17:10	OR-07	<b>Zhen-Yuan Liao</b> (廖鎮垣, 臺灣師範大學) Metal-free synthesis of 2- and 3-substituted quinazolinone Chairperson: Chia-Chung Lee	
17:10 - 17:30	OR-08	<b>Hsiao-Wen Wang</b> (王筱雯, 臺灣大學) Galactose-Modified Liposomes as a Targeted Antigen-Delivery Carrier for Intranasal Immunization Chairperson: Zhen-Yuan Liao	
18:30 - 20:00	晚餐/Dinner		活動中心 廣場
20:00 - 21:30	壁報時間/Poster Session		管理學院 走廊

Wednesday - Jan 22, 2014			
時間/Time	內容/Events		Location
07:00 - 08:00	早餐/Breakfast(民宿自理)		
08:00 - 08:20	<b>開幕典禮/Welcome and Opening Remark</b> <b>Chairman: Prof. Cherng-Chyi Tzeng</b>		活動中心 演講廳
08:20 - 09:10	<b>IL-01</b>	<b>邀請演講/Invited lecture: Prof. Jun Xu</b> The Mutual Inspirations of TCM and West Medicine Chairman: Prof. Cherng-Chyi Tzeng	
09:10 - 09:50	<b>IL-02</b>	<b>邀請演講/Invited lecture: Prof. Xianming Deng</b> Compound Centric Kinome-wide Profiling for Kinase Inhibitor Discovery Chairman: Prof. Ji-Wang Chern	
09:50 - 10:20	Coffee Break (團體照/Group Photograph)		
10:20 - 10:40	<b>OR-09</b>	<b>Yi-Min Liu (劉宜旻, 臺北醫學大學)</b> Furanylazaindoles: Potent Anticancer Agents in Vitro and in Vivo Chairperson: Kuang-Chan Hsieh	活動中心 演講廳
10:40 - 11:00	<b>OR-10</b>	<b>Tai-Lin Chen (陳泰霖, 中央研究院)</b> Water-soluble ureidomustine (BO-1055) potently suppresses orthotopic 22Rv/HL2 prostate tumor xenografts: early preclinical studies Chairperson: Yi-Min Liu	
11:00 - 11:20	<b>OR-11</b>	<b>Qingqing Ye (葉青青, 臺灣大學)</b> Design and Synthesis of Hydroxyquinoline Derivatives as Potential Multifunctional Agents for the Treatment of Alzheimer's Disease Chairperson: Tai-Lin Chen	
11:20 - 11:40	<b>OR-12</b>	<b>Kuang-Chan Hsieh (謝光展, 高雄醫學大學)</b> Simvastatin Derivatives as Novel Anabolic Agent Chairperson: Qingqing Ye	
11:40 - 12:30	午餐(便當)/Lunch		
12:30 - 17:30	花蓮半日遊/Outdoor Activities		
18:00 - 20:00	大會晚宴/Conference Banquet		活動中心 廣場
20:30 - 21:30	台灣藥學會藥化組委員會議/Committee Meeting		

**Thursday - Jan 23, 2014**

時間/Time	內容/Events		Location
07:00 - 08:00	早餐/Breakfast(民宿自理)		
08:00 - 09:00	自行逛東華校園		
09:00 - 09:40	<b>IL-03</b>	<b>邀請演講/Invited lecture: Prof. Ching-Feng Weng</b> Natural compounds potentiated insulin receptor kinase to enhance insulin-dependent glucose transporter 4 translocation  Chairman: Prof. Shin-Hun Juang	活動中心
09:40 - 10:20	<b>IL-04</b>	<b>邀請演講/Invited lecture: Prof. Chih-Ching Huang</b> Highly flexible and stable aptamer-caged nanoparticles for control of thrombin activity  Chairman: Prof. Ching-Ping Liu	演講廳
10:20 - 10:40	Coffee Break		
10:40 - 11:10	<b>頒獎/Award presentation ceremony</b> <b>閉幕/Closing Remark</b> <b>主席/Chairman: Prof. Cherng-Chyi Tzeng</b>		活動中心 演講廳
11:10 -	午餐(便當)/Lunch		
12:00 -	賦歸(驅車前往花蓮火車站)/Departure		

## Synthesis and bioevaluation of indazole derivatives as Nrf2 regulators

Chien-Yu Chen<sup>a</sup>, Jau-Yang Chen<sup>a</sup>, Rong-Yu Chen<sup>a</sup>, Chih-Yu Lee<sup>a</sup>, Tzu-Yen Huang<sup>a</sup>,  
Zong-Hang Wu<sup>a</sup>, Chien-Fu Huang<sup>b</sup>, Fong-Pin Liang<sup>a</sup>, Shin-Hun Juang<sup>a</sup>, Chih-Shiang Chang<sup>a,\*</sup>

<sup>a</sup>*Graduate Institute of Pharmaceutical Chemistry, College of Pharmacy, China Medical University, Taiwan.*

<sup>b</sup>*Department of Biological Science and Technology, I-Shou University, Taiwan.*

Nuclear factor E2-related factor 2 (Nrf-2), a transcriptional factor, responds to cellular oxidative stress or environmental carcinogens, which drives a variety of downstream cytoprotective genes. Although Nrf-2 protein was initially considered as a cellular redox sensor, accumulating reports indicated that it played controversial roles both in chemoprevention and carcinogenesis. Nrf-2 protein functions as an oncoprotein or induces chemoresistance for its cytoprotective property. However, Nrf-2 protein is able to suppress oxidative or inflammatory stress and the DNA mutation, and therefore prevents occurrence of several diseases, including cancer, diabetes, obesity and organ injury by hypoxia or chemical toxins. Hence, development of Nrf-2-activating drugs could be applied to prevent numerous diseases. We successfully synthesized a series of indazole derivatives and bioevaluated for the Nrf2 activity on the nasopharyngeal carcinoma cell line TW01-9ARE、TW01-15ARE and HSC3-9ARE. The structure-activity relationship of indazole derivatives results were shown introduction of chlorine atom at 4-position of indazole ring promoted the Nrf2 activity. The 6-substituted phenyl moiety on indazoles revealed less effect for Nrf2 activity. However, the substitution of primary amine or secondary amine at 4-position of indazole ring dramatically attenuated the Nrf2 activity.