

科学研究費助成事業 研究成果報告書

令和 2 年 6 月 24 日現在

機関番号：16101

研究種目：基盤研究(A) (一般)

研究期間：2016～2019

課題番号：16H02611

研究課題名(和文) 次世代タンパク性医薬品開発に向けた反応システム系の開発と展開

研究課題名(英文) Development of methods for modification of proteins with its application to protein drugs

研究代表者

大高 章 (OTAKA, Akira)

徳島大学・大学院医歯薬学研究部(薬学域)・教授

研究者番号：20201973

交付決定額(研究期間全体)：(直接経費) 33,900,000円

研究成果の概要(和文)：生物製剤の代表格であるタンパク質性医薬品の高機能化が求められている。このためタンパク質の配列特異的な修飾反応の開発が必要であるが、実用的な反応は皆無であった。そこで、この状況を打破するために、修飾反応に有用なチオエステルユニットの配列選択的創出を目指して検討を積み重ねた。その結果、Ni(II)を利用した四回のアシルトランスファーを利用する方法論、位置選択的なシステインのシアノ化を利用する方法、システイン-プロリン-ロイシン配列の酵素的変換を起点とする3種類の方法論を開発するに至った。特に第3番目の方法論を利用することで200残基を超えるタンパク質の位置選択的修飾が可能であることを明らかにした。

研究成果の学術的意義や社会的意義

本研究では次世代タンパク性医薬品開発の基盤技術となるアミノ酸配列選択的な修飾反応を可能とするチオエステル化法3種を開発した。配列選択的な反応開発はタンパク質化学領域において極めて重要な研究課題であり、全世界で多くの研究者が挑戦を続けている課題である。この課題に3種類の新たな方法論を提供できたことは、学術的に大変大きな意義を有するものである。さらに、本研究の成果を契機としてタンパク性医薬品の高機能化が進展することが予想され、社会的意義にも大きなものがある。

研究成果の概要(英文)：Establishment of native chemical ligation (NCL) featuring chemoselective reaction between thioester and N-terminal cysteine units in peptide fragments has greatly advanced protein chemistry. This powerful NCL protocol requires the peptide thioester as an indispensable synthetic intermediate. Much effort has been devoted to the development of methodologies for preparation of such thioesters including protein thioesters. In this context, being inspired by the intein-mediated protein-editing as a naturally occurring thioester-forming system, we have developed protocols for preparing peptide/protein thioesters. Furthermore, generation of thioesters from naturally occurring protein sequences has been highly desired. In this context, we have developed three types of protocols applicable to naturally occurring peptide sequence, including SQAT, S-cyanylation-mediated and CPase Y-mediated protocols.

研究分野：創薬科学

キーワード：タンパク性医薬 タンパク質修飾 チオエステル インテイン タンパク質化学合成

様式 C - 19、F - 19 - 1、Z - 19 (共通)

1. 研究開始当初の背景

近年の医薬品販売額上位品目は、従来の低分子医薬品からタンパク質製剤を中心とした生物製剤に大きくシフトしている。抗体医薬などが代表例である。さて、第一期の生物製剤ブームは一段落し、現在タンパク質性医薬品の高機能化に進みつつある。ここで必要となる基盤技術の一つとして、発現タンパク質などを自由自在に修飾する化学的手法がある。ここで用いられてきた化学的方法論は専らアミノ酸残基特異的な化学反応である。多くはシステイン側鎖チオール基やリジン側鎖アミノ基が反応の起点として利用されてきた。しかし、アミノ酸100残基以上からなるタンパク質中には、一般にこれら反応起点として利用可能なアミノ酸は複数個存在する。すなわち、残基特異的な反応を利用して、均一性の担保された修飾タンパク質を取得することは極めて困難である。そこで、残基特異的な反応に代わり、配列特異的な修飾に利用可能な反応が開発できれば、生物製剤の高機能化を通じて、今後始まるであろう第二次の生物製剤ブームを支える化学的基盤の創出に繋がるものである。さて、配列選択的な反応としては酵素反応が良く知られている。そこで、酵素反応を利用して配列選択的な修飾を達成しようとする試みも行われているが、汎用性などの点で、いまだ解決すべき課題も多いのが現状である。一方、配列選択的な修飾に利用可能な化学反応は皆無であった。そこで、タンパク質チオエステル誘導体が種々の修飾反応応用可能である点に着目し、特定のC末端配列のみを選択的にチオエステルに変換する方法論の開発を行うことにした。

2. 研究の目的

タンパク質性医薬品の高機能化に向け、タンパク質中の特定配列を認識して、修飾を可能とする化学反応の開発が不可欠である。さて、化学修飾を施すにあたり、天然タンパク質に含まれない人工構造を利用すれば、比較的容易に修飾を行うことが可能である。しかし、多くの生物医薬品の製造方法であるタンパク質発現法により得られたサンプルには適用できない。そこで、本研究では、天然型アミノ酸のみを含むタンパク質(天然型タンパク質)の特定配列を認識し、多様性に富んだ官能基・機能性ユニットの導入が可能となる修飾反応を開発することを、研究の目的に据えた。

3. 研究の方法

以下の研究方法を列挙する。

- (1) 修飾を施すタンパク質分子は、発現系で調整可能なものとする。
- (2) 修飾反応の起点官能基として、アシルヒドラジド構造を利用することにした。
- (3) タンパク質の自己編集システムを化学的な模倣を研究戦略とした。
- (4) 配列選択性を付与する反応については、後述するように3つの方法論について検討を行うことにした。2つについては完全化学方法論であり、残り一つについては酵素法と化学法を融合して行うことにした。

