

業績目録 (令和3年)

大学院科目名 医系化学

(A-b) 和文著書

- 1 内田智士. アジュバント機能一体型部分2本鎖 mRNA を用いたワクチン. 創薬研究者がこれだけは知っておきたい最新のウイルス学 pp510-518, 2021.
- 2 内田智士. ワクチンの効きが悪い条件を逆手にとった自己免疫疾患の治療薬の開発. 実験医学 2021年5月号 Vol. 39 No. 8 CRISPR 最新ツールボックス pp1237-1238, 2021.

(B-a) 英文総説

- 1 Abbasi S, Uchida S. Multifunctional immunoadjuvants for use in minimalist nucleic acid vaccines. *Pharmaceutics* 13: 644, 2021. (IF=6.525)

(B-b) 和文総説

- 1 内田智士. 細胞編集のツールとしての mRNA—生存促進 mRNA を用いた疾患治療と細胞移植. *Yakugaku Zasshi* 141: 655-659, 2021.
- 2 内田智士. メッセンジャー RNA のワクチン及び医薬品としての応用. *京都府立医科大学雑誌* 30(7):441-449, 2021.
- 3 内田智士. RNA オリゴマーを用いた mRNA 修飾法の開発と mRNA 送達, ワクチンへの展開. *核酸医薬学会会誌* 2021 16-26, 2021.
- 4 内田智士. mRNA ワクチンの基盤技術と COVID-19 への展開. *臨床とウイルス* 49(3): 133-138, 2021.
- 5 大庭誠. ペプチドフォルダマーの特性と機能. *ファルマシア* 57(9): 828-831, 2021.

(C-a) 英文原著

- 1 Iida T, Itoh Y, Takahashi Y, Yamashita Y, Kurohara T, Miyake Y, Oba M, Suzuki T. Design, synthesis, and biological evaluation of lysine demethylase 5C degraders. *ChemMedChem* 16: 1609-1618, 2021. (IF=3.540)

- 2 Abbasi S, Uchida S, Toh K, Tockary TA, Dirisala A, Hayashi K, Fukushima S, Kataoka K. Co-encapsulation of Cas9 mRNA and guide RNA in polyplex micelles enables genome editing in mouse brain. *J Control Release* 332: 260-268, 2021. (IF=11.467)
- 3 Kato T, Kita Y, Iwanari K, Asano A, Oba M, Tanaka M, Doi M. Synthesis of six-membered carbocyclic ring α , α -disubstituted amino acids and arginine-rich peptides to investigate the effect of ring size on the properties of the peptide. *Bioorg Med Chem* 38: 116111, 2021. (IF=3.461)
- 4 Boonstra E, Hatano H, Miyahara Y, Uchida S, Goda T, Cabral H. A proton/macromolecule-sensing approach distinguishes changes in biological membrane permeability during polymer/lipid-based nucleic acid delivery. *J Mater Chem B* 9: 4298-4302, 2021. (IF=7.571)
- 5 Yamaberi Y, Eto R, Umeno T, Kato T, Doi M, Yokoo H, Oba M, Tanaka M. Synthesis of (S)-(-)-cucurbitine and conformation of its homopeptides. *Org Lett* 23: 4358-4362, 2021. (IF=6.072)
- 6 Yoshinaga N, Naito M, Tachihara Y, Boonstra E, Osada K, Cabral H, Uchida S. PEGylation of mRNA by hybridization of complementary PEG-RNA oligonucleotides stabilizes mRNA without using cationic materials. *Pharmaceutics* 13: 800, 2021. (IF=6.525)
- 7 Yokoo H, Yamamoto E, Masada S, Uchiyama N, Tsuji G, Hakamatsuka T, Demizu Y, Izutsu K, Goda Y. N-Nitrosodimethylamine (NDMA) formation from ranitidine impurities: possible root causes of the presence of NDMA in ranitidine hydrochloride. *Chem Pharm Bull* 69: 872-876, 2021. (IF=1.903)
- 8 Yokoo H, Shibata N, Endo A, Ito T, Yanase Y, Murakami Y, Fujii K, Saeki Y, Naito M, Aritake K, Demizu Y. Discovery of a highly potent and selective degrader targeting hematopoietic prostaglandin D synthase via in silico design. *J Med Chem* 64: 15868-15882, 2021. (IF=8.039)
- 9 Fuchigami T, Chiga T, Yoshida S, Oba M, Fukushima Y, Inoue H, Matsuura A, Toriba A, Nakayama M. Synthesis and characterization of radiogallium-labeled cationic amphiphilic peptides as tumor imaging agents. *Cancers* 13: 2388, 2021. (IF=6.575)

