

## 業績目録 (平成27年)

化学教室・医薬品化学

### 英文総説

1. Suzuki T. Development of Epigenetic Modulators for Cancer Therapy. *Kyoto-furitsu Ika Daigaku Zasshi* 2015, 124, 839-847.
2. Wang X, Huang B, Suzuki T, Liu X, Zhan P. Medicinal chemistry insights in the discovery of novel lysine-specific demethylase 1 inhibitors. *Epigenomics* 2015, 7, 1379-1396. (IF=4.044)
3. Zhan P, Itoh Y, Suzuki T, Liu X. Strategies for the Discovery of Target-specific or Isoform-selective Modulators. *J. Med. Chem.* 2015, 58, 7611-7633. (IF=5.589)

### 英文原著

1. Nakagawa H, Seike S, Sugimoto M, Ieda N, Kawaguchi M, Suzuki T, Miyata N. Peptidyl prolyl isomerase Pin1-inhibitory activity of D-glutamic and D-aspartic acid derivatives bearing a cyclic aliphatic amine moiety. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2015, 25, 5619-5624. (IF=2.486)
2. Erburu M, Munoz-Cobo I, Dominguez J, Beltran E, Suzuki T, Mai A, Valente S, Puerta E, Tordera RM. Chronic stress and antidepressant induced changes in Hdac5 and Sirt2 affect synaptic plasticity. *Eur. Neuropsychopharmacol.* 2015, 25, 2036-2048. (IF=4.409)
3. Ye Q, Holowatyj A, Wu J, Liu H, Zhang L, Suzuki T, Yang ZQ. Genetic alterations of KDM4 subfamily and therapeutic effect of novel demethylase inhibitor in breast cancer. *Am. J. Cancer Res.* 2015, 5, 1519-1530. (IF=3.425)
4. Ieda N, Hishikawa K, Eto K, Kitamura K, Mori S, Maeno M, Kawaguchi M, Suzuki T, Fukuhara K, Miyata N, Furuta T, Nabekura J, Nakagawa H. A double bond-conjugated dimethylnitrobenzene-type photolabile nitric oxide donor with improved two-photon cross section. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2015, 25, 3172-3175. (IF=2.486)
5. Kozako T, Suzuki T, Yoshimitsu M, Uchida Y, Kuroki A, Aikawa A, Honda S, Arima N, Soeda S. Novel small-molecule SIRT1 inhibitors induce

- cell death in adult T-cell leukemia cells. *Sci. Rep.* 2015, 5, 11345. (IF=5.228)
6. Tsumoto H, Ogasawara D, Hashii N, Suzuki T, Akimoto Y, Endo T, Miura Y. Enrichment of O-GlcNAc-modified peptides using novel thiol-alkyne and thiol-disulfide exchange. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2015, 25, 2645-2649. (IF=2.486)
  7. Itoh Y, Sawada H, Suzuki M, Tojo T, Sasaki R, Hasegawa M, Mizukami T, Suzuki T. Identification of Jumonji AT-Rich Interactive Domain 1A Inhibitors and Their Effect on Cancer Cells. *ACS Med. Chem. Lett.* 2015, 6, 665-670. (IF=3.355)
  8. Krishnan SR, Nair BC, Sareddy GR, Roy SS, Natarajan M, Suzuki T, Peng Y, Raj G, Vadlamudi RK. Novel role of PELP1 in regulating chemotherapy response in mutant p53-expressing triple negative breast cancer cells. *Breast. Cancer Res. Treat.* 2015, 150, 487-99. (IF=4.085)
  9. Hoshino I, Akutsu Y, Murakami K, Akanuma N, Isozaki Y, Maruyama T, Toyozumi T, Matsumoto Y, Suito H, Takahashi M, Sekino N, Komatsu A, Suzuki T, Matsubara H. Histone Demethylase LSD1 Inhibitors Prevent Cell Growth by Regulating Gene Expression in Esophageal Squamous Cell Carcinoma Cells. *Ann. Surg. Oncol.* 2015 in press. (IF=3.655)
  10. Kakizawa T, Ota Y, Itoh Y, Tsumoto H, Suzuki T. Histone H3 peptide based LSD1-selective inhibitors. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2015, 25, 1925-1928. (IF=2.486)
  11. Etani T, Suzuki T, Naiki T, Naiki-Ito A, Ando R, Iida K, Kawai N, Tozawa K, Miyata N, Kohri K, Takahashi S. NCL1, a highly selective lysine-specific demethylase 1 inhibitor, suppresses prostate cancer without adverse effect. *Oncotarget* 2015, 6, 2865-2878. (IF=5.008)
  12. Khan MNA, Tsumoto H, Itoh Y, Ota Y, Suzuki M, Ogasawara D, Nakagawa H, Mizukami T, Miyata N, Suzuki T. Design, synthesis, and biological activity of N-alkylated analogue of NCL1, a selective inhibitor of lysine-specific demethylase 1. *MedChemComm* 2015, 6, 407-412. (IF=2.319)
  13. Miyamura S, Araki M, Suzuki T, Yamaguchi J, Itami K. Stereodivergent Synthesis of Arylcyclopropylamines by Sequential C-H Borylation and Suzuki-Miyaura Coupling. *Angew. Chem. Int. Ed.* 2015, 54, 846-851. (IF=11.709)