4. 研究成果

(1) SQAT 法

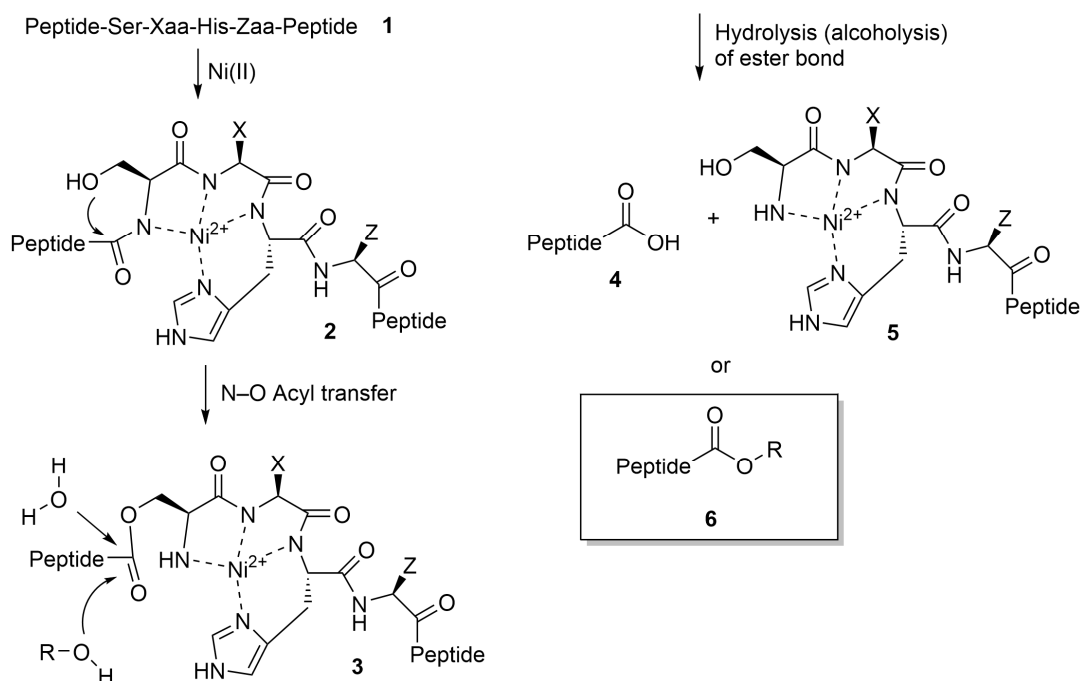


図1 ニッケルイオンの配位を利用した選択的ペプチド結合加水分解

まず、Intein の N-S アシル基転移反応の模倣を通じた SQAT 法の成果について説明する。SQAT 法は sequential quadruple acyl transfer の略称で 4 回の連続したアシル転移反応により天然アミノ酸配列をチオエステルに変換するものである。この方法論は Ni(II)を利用して Ser-Xaa-His-Yaa 配列の Ser の N 端側ペプチド結合を選択的に切断する Bal らの方法論を基盤とするものである (図 1)。Bal らの反応では、Ser-Xaa-His-Yaa 配列を含む基質ペプチド 1 を Ni(II)塩で処理すると Ser-Xaa-His 配列部分のペプチド結合とヒスチジンのイミダゾール基が Ni(II)に配位した複合体 2 となり、次いでセリン側鎖の水酸基が N 端側ペプチド結合を切断し、O-アシルイソペプチド中間体 3 が生成、これが加水分解を受け、分解ペプチド (4 および 5) が得られる。適当なアルコール存在下で Ni(II)を利用した分解反応を行えば、ペプチドオキシエステル 6 が得られるものと仮定した。

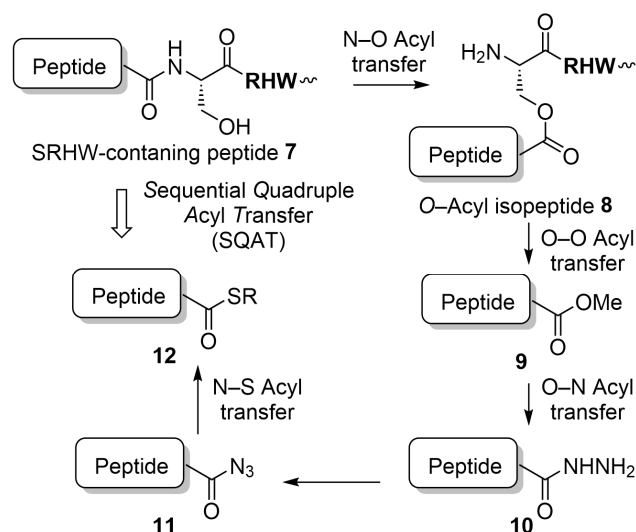


図 2 SQAT 法によるチオエステル合成

そこで、Bal らの分解反応をアルコール存在下で行い、まずオキシエステルを調製し、次いでこれをチオエステルへ変換する計画を立てた。すなわち、メタノール存在下、基質ペプチド 7 を Ni(II)によるアルコリシス反応に付し、イソペプチド中間体 8 を経て、ペプチドメチルエステル 9 に変換した。得られたメチルエステルをヒドラジン処理に付し、ペプチドヒドラジド 10 に変換後、チオエステル 12 へと変換する戦略を採用した。この一連の反応では 4 つの連続したアシル転移反応が含まれているので SQAT 法 (sequential quadruple acyl transfer) と命名した (図 2)。本反応はペプチドレベルであれば十分に適用可能であることを ANP チオエステルフラグメントの合成を通じて検証した。本手法のタンパク質への展開においては、最初の Ni(II)存在条件下でのメタノリシス反応が最も重要な検討箇所である。メタノール存在下でのタンパク質の溶解、凝集など解決すべき課題は多く残されている。

(2) Zn finger を利用した位置選択的 S-シアノ化反応を利用したチオエステル合成法

S-シアノ化は、システインの N 端側ペプチド結合の切断のための修飾として利用されてきた。すなわち、S-シアノ化ペプチド 13 を塩基性水溶液で処理するとペプチド結合の加水分解が進行し、カルボン酸体あるいはアミド体 14 (アンモニア水で処理した場合) とイミノチアゾリジンペプチド 15 が得られる (図 3)。一方、ヒドラジン処理に付すことで、ペプチドヒドラジド 16 に導くことができれば、チオエステル調製法が確立できるものと考えた。まずシステイン 1 残基を含むペプチドのヒドラジドへの変換は、予想通り、Xaa-Cys 間で可能であった。しかし、複数のシステイン残基含有ペプチドへの適用では、特定のシステイン残基選択的なシアノ化が必須であり、位置選択的シアノ化反応の開発が不可欠であった。

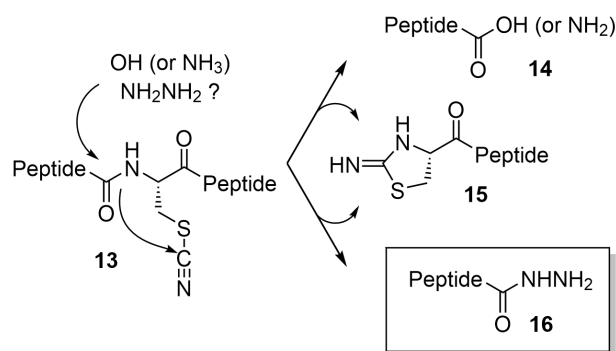


図 3 シアノ化を介したペプチド結合の分解

戦略として Zn finger 配列を利用した。Zn finger 配列は約 30 アミノ酸からなり、一般にシステイン、ヒスチジン 2 残基ずつが Zn に配位した複合体を形成し、さらに Zn に配位するシステイン残基が Zn finger 配列の N 末端近傍に存在するという特徴を有している。そこで、Zn finger 配列を含む融合ペプチド 17 を調製し、Zn との複合体形成を利用した Zn finger 配列内の位置選択的な S-シアノ化を計画した。戦略は図 4 に示したとおりである。Zn finger 配列を C 端側に含む融合ペプチド 17 を調製する。融合ペプチド 17 を Zn に配位させ、Zn 複合体 18 とする。ペプチド 18 の Zn と配位していないシステインの SH 基を適当な保護基で保護し、S-保護 Zn finger ペプチド 19 を得る。Zn finger を壊し、Zn finger 配列中のシステイン残基を遊離にしたペプチド 20 とし、次いでチオール基をシアノ化し S-保護シアノ化ペプチド 21 とする。得られた位置選択的 S-シアノ化ペプチド 21 をヒドラジンで処理し、ペプチドヒドラジド 22 に変換

戦略として Zn finger 配列を利用した。Zn finger 配列は約 30 アミノ酸からなり、一般にシステイン、ヒスチジン 2 残基ずつが Zn に配位した複合体を形成し、さらに Zn に配位するシステイン残基が Zn finger 配列の N 末端近傍に存在するという特徴を有している。そこで、Zn finger 配列を含む融合ペプチド 17 を調製し、Zn との複合体形成を利用した Zn finger 配列内の位置選択的な S-シアノ化を計画した。戦略は図 4 に示したとおりである。Zn finger 配列を C 端側に含む融合ペプチド 17 を調製する。融合ペプチド 17 を Zn に配位させ、Zn 複合体 18 とする。ペプチド 18 の Zn と配位していないシステインの SH 基を適当な保護基で保護し、S-保護 Zn finger ペプチド 19 を得る。Zn finger を壊し、Zn finger 配列中のシステイン残基を遊離にしたペプチド 20 とし、次いでチオール基をシアノ化し S-保護シアノ化ペプチド 21 とする。得られた位置選択的 S-シアノ化ペプチド 21 をヒドラジンで処理し、ペプチドヒドラジド 22 に変換