- 10 Uchida S, Yamaberi Y, Tanaka M, Oba M. A helix foldamer oligopeptide improves intracellular stability and prolongs protein expression of delivered mRNA. *Nanoscale* 13: 18941–18946, 2021. (IF=8.307)
- 11 Yokoo H, Ohoka N, Takyo M, Ito T, Tsuchiya K, Kurohara T, Fukuhara K, Inoue T, Naito M, Demizu Y. Peptide stapling improves the sustainability of a peptide-based chimeric molecule that induces targeted protein degradation. *Int J Mol Sci* 22: 8772, 2021. (IF=6.208)
- 12 Kurohara T, Ito T, Tsuji G, Misawa T, Yokoo H, Yanase Y, Shoda T, Sakai T, Hosoe J, Uchiyama N, Akiyama H, Demizu Y. Synthesis of Norgestomet and its 17 β -isomer and evaluation of their agonistic activities against progesterone receptor. *Bioorg Med Chem* 49: 116425, 2021. (IF=3.461)
- 13 Kamegawa R, Naito M, Uchida S, Kim HJ, Kim BS, Miyata K. Bioinspired silicification of mRNA-Loaded polyion complexes for macrophage-targeted mRNA delivery. *ACS Appl Bio Mater* 4: 7790–7799, 2021. (IF=---)
- 14 Li J, Ge Z, Toh K, Liu X, Dirisala A, Ke W, Wen P, Zhou H, Wang Z, Xiao S, Guyse JFRV, Tockary TA, Xie J, Gonzalez-Carter D, Kinoh H, Uchida S, Anraku Y, Kataoka K. Enzymatically transformable polymersome-based nanotherapeutics to eliminate minimal relapsable cancer. *Adv Mater* 2105254, 2021. (IF=30.849)
- 15 Prakash M, Itoh Y, Fujiwara Y, Takahashi Y, Takada Y, Mellini P, Elboray E, Terao M, Yamashita Y, Yamamoto C, Yamaguchi T, Kotoku M, Kitao Y, Singh R, Roy R, Obika S, Oba M, Wang DO, Suzuki T. Identification of potent and selective inhibitors of fat mass obesity associated protein using a fragment-merging approach. *J Med Chem* 64: 15810–15824, 2021. (IF=8.039)

(D) 学会発表

I) 特別講演、教育講演等

- 1 内田智士. 教育講演 SDGs とバイオマテリアル. 第 43 回日本バイオマテリアル学会大会, 2021 年 11 月 28 日, 名古屋.
- 2 内田智士. RNA architectonics を基盤とした mRNA 送達とワクチン. 日本バイオマテリアル学会関西ブロック 第 16 回若手研究発表会, 2021 年 12 月 4 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 内田智士. メッセンジャーRNA を用いた COVID-19 ワクチン開発とその先へ. 東京大学大学院工学系研究科バイオエンジニアリング専攻主催 次世代医療技術研究会 令和2年度第5回情報交換会, 2021年2月24日, オンライン.
- 2 内田智士. メッセンジャーRNA の COVID-19 ワクチンへの応用とその後の展望. 一般社団法人 医療産業イノベーション機構主催, 2020年度 医療産業イノベーションフォーラム, 2021年2月25日, オンライン.
- 3 内田智士. メッセンジャーRNA 医薬の COVID-19 ワクチンへの応用とその先. 日本学術振興, 先端ナノデバイス・材料テクノロジー第151委員, 2021年3月5日, オンライン.
- 4 内田智士. 万能薬にもなるメッセンジャーRNA の謎に迫る! ~コロナウイルスに対する救世主. サイエンスカフェ@ふくおか, 2021年3月5日, オンライン.
- 5 内田智士. ところで、ワクチンってどうなの?. 第1回 iCONM 市民公開講座, 「ナノ医療って何なの??」, 2021年3月27日, オンライン.
- 6 内田智士. 新型コロナワクチン開発の動向と背景. 公益財団法人大隅基礎科学創成財団 第5回アドバイザー会議, 2021年4月23日, オンライン.
- 7 内田智士. mRNA ワクチンとその先の mRNA 医薬の展望. 京都大学同窓会ヘルスケアネットワーク令和, 2021年5月15日, オンライン.
- 8 内田智士. 新型コロナウイルスと mRNA ワクチン - mRNA 医薬のワクチンへの応用とその先. EWE 三月会 - 早稲田電気工学会, 2021年5月17日, オンライン.
- 9 大庭誠. mRNA 医薬の細胞への効率的送達を目指した化学修飾技術・DDS 技術. mRNA 医薬品の研究開発動向と開発戦略 技術情報協会主催セミナー, 2021年5月27日, オンライン.
- 10 内田智士. 新型コロナウイルスワクチンについて. 京都府立医科大学 附属北部医療センター 第1回府民公開講座, 2021年6月27日, 京都.
- 11 内田智士. mRNA 医薬、遺伝子治療薬の全身投与に向けた取り組み. 日本核酸医薬学会第6回年会, 2021年6月28日, オンライン.
- 12 内田智士. COVID-19 に対する mRNA ワクチン開発の動向と独自の取り組み. JAACT2021 日本動物細胞工学会, 2021年7月28日, オンライン.