## 和文原著

1. 鈴木孝禎「次世代エピジェネティック薬の開発」医学のあゆみ 2015, 255, 654-658.
2. 「創薬を目指したエピジェネティクス制御化合物の創製」薬事日報 2015年1月28日 12面.

## 学会発表

### II) シンポジウム、ワークショップ、パネルディスカッション等

1. 太田庸介、伊藤幸裕、鈴木孝禎 LSD1 高発現がん細胞を標的としたドラッグデリバリー分子の開発 第33回メディシナルケミストリーシンポジウム 1P-49 2015年11月 千葉 MCS 優秀賞
2. 伊藤幸裕、澤田英之、鈴木美紀、東條敏史、水上民夫、鈴木孝禎 Lysine demethylase 5 (KDM5) 選択的阻害薬の創製とがん細胞に対する効果 第33回メディシナルケミストリーシンポジウム 1P-59 2015年11月 千葉
3. 太田庸介、伊藤幸裕、鈴木孝禎 LSD1 阻害をトリガーとする二重機能型抗がん剤の開発 第41回反応と合成の進歩シンポジウム 1P-24S 2015年10月 東大阪

## 研究助成（競争的研究助成金）

総額 4,146 万円

## 公的助成

代表

鈴木孝禎（総額：3,044 万円）

- 1 文部科学省科学研究費補助金 挑戦的萌芽研究 平成27～28年度  
遺伝性疾患の治療を目指した脱メチル化/アセチル化酵素モジュレータの  
創製  
助成金額 140 万円
- 2 文部科学省科学研究費補助金 特別研究員奨励費 平成26～28年度  
SIRT7 阻害薬の創製研究  
助成金額 100 万円

- 3 国立研究開発法人科学技術振興機構 CREST 平成 26～28 年度  
エピジェネティクス制御化合物の設計、合成と酵素阻害活性評価  
助成金額 2,804 万円

伊藤幸裕（総額：212 万円）

- 1 文部科学省科学研究費補助金 若手研究（B） 平成 26～28 年度  
酵素反応機構を基に設計したユビキチン活性化酵素阻害薬の創製  
助成金額 110 万円
- 2 国立研究開発法人科学技術振興機構 研究成果最適展開支援プログラム  
（A-STEP） 平成 26～27 年度  
タンパク質脱アセチル化酵素 SIRT2 を標的とした神経変性疾患治療薬の創製  
助成金額 102 万円

太田庸介（総額：100 万円）

- 1 文部科学省科学研究費補助金 特別研究員奨励費 平成 27 年度  
リシン脱メチル化酵素 LSD1 阻害をトリガーとする二重機能型抗がん剤  
の開発  
助成金額 100 万円

財団等からの助成

代表

鈴木孝禎（総額：300 万円）

- 1 公益財団法人武田科学振興財団 研究助成金 平成 27 年度  
タンパク質のメチル化を制御する低分子化合物の創薬と抗がん剤への効用  
助成金額 300 万円

伊藤幸裕（総額：450 万円）

- 1 京都高度技術研究所 京都発革新的医療技術研究開発助成事業 助成金  
平成 27 年度  
リシン脱メチル化酵素阻害薬の創製：標的酵素に活性化される阻害薬  
助成金額 100 万円

- 2 公益財団法人テルモ生命科学芸術財団 平成 27 年度  
LSD1 自身に活性化されることで機能を発揮する LSD1 阻害薬の創製  
助成金額 200 万円
- 3 公益財団法人東京生化学研究会 平成 27 年度  
創薬化学研究を志向した C-H $\cdots$ O 水素結合解析  
助成金額 150 万円

分担

鈴木孝禎（総額：40 万円）

- 1 京都ヘルスサイエンス総合研究センター共同研究プロジェクト 平成 27 年度  
遺伝子発現制御および細胞死にかかわる新規機能調節分子の探索研究  
助成金額 40 万円