した後、目的配列中の S-保護基とヒドラジド部分をチオエステルに変換することで、目的とするシステイン含有ペプチドチオエステル 23 への変換を達成した。

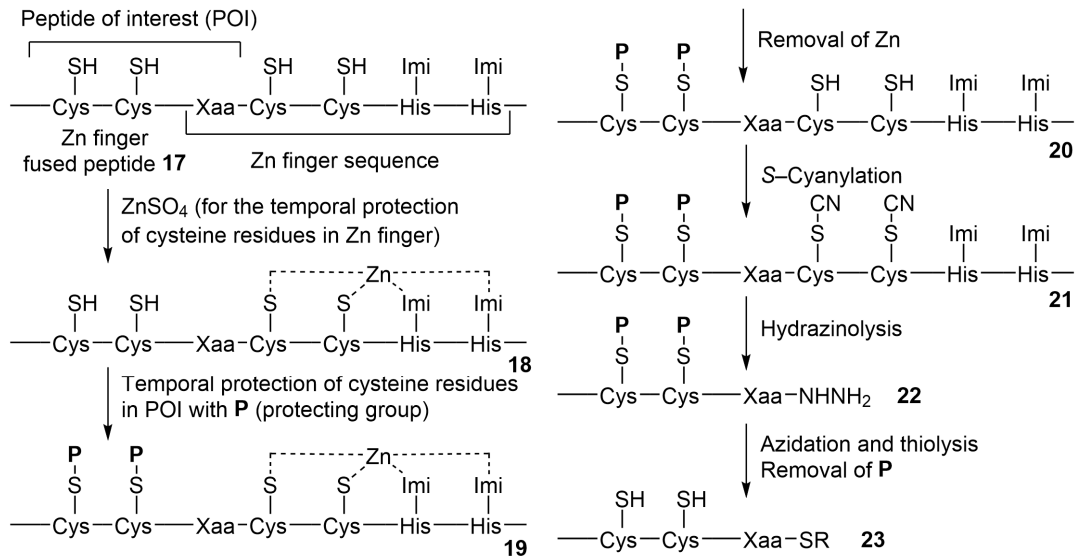


図 4 Zn-finger を利用した位置選択的シアノ化とチオエステル合成

(3) CPaseY と化学的手法を融合したトレースレスチオエステル化法

上述の純粋化学的方法論である SQAT 法および Zn finger を利用した位置選択的 S-シアノ化反応を利用したチオエステル合成法は、新規反応であるが、タンパク質への応用では制限があった。

そこで、酵素的な手法と化学的手法の融合法であるカルボキシペプチダーゼ (CPaseY) を利用した方法を開発した。CPaseY はセリンプロテアーゼに分類されタンパク質の C 末端側からアミノ酸を 1 残基ずつ遊離させるエキソペプチダーゼである。この酵素反応において酵素-基質複合体として CPaseY の活性中心のセリン側鎖水酸基がアシル化されたアシル酵素 24 が生じ、これが加水分解されアミノ酸が遊離する。この反応機構に着目し、ヒドラジン存在下でタンパク質の CPaseY による分解を行えば、チオエステル前駆体であるタンパク質ヒドラジド 25 が取得できると考えた (図 5)。

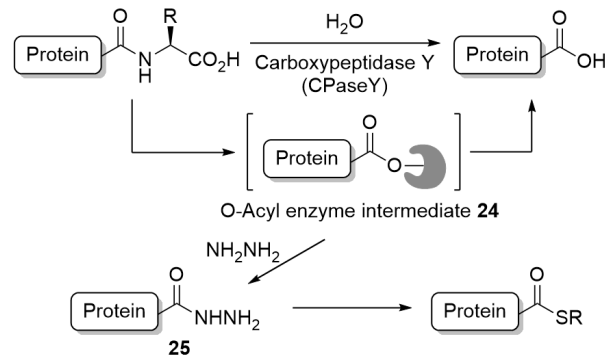


図 5 ヒドラジン存在下での酵素反応

確かにペプチドヒドラジドは生成するが、時間経過に伴いさらなる分解が進行することが判明した。そこで、生成するペプチドヒドラ

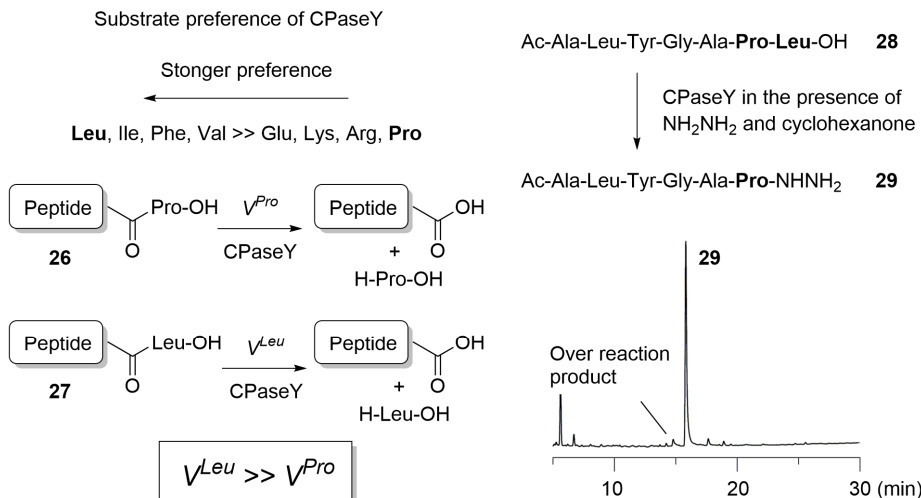


図 6 酵素の基質嗜好性に着目したプロリンチオエステルの選択的合成

ジドをヒドラゾンとしてトラップすることを目的にシクロヘキサノン存在下で酵素反応を試みた。目的ヒドラジドの収率は向上したものの、過剰分解の完全抑制には至らなかった。そこで、基質ペプチド C 末端アミノ酸に対する CPaseY の選択性に着目した (図 6)。

CPaseY は C 末端アミノ酸として Leu, Ile, Phe, Val のような疎水性アミノ酸を好む。一方、Glu, Lys, Arg 等の親水性アミノ酸および Pro を含むペプチドは基質となりにくい。すなわち、C 末端 Pro ペプチド 26 と Leu ペプチド 27 を比較すると、ペプチド 27 がより速やかに CPaseY による加水分解反応を受ける。そこで、C 末端側に Pro-Leu 配列を導入し基質ペプチド 28 をヒドラジン存在下で CPaseY 処理に付した。予想通り Pro ヒドラジドペプチド 29 が定量的に得られた。さらに、ヒドラジドペプチドのチオエステルへの変換も常法に従い容易に達成できた。さて、CPaseY の C 末端アミノ酸に対する選択制を利用する本手法では、調製可能なチオエステルは Pro に限定される。さらに、Pro チオエステルは NCL への応用展開の観点では、最も望ましくないアミノ酸である。すなわち、Pro チオエステルの NCL 反応における反応性は低く、NCL に利用するには特別な反応条件の設定が必要となる。Pro チオエステルを介して、20 種類すべてのアミノ酸チオエステルに変換するため、相本らにより開発された Cysteinylyl Prolyl Ester (CPE)法に着目した。CPE 法は、図 7 の枠内に示すように C 末端 Cys-Pro-Oxy-ester 部分の Cys チオール基への N 端側ペプチドのアシル転移とそれに伴う遊離アミノ基の生成、さらに生成したアミノ基の Pro-Oxyester 部位への求核攻撃により、ジケトピペラジン型チオエステルを与えるものである。これを参考に、Pro チオエステルでも同様の反応が起こり、20 種類すべてのアミノ酸チオエステルの合成が可能と考えた。

