

## 業績目録 (平成30年)

講座名 医薬品化学

### (A-a) 英文著書

#### \*分担執筆の場合

- 1 Takayoshi Suzuki “Molecular Technology for Epigenetics Toward Drug Discovery” *Molecular Technology: Life Innovation* (Wiley) 2018, pp 219-256.

### (A-b) 和文著書

#### \*分担執筆の場合

- 1 太田庸介、鈴木孝禎「がん細胞選択的な薬物放出の分子技術と抗がん剤開発」がん治療で起こる副作用・合併症の治療法と薬剤開発 技術情報協会 2018, pp420-426.

### (B-a) 英文総説

- 1 Ota Y, Suzuki T. Drug design concepts for LSD1-selective inhibitors. *Chem. Rec.* 2018, 18, 1782-1791. (IF=5.387)
- 2 Itoh Y. Chemical Protein Degradation Approach and its Application to Epigenetic Targets. *Chem. Rec.* 2018, 18, 1681-1700. (IF=5.387)

### (B-b) 和文総説

- 1 鈴木孝禎「ヒストン脱メチル化酵素阻害剤の開発」*医学のあゆみ* 2018, 266, 855-858.

### (C-a) 英文原著

- 1 Marek M, Shaik TB, Heimbarg T, Chakrabarti A, Lancelot J, Ramos-Morales E, Da Veiga C, Kalinin D, Melesina J, Robaa D, Schmidtkunz K, Suzuki T, Holl R, Ennifar E, Pierce RJ, Jung M, Sippl W, Romier C. Characterization of Histone Deacetylase 8 (HDAC8) Selective Inhibition Reveals Specific Active Site Structural and Functional Determinants. *J. Med. Chem.* 2018, 61, 10000-10016. (IF=6.054)
- 2 Matsui M, Terasawa K, Kajikuri J, Kito H, Endo K, Jaikhan P, Suzuki

- T, Ohya S. Histone Deacetylases Enhance Ca<sup>2+</sup>-Activated K<sup>+</sup> Channel KCa3.1 Expression in Murine Inflammatory CD4<sup>+</sup> T Cells. *Int. J. Mol. Sci.* 2018, 19, E2942. (IF= 4.183)
- 3 Kozako T, Mellini P, Ohsugi T, Aikawa A, Uchida Y, Honda S, Suzuki T. Novel small molecule SIRT2 inhibitors induce cell death in leukemic cell lines. *BMC Cancer.* 2018, 18, 791. (IF= 2.993)
  - 4 Alagarswamy K, Shinohara K, Takayanagi S, Fukuyo M, Okabe A, Rahmutulla B, Yoda N, Qin R, Shiga N, Sugiura M, Sato H, Kita K, Suzuki T, Nemoto T, Kaneda A. "Region-specific alteration of histone modification by LSD1 inhibitor conjugated with pyrrole-imidazole polyamide" *Oncotarget* 2018,9,29316-29335.
  - 5 Ota Y, Kakizawa T, Itoh Y, Suzuki T. "Design, Synthesis, and In Vitro Evaluation of Novel Histone H3 Peptide-Based LSD1 Inactivators Incorporating  $\alpha$ ,  $\alpha$ -Disubstituted Amino Acids with  $\gamma$ -Turn-Inducing Structures" *Molecules* 2018, 23, 1099. (IF= 3.060)
  - 6 Yamamoto R, Kawahara M, Ito S, Satoh J, Tatsumi G, Hishizawa M, Suzuki T, Andoh A. "Selective dissociation between LSD1 and GFI1B by a LSD1 inhibitor NCD38 induces the activation of ERG super-enhancer in erythroleukemia cells" *Oncotarget* 2018, 9, 21007-21021.
  - 7 Tsukamoto S, Sakae Y, Itoh Y, Suzuki T, Okamoto Y. Computational analysis for selectivity of histone deacetylase inhibitor by replica-exchange umbrella sampling molecular dynamics simulations. *J. Chem. Phys.* 2018, 148, 125102. (IF= 2.997)
  - 8 Itoh Y, Suzuki M. Design, synthesis, and biological evaluation of novel ubiquitin-activating enzyme inhibitors. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2018, 28, 2723-2727. (IF= 2.448)
  - 9 Katayama S, Morii A, Makanga JO, Suzuki T, Miyata N, Inazu T. HDAC8 regulates neural differentiation through embryoid body formation in P19 cells. *Biochem. Biophys. Res. Commun.* 2018, 498, 45-51. (IF= 2.705)
  - 10 Ota Y, Miyamura S, Araki M, Itoh Y, Yasuda S, Masuda M, Taniguchi T, Sowa Y, Sakai T, Itami K, Yamaguchi J, Suzuki T. Design, synthesis and evaluation of  $\gamma$ -turn mimetics as LSD1-selective inhibitors. *Bioorg. Med. Chem.* 2018, 26, 775-785. (IF= 2.802)
  - 11 Kakizawa T, Ota Y, Itoh Y, Suzuki T. Histone H3 peptides

incorporating modified lysine residues as lysine-specific demethylase 1 inhibitors. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2018, 28, 167-169. (IF= 2.448)