- 13 内田智士. 2本鎖PEG-オリゴリシンを用いた肝類洞壁一過的コーティングによるナノ医薬品の体内動態制御. 第70回高分子討論会, 2021年9月7日, オンライン.
- 14 内田智士. メッセンジャーRNA ワクチン～新型コロナウイルスからがん治療へ. 第38回日本癌学会市民公開講座 先端技術と社会背景により変わるがん医療, 2021年10月2日, 横浜.
- 15 内田智士. 新型コロナウイルス感染症に対する救世主～かわさき発のワクチンを目指して mRNA ワクチン. 2021年度後期かわさき市民アカデミー・地域協働講座(企業連携講座)「地域社会に貢献している川崎の会社と人々 その22, 2021年10月7日, 川崎.
- 16 内田智士. mRNA 医薬品の今後の投与経路考察と研究開発動向. mRNA 医薬品の DDS 技術開発と製剤化 技術情報協会主催セミナー, 2021年10月8日, オンライン.
- 17 大庭誠. 細胞内への mRNA の送達を可能にする化学修飾技術の開発と製剤化. mRNA 医薬品の DDS 技術開発と製剤化 技術情報協会主催セミナー, 2021年10月8日, オンライン.
- 18 内田智士. mRNA 医薬品を用いた疾患治療について. Pharma R&D Conference 2021, 2021年10月28日, オンライン.
- 19 内田智士. COVID-19 mRNA ワクチンの科学応用物理学会. 有機分子・バイオエレクトロニクス分科会 第12回市民講座「コロナウイルスとたたかう応用物理ー2年目の技術の最前線ー」, 2021年11月6日, オンライン.

Ⅲ) 国際学会における一般発表

- 1 Uchida Satoshi, Abbasi Saed, Kataoka Kazunori, Polyplex micelles co-loading Cas9 mRNA and single guide RNA exhibit efficient genome editing in the mouse brain, 9th International mRNA Health Conference, Nov. 9, 2021, Online
- 2 Uchida Satoshi, Yoshinaga Naoto, Koji Kyoko, Cabral Horacio, Assembling Several mRNA Strands for Facilitating mRNA Delivery with and without Using Carriers, 24th Annual Meeting of the American Society of Gene & Cell Therapy, May 12, 2021, Online

E 研究助成(競争的研究助成金)

総額 6,000 万円

公的助成

代表（総額）・小計 1,640 万円

- 1 文部科学省科学研究費補助金基盤研究（A） 令和 3～6 年度
RNA 工学を基盤とした中分子 mRNA 医薬の創製とその治療応用
助成金額 725 万円
- 2 文部科学省科学研究費補助金挑戦的研究（萌芽） 令和 3～4 年度
精密設計ペプチドを用いた細胞外 DNA の in situ PEG 被覆による抗炎症治療
助成金額 250 万円
- 3 日本医療研究開発機構（AMED）：新興・再興感染症に対する革新的医薬品等開発推進研究事業 令和 3～5 年度
助成金額 665 万円

分担・小計 3,910 万円

- 1 JST 共創の場形成支援プログラム 令和 3～4 年度
ゼロカーボンバイオ産業創出による資源循環共創拠点
助成金額 90 万円
- 2 京都ヘルスサイエンス総合研究センター共同研究 令和 3 年度
高機能薬物送達人工ペプチドの開発を基盤とする治療薬創製
助成金額 20 万円
- 3 日本医療研究開発機構（AMED）：創薬基盤推進研究事業 令和 3 年～7 年度
高分子ミセルによる核酸・ペプチド・タンパク質医薬品の送達技術に関する研究
助成金額 100 万円
- 4 日本医療研究開発機構（AMED）：革新的先端研究開発支援事業（インキュベートタイプ：LEAP） 令和 3 年～7 年度
化学を基盤とした mRNA の分子設計・製造法の革新とワクチンへの展開
助成金額 3,500 万円
- 5 日本医療研究開発機構（AMED）：創薬基盤推進研究事業（中分子医薬品等の新規ドラッグデリバリーシステムの開発） 令和 2～4 年度
助成金額 200 万円

財団等からの助成

代表（総額）・小計 450 万円

- 1 テルモ生命科学財団 研究助成 バイオマテリアル研究 令和 2～3 年度
ミトコンドリア遺伝子治療を目指したペプチド材料の開発
助成金額 100 万円

- 2 篷庵社 特別研究助成 令和 3～4 年度
がんの核酸医薬治療を目指したペプチド材料の開発
助成金額 250 万円
- 3 ENT M Dr. 浅野登暉子基金医学基礎研究助成事業（助成金）
新規ペプチド核酸を基にした核酸応答性ナノ粒子の開発と抗がん剤への
展開
助成金額 100 万円