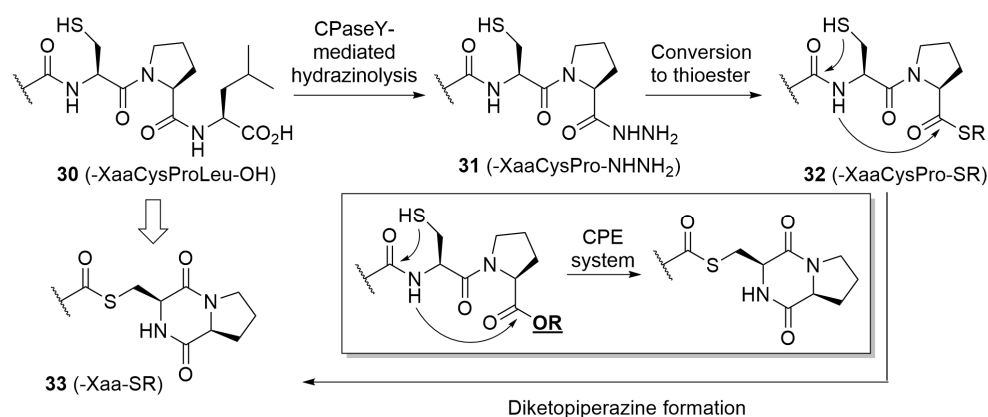


図 7 酵素処理 ジケトピペラジン形成を利用したトレースレスなチオエステル合成

すなわち、C 末端にチオエステル調製用の Cys-Pro-Leu-OH 配列を導入したモデルペプチド 30 を CPaseY によるヒドラジド化反応、Pro チオエステル化反応と続くジケトピペラジンチオエステル 33 への変換反応に付した。CPaseY によるヒドラジド化反応は定量的に進行し、Pro ヒドラジド体 31 が得られた。これを、Pro チオエステル 32 に変換すると、直ちにジケトピペラジン化に伴うジケトピペラジンチオエステル 33 およびチオール交換によりアリールチオエステル体が得られた。ここにシステインペプチドを作用させると NCL 反応が進行し、基質ペプチドはタグ部分が除去された NCL 縮合体へと変換された。そこで、C 末端に Cys-Pro-Leu-OH 配列を導入した glutathione S-transferase (GST) を発現し、これを CPaseY によるチオエステル化反応と続く化学合成ペプチドとの NCL 反応に付したところ 70% の変換効率で修飾 GST タンパク質が得られた。本法ではチオエステル化の認識配列として導入した三残基のペプチド配列が最終生成物には残らない点 (トレースレスである) ということが、従来の酵素法に見られない大きな特徴である。さらに、本法を利用してヒト血清アルブミンのチオエステル化とこれに続く修飾反応に成功した。

以上、本研究では 3 種類の独自のタンパク質の配列選択的修飾反応を開発してきた。これら反応は、次世代タンパク質医薬品の開発に極めて有用な反応であると考えており、今後さらなる応用展開を目指す予定である。