(D) 学会発表

I) 特別講演、教育講演等

- 1 鈴木孝禎 “Chemical Control of Epigenetics~Discovery of Histone Lysine Demethylase Inhibitors and Histone Deacetylase Inhibitors~” Lecture in Global Frontiers in Life Science A, Kyoto University; Jul 4, 2018 (Kyoto)
- 2 鈴木孝禎 “Chemical Control of Epigenetics for the Treatment of Diseases” ICPAC Langkawi2018; Oct 31 2018 (Langkawi, Malaysia)
- 3 鈴木孝禎 「医学部における有機化学の教育と研究」有機化学系教科担当教員会議特別講演；2018年11月4日熊本
- 4 鈴木孝禎 “Discovery of histone demethylase inhibitors” The 5th International Cancer Epigenomics Symposium 2018; Nov 8, 2018 Chiba
- 5 伊藤幸裕 リシン修飾酵素を制御する低分子化合物の創製～化学的発想を活かした創薬化学～ 第4回 近畿薬学シンポジウム：化学系の若い力；2018年9月29日 神戸
- 6 伊藤幸裕 リシン修飾酵素を制御する低分子化合物の創製 化学的発想に基づいた生理活性物質の創製 第21回スクリプス・バイオメディカルフォーラム；2018年12月1日 大阪

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 伊藤幸裕、東條敏史、展鵬、李穎、Van der Wiel Alexander、鈴木美紀、内田周作、鈴木孝禎 新規HDAC阻害薬の創製とその酵素阻害速度論 第12回バイオ関連化学シンポジウム 1-01 2018年9月 吹田
- 2 伊藤幸裕、東條敏史、展鵬、李穎、Alexander van der Wiel、鈴木美紀、内田周作、鈴木孝禎 Induced-fit型HDAC1/2阻害剤の同定とその生物活性評価 第44回反応と合成の進歩シンポジウム 20-10 2018年11月 熊本
- 3 磯村茂樹、藤吉竜也、吉澤祐香里、鈴木美紀、鈴木孝禎、奥野義規、佐藤康夫 水中での1,4-ジヒドロピリジン誘導体の合成とそのサーチュイン活性評価 第36回メディスナルケミストリーシンポジウム 3P-07 2018年11月 京都
- 4 三嶋浩和、塚本修一郎、伊藤幸裕、鈴木孝禎、岡本祐幸 レプリカ交

換傘サンプル法によるエピジェネティクス関連酵素の一次構造選択機構の解明 第36回メディシナルケミストリーシンポジウム 3P-07  
2018年11月 京都

- 5 伊藤幸裕、鈴木美紀 新規ユビキチン活性化酵素阻害薬の創製 第36回メディシナルケミストリーシンポジウム 1P-37 2018年11月 京都

### Ⅲ) 国際学会における一般発表

- 1 Yosuke Ota, Yukihiro Itoh, Takayoshi Suzuki. Controlled Release of Anticancer Drugs by LSD1 Inhibition. 4th International Symposium for Medicinal Sciences 270-ISMS10 Mar 2018 (Kanazawa)

### E 研究助成 (競争的研究助成金)

総額 3,875 万円

#### 公的助成

代表 鈴木孝禎 (総額 : 2,460 万円)

- 1 文部科学省科学研究費補助金 基盤研究 (B) 平成 28~31 年度  
酵素反応の遷移状態構造を時間依存的に安定化する阻害薬の創製  
助成金額 360 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 29~31 年度  
SIRT7 阻害薬の設計、合成と生物活性評価  
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 26~31 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 2,000 万円

#### 分担

鈴木孝禎 (総額 : 1,145 万円)

- 1 国立研究開発法人日本医療研究開発機構 次世代がん医療創生研究事業  
平成 30 年度  
エピノゲム修飾阻害剤の改変  
助成金額 145 万円
- 2 国立研究開発法人日本医療研究開発機構 難治性疾患実用化研究事業  
平成 30 年度

高活性かつ高選択的な HDAC6 阻害剤の創製 助成金額 1,000 万円

代表 伊藤幸裕 (総額: 120 万円)

- 1 文部科学省科学研究費補助金 基盤研究 (C) 平成 29~31 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 120 万円

代表 太田庸介 (総額: 110 万円)

- 1 文部科学省科学研究費補助金 若手研究 (基金) 平成 30~32 年度  
LSD1 により活性化される新規プロドラッグの開発 助成金額 110 万円

財団等からの助成

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 30 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

## 記入上の注意

業績目録は、別紙様式2のとおり (A-a) 英文著書、(A-b) 和文著書、(B-a) 英文総説、(B-b) 和文総説、(C-a) 英文原著、(C-b) 和文原著及び、(D) 学会発表に分類し、それぞれ年代順に列挙し別葉としてください。

- (1) 英文総説と英文原著論文については、Impact Factor がある場合には、論文ごとに Impact Factor(最新版)を記載してください。
- (2) 雑誌名が変更となっている場合はその記載の末尾に詳細を明記してください。