5. 主な発表論文等

〔雑誌論文〕 計38件（うち査読付論文 37件 / うち国際共著 0件 / うちオープンアクセス 37件）

1. 著者名 Kento Ohkawachi, Daishiroh Kobayashi, Kyohei Morimoto, Akira Shigenaga, Masaya Denda, Kenzo Yamatsugu, Motomu Kanai and Akira Otaka	4. 巻 -
2. 論文標題 Sulfanyl-methyl-dimethylaminopyridine as a Useful Thiol Additive for Ligation Chemistry in Peptide/Protein Synthesis	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 Organic Letters	6. 最初と最後の頁 -
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.orglett.0c01383	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -
1. 著者名 Naoto Naruse, Daishiroh Kobayashi, Kento Ohkawachi, Akira Shigenaga and Akira Otaka	4. 巻 85
2. 論文標題 Copper-mediated deprotection of thiazolidine and selenazolidine derivatives applied to native chemical ligation	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 The Journal of Organic Chemistry	6. 最初と最後の頁 1425-1433
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.joc.9b02388	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -
1. 著者名 Atsushi Nakayama, Akira Ohtani, Tsubasa Inokuma, Daisuke Tsuji, Haruka Mukaiyama, Nakayama Akira, Kouji Itou, Akira Otaka, Tanino Keiji and Kosuke Namba	4. 巻 3
2. 論文標題 Development of a 1,3a,6a-triazapentalene derivatives as a compact and thiol-specific fluorescent labeling reagent	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 Communications Chemistry	6. 最初と最後の頁 1-9
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1038/s42004-019-0250-0	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -
1. 著者名 Takuya Morisaki, Akira Shigenaga and Akira Otaka	4. 巻 68
2. 論文標題 Development of a turn-on fluorescent traceable linker employing N-sulfanylethylcoumarinyl amide for enrichment and visualization of target proteins	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 Chemical & Pharmaceutical Bulletin	6. 最初と最後の頁 216-219
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1248/cpb.c19-00726	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Tsubasa Inokuma, Takuya Sakakibara, Takatoshi Someno, Kana Masui, Akira Shigenaga, Akira Otaka and Ken-ichi Yamada	4. 巻 25
2. 論文標題 Asymmetric Synthesis of α -Amino Phosphonic Acids Using Stable Imino Phosphonate as a Universal Precursor	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 Chemistry - A European Journal	6. 最初と最後の頁 13829-13832
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/chem.201903572	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Chiaki Komiya, Akira Shigenaga, Jun Tsukimoto, Masahiro Ueda, Takuya Morisaki, Tsubasa Inokuma, Kouji Itou and Akira Otaka	4. 巻 55
2. 論文標題 Traceless synthesis of protein thioesters using enzyme-mediated hydrazinolysis and subsequent self-editing of cysteinyl prolyl sequence	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 Chemical Communications	6. 最初と最後の頁 7029-7032
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1039/C9CC03583D	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Haruka Kawahara, Naoki Miyashita, Kohki Tachibana, Yusuke Tsuda, Kyohei Morimoto, Kouhei Tsuji, Akira Shigenaga, Akira Otaka, Tatsuhiro Ishida and Keiichiro Okuhira	4. 巻 42
2. 論文標題 A photo-activatable peptide mimicking functions of apolipoprotein A-I	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 Biological & Pharmaceutical Bulletin	6. 最初と最後の頁 1019-1024
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1248/bpb.b19-00114	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 重永 章、大高 章	4. 巻 91
2. 論文標題 有機化学的視点からの標的タンパク質精製・機能解明ツールの開発	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 生化学	6. 最初と最後の頁 795-799
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.14952/SEIKAGAKU.2019.910795	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Shigenaga Akira, Naruse Naoto, Otaka Akira	4. 巻 74
2. 論文標題 ProteoFind: A script for finding proteins that are suitable for chemical synthesis	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Tetrahedron	6. 最初と最後の頁 2291-2297
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.tet.2018.03.030	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Naruse Naoto, Ohkawachi Kento, Inokuma Tsubasa, Shigenaga Akira, Otaka Akira	4. 巻 20
2. 論文標題 Resin-Bound Crypto-Thioester for Native Chemical Ligation	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Organic Letters	6. 最初と最後の頁 2449-2453
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.orglett.8b00795	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Inaba Hiroshi, Uemura Akihito, Morishita Kazushi, Kohiki Taiki, Shigenaga Akira, Otaka Akira, Matsuura Kazunori	4. 巻 8
2. 論文標題 Light-induced propulsion of a giant liposome driven by peptide nanofibre growth	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Scientific Reports	6. 最初と最後の頁 1-10
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1038/s41598-018-24675-7	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Tsubasa Inokuma, Kodai Nishida, Akira Shigenaga, Ken-ichi Yamada, Akira Otaka	4. 巻 97
2. 論文標題 Direct Enantioselective Indolylolation of Peptidyl Imine for the Synthesis of Indolyl Glycine-Containing Peptides	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Heterocycles	6. 最初と最後の頁 1269-1287
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3987/COM-18-S(T)86	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Mizuguchi Chiharu, Nakamura Mitsuki, Kurimitsu Naoko, Ohgita Takashi, Nishitsuji Kazuchika, Baba Teruhiko, Shigenaga Akira, Shimanouchi Toshinori, Okuhira Keiichiro, Otaka Akira, Saito Hiroyuki	4. 巻 8
2. 論文標題 Effect of Phosphatidylserine and Cholesterol on Membrane-mediated Fibril Formation by the N-terminal Amyloidogenic Fragment of Apolipoprotein A-I	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Scientific Reports	6. 最初と最後の頁 1-12
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1038/s41598-018-23920-3	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 大高 章、重永 章	4. 巻 76
2. 論文標題 天然に学ぶタンパク質合成化学	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 有機合成化学協会誌	6. 最初と最後の頁 45-54
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.5059/yukigoseikyokaishi.76.45	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 大高 章、重永 章	4. 巻 76
2. 論文標題 十字路: Native Chemical Ligation法	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 有機合成化学協会誌	6. 最初と最後の頁 66
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.5059/yukigoseikyokaishi.76.66	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Akira Shigenaga, Jun Yamamoto, Taiki Kohiki, Tsubasa Inokuma and Akira Otaka	4. 巻 23
2. 論文標題 Invention of stimulus-responsive peptide-bond-cleaving residue (Spr) and its application to chemical biology tools	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Journal of Peptide Science	6. 最初と最後の頁 505-513
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/psc.2961	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Inokuma Tsubasa, Jichu Takahisa, Nishida Kodai, Shigenaga Akira, Otaka Akira	4. 巻 65
2. 論文標題 A Convenient Method for Preparation of α -Imino Carboxylic Acid Derivatives and Application to the Asymmetric Synthesis of Unnatural α -Amino Acid Derivative	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Chemical and Pharmaceutical Bulletin	6. 最初と最後の頁 573-581
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1248/cpb.c17-00158	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Yano Akiko, Takahashi Yuko, Moriguchi Hiromi, Inazumi Tomoaki, Koga Tomoaki, Otaka Akira, Sugimoto Yukihiko	4. 巻 1862
2. 論文標題 An aromatic amino acid within intracellular loop 2 of the prostaglandin EP2 receptor is a prerequisite for selective association and activation of G _s	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Biochimica et Biophysica Acta (BBA) - Molecular and Cell Biology of Lipids	6. 最初と最後の頁 615-622
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.bbailip.2017.03.006	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Yoshimaru Tetsuro, Aihara Keisuke, Komatsu Masato, Matsushita Yosuke, Okazaki Yasumasa, Toyokuni Shinya, Honda Junko, Sasa Mitsunori, Miyoshi Yasuo, Otaka Akira, Katagiri Toyomasa	4. 巻 7
2. 論文標題 Stapled BIG3 helical peptide ERAP potentiates anti-tumour activity for breast cancer therapeutics	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Scientific Reports	6. 最初と最後の頁 1-11
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1038/s41598-017-01951-6	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Taiki Kohiki, Yusuke Kato, Yusuke Nishikawa, Kazuko YORITA, Ikuko Sagawa, Masaya Denda, Tsubasa Inokuma, Akira Shigenaga, Kiyoshi Fukui, Akira Otaka	4. 巻 15
2. 論文標題 Elucidation of inhibitor-binding pocket of D-amino acid oxidase using docking simulation and N-sulfanylethylaniilide-based labeling technology.	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Organic & Biomolecular Chemistry	6. 最初と最後の頁 5289-5297
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1039/C7OB00633K	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Otaka Akira, Aihara Keisuke, Inokuma Tsubasa, Jichu Takahisa, Lin Zhenjian, Fu Feixue, Yamaoka Kosuke, Shigenaga Akira, Hutchins David, Schmidt Eric	4. 巻 28
2. 論文標題 Cysteine-Free Intramolecular Ligation of N-Sulfanylethylanilide Peptide Using 4-Mercaptobenzylphosphonic Acid: Synthesis of Cyclic Peptide Trichamide	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Synlett	6. 最初と最後の頁 1944-1949
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1055/s-0036-1589055	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Kohiki Taiki, Nishikawa Yusuke, Inokuma Tsubasa, Shigenaga Akira, Otaka Akira	4. 巻 65
2. 論文標題 Chemical Synthetic Platform for Chlorpromazine Oligomers That Were Reported as Photo-degradation Products of Chlorpromazine	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Chemical and Pharmaceutical Bulletin	6. 最初と最後の頁 1161-1166
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1248/cpb.c17-00692	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Tanegashima Kosuke, Takahashi Rena, Nuriya Hideko, Iwase Rina, Naruse Naoto, Tsuji Kohei, Shigenaga Akira, Otaka Akira, Hara Takahiko	4. 巻 24
2. 論文標題 CXCL14 Acts as a Specific Carrier of CpG DNA into Dendritic Cells and Activates Toll-like Receptor 9-mediated Adaptive Immunity	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 EBioMedicine	6. 最初と最後の頁 247-256
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.ebiom.2017.09.012	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 C. Komiya, K. Aihara, K. Morishita, H. Ding, T. Inokuma, A. Shigenaga, A. Otaka	4. 巻 81
2. 論文標題 Development of an intein-inspired amide cleavage chemical device.	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 The Journal of Organic Chemistry	6. 最初と最後の頁 699-707
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.joc.5b02399	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 T. Shimizu, R. Miyajima, S. Kohei, K. Sakamoto, N. Naruse, M. Kita, A. Shigenaga, A. Otaka	4. 巻 72
2. 論文標題 Facile synthesis of C-terminal peptide thioacids under mild conditions from N-sulfanylethylanilide peptides.	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Tetrahedron	6. 最初と最後の頁 992-998
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.tet.2015.12.070	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 T. Shimizu, R. Miyajima, N. Naruse, K. Yamaoka, K. Aihara, A. Shigenaga, A. Otaka	4. 巻 64
2. 論文標題 Facile preparation of peptides with C-terminal N-alkylamide via radical-initiated dethiocarboxylation.	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Chemical and Pharmaceutical Bulletin	6. 最初と最後の頁 375-378
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1248/cpb.c15-01025,	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 K. Aihara, K. Yamaoka, N. Naruse, T. Inokuma, A. Shigenaga, A. Otaka	4. 巻 18
2. 論文標題 One-pot/sequential native chemical ligation using photocaged crypto-thioester.	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Organic Letters	6. 最初と最後の頁 596-599
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.orglett.5b03661	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Nakamura, T.; Sato, K.; Naruse, N.; Kitakaze, K.; Inokuma, T.; Hirokawa, T.; Shigenaga, A.; Itoh, K.; Otaka, A.	4. 巻 17
2. 論文標題 Tailored synthesis of 162-residue S-monoglycosylated GM2-activator protein (GM2AP) analogues that allows access to protein library.	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 ChemBioChem	6. 最初と最後の頁 1986-1992
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/cbic.201600400	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Eto, M.; Naruse, N.; Morimoto, K.; Yamaoka, K.; Sato, K.; Tsuji, K.; Inokuma, T.; Shigenaga, A.; Otaka, A.	4. 巻 18
2. 論文標題 Development of an anilide type scaffold for the thioester precursor N-sulfanylethylcoumarynyl amide.	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Organic Letters	6. 最初と最後の頁 4416-4419
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.orglett.6b02207	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Tsuda, S.; Mochizuki, M.; Sakamoto, K.; Denda, M.; Nishio, H.; Otaka, A.; Yoshiya, T.	4. 巻 18
2. 論文標題 N-Sulfanylethylaminoxybutyramide (SEAOxy): A Crypto-Thioester Compatible with Fmoc Solid-Phase Peptide Synthesis.	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Organic Letters	6. 最初と最後の頁 5940-5943
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.orglett.6b03055	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 津田雄介、重永 章、佐藤浩平、中村太寛、北風圭介、猪熊 翼、伊藤孝司、大高 章	4. 巻 9
2. 論文標題 天然アミノ酸配列に適用可能な新規タンパク質チオエステル合成法の開発	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Chemical Biology	6. 最初と最後の頁 7-10
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) なし	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Shiho Mikawa, Chiharu Mizuguchi, Kazuchika Nishitsuji, Teruhiko Baba, Akira Shigenaga, Toshinori Shimanouchi, Naomi Sakashita, Akira Otaka, Kenichi Akaji and Hiroyuki Saito	4. 巻 590
2. 論文標題 Heparin promotes fibril formation of the N-terminal fragment of amyloidogenic apolipoprotein A-I	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 FEBS Letters	6. 最初と最後の頁 3492-3500
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/1873-3468.12426	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Masaya Denda, Takuya Morisaki, Taiki Kohiki, Jun Yamamoto, Kohei Sato, Ikuko Sagawa, Tsubasa Inokuma, Youichi Sato, Aiko Yamauchi, Akira Shigenaga and Akira Otaka	4. 巻 14
2. 論文標題 Labelling of endogenous target protein via N-S acyl transfer-mediated activation of N-sulfanylethylamide	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Organic & Biomolecular Chemistry	6. 最初と最後の頁 6244-6251
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1039/C6OB01014H	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Takuya Morisaki, Masaya Denda, Jun Yamamoto, Daisuke Tsuji, Kouji Ito, Tsubasa Inokuma, Akira Shigenaga and Akira Otaka	4. 巻 52
2. 論文標題 An N-Sulfanylethylamide-based traceable linker for enrichment and selective labelling of target proteins	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Chemical Communications	6. 最初と最後の頁 6911-6913
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1039/C6CC01229A	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Yuki Haraya, Ryo Nadai, Hitoshi Kimura, Kazuchika Nishitsuji, Kenji Uchimura, Kumiko Sakai-Kato, Kohsaku Kawakami, Akira Shigenaga, Toru Kawakami, Akira Otaka, Hironobu Hojo, Naomi Sakashita and Hiroyuki Saito	4. 巻 1858
2. 論文標題 Enthalpy-driven interactions with sulfated glycosaminoglycans promote cell membrane penetration of arginine peptides	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Biochimica et Biophysica Acta (BBA) - Biomembranes	6. 最初と最後の頁 1339-1349
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.bbamem.2016.03.021	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Yukihiro Itoh, Keisuke Aihara, Paolo Mellini, Toshifumi Tojo, Yosuke Ota, Hiroki Tsumoto, Viswas Raja Solomon, Peng Zhan, Miki Suzuki, Daisuke Ogasawara, Akira Shigenaga, Tsubasa Inokuma, Hidehiko Nakagawa, Naoki Miyata, Tamio Mizukami, Akira Otaka and Takayoshi Suzuki	4. 巻 59
2. 論文標題 Identification of SNAIL1 Peptide-Based Irreversible Lysine Specific Demethylase 1-Selective Inactivators	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Journal of Medicinal Chemistry	6. 最初と最後の頁 1531-1544
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.jmedchem.5b01323	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Kitakaze Keisuke, Mizutani Yasumichi, Sugiyama Eiji, Tasaki Chikako, Daisuke Tsuji, Nobuo Maita, Hirokawa Takatsugu, Asanuma Daisuke, Kamiya Mako, Sato Kohei, Setou Mitsutoshi, Urano Yasuteru, Togawa Tadayasu, Akira Otaka, Sakuraba Hitoshi and Kouji Itou	4. 巻 126
2. 論文標題 Protease-resistant modified human α -hexosaminidase B ameliorates symptoms in GM2 gangliosidosis model	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 The Journal of Clinical Investigation	6. 最初と最後の頁 1691-1703
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1172/JCI85300	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Hirokazu Kariyazono, Ryo Nadai, Rin Miyajima, Yuki Haraya, Teruhiko Baba, Akira Shigenaga, Keiichiro Okuhira, Akira Otaka and Hiroyuki Saito	4. 巻 22
2. 論文標題 Formation of stable nanodiscs by bihelical apolipoprotein A-I mimetic peptide	5. 発行年 2016年
3. 雑誌名 Journal of Peptide Science	6. 最初と最後の頁 116-122
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/psc.2847	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

〔学会発表〕 計120件 (うち招待講演 7件 / うち国際学会 21件)

1. 発表者名 安養寺 啓太央, 栗飯原 圭佑, 吉丸 哲郎, 西川 祐輔, 小松 正人, 重永 章, 片桐 豊雅, 大高 章
2. 発表標題 乳がん細胞におけるBIG3-PHB2相互作用を標的とした高持続性架橋ペプチドの開発
3. 学会等名 日本薬学会第140年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 金山 忠史, 大川内 健人, 清水 太郎, 重永 章, 大高 章, 石田 竜弘, 奥平 桂一郎
2. 発表標題 人工HDLの化学的性状と抗腫瘍効果への影響に関する検討
3. 学会等名 日本薬学会第140年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 常松 保乃加, 上田 智子, 左東 大輝, 小宮 千明, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 S-Oアシル転移を基盤とする環状デブシペプチドの合成
3. 学会等名 日本薬学会第140年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 榊原 拓哉, 猪熊 翼, 増井 香奈, 重永 章, 大高 章, 山田 健一
2. 発表標題 安定な α -イミノリン酸エステルの開発とキラル α -アミノリン酸の触媒的不斉合成への応用
3. 学会等名 日本薬学会第140年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 Naoto Naruse, Daishiroh Kobayashi, Akira Shigenaga and Akira Otaka
2. 発表標題 Copper-mediated Ring Opening of Thiazolidine Derivative for Protein Chemical Synthesis
3. 学会等名 27th International Society of Heterocyclic Chemistry Congress (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Naoto Naruse, Daishiroh Kobayashi, Kento Ohkawachi, Akira Shigenaga and Akira Otaka
2. 発表標題 Development of Novel Ring-Opening Reaction of N-Terminal Thiazolidine for Chemical Protein Synthesis
3. 学会等名 26th American Peptide Symposium/11th International Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Akira Shigenaga, Takuya Morisaki, Taiki Kohiki, Masaya Denda, Tsubasa Inokuma and Akira Otaka
2. 発表標題 Development of acyl transfer-based chemical biology tools for purification/selective labeling of target proteins
3. 学会等名 5th International Symposium for Medicinal Sciences (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Tsubasa Inokuma, Kohdai Nishida, Kana Masui, Akira Shigenaga, Akira Otaka and Ken-ichi Yamada
2. 発表標題 Chiral Phosphoric Acid-Catalyzed Asymmetric Mannich-Type Reaction Using Imino Peptide as Substrate
3. 学会等名 第12回 有機触媒シンポジウム
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 種子島 幸祐, 三井 貴洋, 岩瀬 璃奈, 成瀬 公人, 重永 章, 大高 章, 原 孝彦
2. 発表標題 CpG DNAと CXCL14による自然免疫系の協調的な調節メカニズム
3. 学会等名 第42回日本分子生物学会年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 中川 美帆, 種子島 幸祐, 三井 貴洋, 成瀬 公人, 重永 章, 大高 章, 佐久間 啓, 原 孝彦
2. 発表標題 ケモカイン CXCL14の脳内ミクログリアに対する働き
3. 学会等名 第42回日本分子生物学会年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 有井 紗由季, 上田 将弘, 重永 章, 大高 章, 石田 竜弘, 奥平 桂一郎
2. 発表標題 プロテインノックダウン法を用いたチミジル酸合成酵素分解誘導剤開発
3. 学会等名 第58回日本薬学会・日本薬剤師会・日本病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 榊原 拓哉, 猪熊 翼, 増井 香奈, 重永 章, 大高 章, 山田 健一
2. 発表標題 安定な α -イミノリン酸エステルへの触媒的不斉付加を用いるキラル β -アミノリン酸の合成
3. 学会等名 第45回反応と合成の進歩シンポジウム
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 小林 大志朗, 成瀬 公人, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 銅塩を利用するシステインS-保護基除去反応の開発
3. 学会等名 第45回反応と合成の進歩シンポジウム
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Tsubasa Inokuma, Kana Masui, Kohdai Nishida, Akira Shigenaga, Akira Otaka and Ken-ichi Yamada
2. 発表標題 Development of the direct asymmetric indolylolation of imino peptide for synthesis of indolyglycine-containing peptide
3. 学会等名 第56回ペプチド討論会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 小林 大志朗, 西田 航大, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 Lossen rearrangement-mediated preparation of N-glyoxylyl peptide without addition of oxidant
3. 学会等名 第56回ペプチド討論会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 浜田 麻衣, 中山 淳, 中山 慎一朗, 寺町 順平, 辻 大輔, 重永 章, 安部 正博, 伊藤 孝司, 大高 章, 難波 康祐
2. 発表標題 天然マクロライドの網羅的全合成が拓く新規多発性骨髄腫治療薬の開発研究
3. 学会等名 2019年度第2回(第30回)日本プロセス化学会東四国フォーラムセミナー
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 大川内 健人, 森本 恭平, 成瀬 公人, 山次 健三, 重永 章, 金井 求, 大高 章
2. 発表標題 チオール導入型DMAP触媒を利用した環状ペプチド合成法の開発
3. 学会等名 第51回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 浜田 麻衣, 森崎 巧也, 中山 淳, 寺町 順平, 辻 大輔, 重永 章, 山本 武範, 篠原 康雄, 大高 章, 伊藤 孝司, 安部 正博, 難波 康祐
2. 発表標題 天然マクロライドの全合成が拓く新規多発性骨髄腫治療薬
3. 学会等名 創薬懇話会2019 in 秋保
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 小林 大志朗, 成瀬 公人, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 銅塩を基点とする, タンパク合成を指向した反応開発研究
3. 学会等名 創薬懇話会2019 in 秋保
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 安養寺 啓太央, 栗飯原 圭佑, 吉丸 哲郎, 重永 章, 片桐 豊雅, 大高 章
2. 発表標題 がん抑制因子PHB2の部分配列を基盤とした乳がん阻害ペプチドの開発
3. 学会等名 創薬懇話会2019 in 秋保
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 大高 章
2. 発表標題 天然に学ぶタンパク質化学とタンパク・ペプチド性医薬品の可能性
3. 学会等名 神戸ポートアイランド創薬フォーラム(招待講演)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 猪熊 翼, 増井 香奈, 西田 航大, 重永 章, 大高 章, 山田 健一
2. 発表標題 ペプチドへの直接的不斉反応による異常アミノ酸含有ペプチド新規合成法の開発
3. 学会等名 日本ケミカルバイオロジー学会第14回年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 金山 忠史, 大川内 健人, 清水 太郎, 重永 章, 大高 章, 石田 竜弘, 奥平 桂一郎
2. 発表標題 腫瘍DDSキャリアとしての人工HDLの調製および動態の評価
3. 学会等名 日本薬学会第34年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 成瀬 公人, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 タンパク質合成を指向したチアゾリジン誘導体の脱保護法の開発
3. 学会等名 日本薬学会第139年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 安養寺 啓太央, 栗飯原 圭佑, 吉丸 哲郎, 重永 章, 片桐 豊雅, 大高 章
2. 発表標題 がん抑制タンパク質PHB2を基盤とした新規創薬シーズの開発
3. 学会等名 日本薬学会第139年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 浜田 麻衣, 中山 淳, 重永 章, 辻 大輔, 寺町 順平, 安部 正博, 伊藤 孝司, 大高 章, 難波 康祐
2. 発表標題 新規Ynone化合物の創生・評価
3. 学会等名 日本薬学会第139年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 猪熊 翼, 西田 航大, 重永 章, 大高 章, 山田 健一
2. 発表標題 ペプチドへの直接的な不斉反応によるインドリルグリシン含有ペプチドの合成
3. 学会等名 日本薬学会第139年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Yusuke Kato, Nobuo Maita, Taiki Kohiki, Sumire Kurosawa, Yusuke Nishikawa, Ikuko Sagawa, Masaya Denda, Tsubasa Inokuma, Yuji Shishido, Kazuko YORITA, Akira Shigenaga, Akira Otaka and Kiyoshi Fukui
2. 発表標題 Combined approach of computation and enzymology to investigate novel D-amino acid oxidase inhibitors
3. 学会等名 The 13th International Symposium of the Institute Network for Biomedical Sciences joint with the 3rd Symposium of the Inter-University Research Network for Trans-Omics Medicine (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Tsubasa Inokuma, Nishida Kodai, Akira Shigenaga, Ken-ichi Yamada and Akira Otaka
2. 発表標題 Novel methodology for the synthesis of-indolyl-glycine containing peptide via direct asymmetric Friedel-Crafts reaction to peptidyl imine
3. 学会等名 35th European Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Taiki Kohiki, Yusuke Kato, Masaya Denda, Yusuke Nishikawa, Kazuko YORITA, Ikuko Sagawa, Tsubasa Inokuma, Akira Shigenaga, Kiyoshi Fukui and Akira Otaka
2. 発表標題 Development and application of novel protein labeling reagent "SEAL"
3. 学会等名 10th International Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Chiaki Komiya, Jun Tsukimoto, Masahiro Ueda, Takuya Morisaki, Tsubasa Inokuma, Akira Shigenaga, Kouji Itou and Akira Otaka
2. 発表標題 Preparation of protein thioesters enabled by carboxypeptidase-mediated C-terminal specific hydrazinolysis
3. 学会等名 10th International Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Naoto Naruse, Kiyoka Matsumoto, Akira Shigenaga and Akira Otaka
2. 発表標題 Development of method for deprotection of N-terminal thiazolidine derivative using copper salt for chemical protein synthesis
3. 学会等名 10th International Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Keitaroh Anyohji, Keisuke Aihara, Tetsuro Yoshimaru, Akira Shigenaga, Toyomasa Katagiri and Akira Otaka
2. 発表標題 Development of anti-cancer peptide based on prohibitin 2
3. 学会等名 10th International Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Kento Ohkawachi, Kyohei Morimoto, Naoto Naruse, Kenzo Yamatsugu, Akira Shigenaga, Motomu Kanai and Akira Otaka
2. 発表標題 Development of methodology for cyclic peptide synthesis using a thiol-incorporated DMAP catalyst
3. 学会等名 10th International Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 榊原 拓哉, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章, 山田 健一
2. 発表標題 非天然側鎖構造を有する β -アミノリン酸の実用的不斉合成
3. 学会等名 第57回日本薬学会・日本薬剤師会・日本病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 森崎 巧也, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 SECmideを基盤としたターンオン型蛍光クリーパブルリンカーの開発
3. 学会等名 第57回日本薬学会・日本薬剤師会・日本病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 上田 将弘, 小宮 千明, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 酵素を利用したチオエステル化反応の効率化を指向したペプチドC末配列の修飾
3. 学会等名 第57回日本薬学会・日本薬剤師会・日本病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 金山 忠史, 奥平 桂一郎, 大川内 健人, 清水 太郎, 重永 章, 大高 章, 石田 竜弘
2. 発表標題 人工HDLの化学的性状と体内動態への影響に関する検討
3. 学会等名 第57回日本薬学会・日本薬剤師会・日本病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 猪熊 翼, 岡田 和貴, 西田 航大, 重永 章, 大高 章, 山田 健一
2. 発表標題 ペプチドイミンに対する不斉1,2-付加を基盤とする非天然アミノ酸含有ペプチドの不斉合成
3. 学会等名 第44回反応と合成の進歩シンポジウム
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 中西 雅之, 古曳 泰規, 重永 章, 大高 章, 田中 信忠, 北出 幸夫, 日野 真美, 野元 裕
2. 発表標題 S-アデノシルホモスチニン加水分解酵素の蛍光性基質の開発
3. 学会等名 第91回日本生化学会大会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 大高 章
2. 発表標題 自然に学ぶタンパク質化学
3. 学会等名 ペプチド研究所 フィッシャー祭 (招待講演)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 小宮 千明, 月本 準, 上田 将弘, 森崎 巧也, 猪熊 翼, 重永 章, 伊藤 孝司, 大高 章
2. 発表標題 発現タンパク質に適用可能な新規チオエステル合成法の開発
3. 学会等名 創薬懇話会 2018 in 志賀島
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 大川内 健人、成瀬 公人、重永 章、大高 章
2. 発表標題 新規チオール触媒を利用した環状ペプチド合成法の開発
3. 学会等名 創薬懇話会 2018 in 志賀島
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 榊原 拓哉, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章, 山田 健一
2. 発表標題 安定なイミンを用いた α -アミノリン酸の実用的不斉合成
3. 学会等名 創薬懇話会 2018 in 志賀島
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 森崎 巧也, 中山 淳, 難波 康祐, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 トレーサブルリンカー を用いた共有結合性低分子の標的同一
3. 学会等名 第50回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 安養寺 啓太央, 栗飯原 圭祐, 吉丸 哲郎, 重永 章, 片桐 豊雅, 大高 章
2. 発表標題 がん 抑制タンパク質PHB2からの創薬リード発掘
3. 学会等名 第50回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 小宮 千明、月本 準、上田 将弘、森崎 巧也、猪熊 翼、重永 章、伊藤 孝司、大高 章
2. 発表標題 加水分解酵素を利用したC末端特異的チオエステル化反応の開発
3. 学会等名 第50回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 成瀬 公人、大川内 健人、猪熊 翼、重永 章、大高 章
2. 発表標題 On-resinチオエステル化法から得られた知見とその応用
3. 学会等名 第50回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 大川内 健人、森本 恭平、成瀬 公人、重永 章、金井 求、大高 章
2. 発表標題 新規チオール触媒を利用した分子内ライゲーション法の開発
3. 学会等名 第50回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 河野 誉良、成瀬 公人、猪熊 翼、重永 章、大高 章
2. 発表標題 N-Sアシル基転移速度 の向上を指向した新規補助基の開発
3. 学会等名 第50回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 上田 将弘、小宮 千明、重永 章、大高 章
2. 発表標題 酵素を利用したチオエステル調製 のためのC末ペプチド配列の最適化
3. 学会等名 第50回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 岩瀬 璃奈、成瀬 公人、種子島 幸祐、重永 章、大高 章、原 孝彦
2. 発表標題 CXCL14とCpG DNAの相互作用によるTLR9活性化の特異性と責任領域の解析
3. 学会等名 第41回日本分子生物学会年会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 三井 貴洋、種子島 幸祐、成瀬 公人、重永 章、大高 章、原 孝彦
2. 発表標題 CpG DNA/CXCL14複合体に対する候補受容体の発現クローニング
3. 学会等名 第41回日本分子生物学会年会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 宮下 直樹、奥平 桂一郎、川原 遥華、津田 雄介、森本 恭平、辻 耕平、重永 章、大高 章、石田 竜弘
2. 発表標題 動脈硬化治療を指向した光制御型HDL構成ペプチドの開発
3. 学会等名 日本薬学会第33年会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 アシル基転移反応を基盤とする標的タンパク質精製・機能解明ツールの開発
3. 学会等名 日本薬学会第138年会(シンポジウム 中分子創薬研究のフロンティア)(招待講演)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 小宮千明、月本 準、森崎巧也、津田雄介、宮島 凜、猪熊 翼、重永 章、伊藤孝司、大高 章
2. 発表標題 均一修飾タンパク質の合成を施行したタンパク質C末端特異的活性化反応の開発
3. 学会等名 日本薬学会第138年会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 大高 章
2. 発表標題 タンパク質加水分解酵素を利用したタンパク質C末端特異的チオエステル化反応の開発
3. 学会等名 ペプチド科学談話会2018(招待講演)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Yusuke Kato, Taiki Kohiki, Yusuke Nishikawa, Ikuko Sagawa, Masaya Denda, Tsubasa Inokuma, Yuji Shishido, Akira Shigenaga, Akira Otaka and Kiyoshi Fukui
2. 発表標題 Studies on binding molecules to D-amino acid oxidase using computational approaches
3. 学会等名 The 12th International Symposium of the Institute Network(国際学会)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 Akira Otaka, Keisuke Aihara, Tetsuro Yoshimaru, Akira Shigenaga and Toyomasa Katagiri
2. 発表標題 Development of long-lasting stapled peptides targeting BIG3-PHB2 interaction in breast cancer cells
3. 学会等名 The 6th Pharmaceutical Sciences World Congress 2017 (国際学会)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 Akira Otaka
2. 発表標題 Development of anti-breast cancer stapled peptides targeting BIG3-PHB2 interaction
3. 学会等名 AIMECS 2017 (国際学会)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 Kazuko YORITA, Sumire Kurosawa, Yuri Yoshida, Yoshiki Kashiwada, Shigeki Sano, Akira Otaka and Kiyoshi Fukui
2. 発表標題 Screening of the effectors for human D-amino acid oxidase and the analyses of structure-activity relationships
3. 学会等名 The 19th triennial International Symposium on Flavins and Flavoproteins (国際学会)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 Takuya Morisaki, Masaya Denda, Jun Yamamoto, Daisuke Tsuji, Tsubasa Inokuma, Kouji Itou, Akira Shigenaga and Akira Otaka
2. 発表標題 Development of N-Sulfanylethylanilide-based Traceable Linker for Purification and Selective Labeling of Target Proteins
3. 学会等名 American Peptide Symposium 2017 (国際学会)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 Naoto Naruse, Kento Ohkawachi, Tsubasa Inokuma, Akira Shigenaga and Akira Otaka
2. 発表標題 Development of methodology for preparation of peptide thioester via on-resin N-S acyl transfer using N-sulfanylethylamide peptide
3. 学会等名 American Peptide Symposium 2017 (国際学会)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 Akira Otaka
2. 発表標題 Application of N-Sulfanylethylamide(SEAlide) Unit to Protein Chemical Synthesis and Protein Enrichment
3. 学会等名 American Peptide Symposium 2017 (招待講演) (国際学会)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 加藤 有介, 古曳 泰規, 西川 祐輔, 佐川 幾子, 傳田 将也, 猪熊 翼, 穴戸 裕二, 重永 章, 大高 章, 福井 清
2. 発表標題 DAO分子表面に結合する阻害分子の計算科学的解析
3. 学会等名 2017年度生命科学系学会合同年次大会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 水口 智晴, 伊藤 恵理子, 中村 光希, 扇田 隆司, 馬場 照彦, 重永 章, 島内 寿徳, 奥平 桂一郎, 大高 章, 斎藤 博幸
2. 発表標題 脂質膜組成によるIowa変異型アポA-Iの線維化制御メカニズムの解明
3. 学会等名 膜シンポジウム2017
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 小久保 友絵, 池田 茉莉那, 渡部 匡史, 重永 章, 大高 章, 藤室 雅弘
2. 発表標題 徳島大学化合物ライブラリーを用いた抗ヘルペスウイルス化合物の探索
3. 学会等名 第67回日本薬学会近畿支部大会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 津田 雄介, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 タンパク質位置選択的修飾を目指したチオエステル調製法の開発
3. 学会等名 第49回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 西田 航大, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 ペプチドへの直接的不斉反応を基盤とする非天然アミノ酸含有ペプチドの新規効率的合成法の開発
3. 学会等名 第49回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 河野 普良, 成瀬 公人, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 N-Sアシル基転移反応の速度差を利用したライゲーション反応のための新規補助基の開発
3. 学会等名 第49回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 西田航大、猪熊 翼、重永 章、大高 章
2. 発表標題 ペプチド創薬を指向した非天然アミノ酸含有ペプチドの新規効率的合成法の開発
3. 学会等名 創薬懇話会2017 in 加賀
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 河野誉良、成瀬公人、猪熊 翼、重永 章、大高 章
2. 発表標題 タンパク質化学合成のための新規N-ペプチジルアニリド型補助基の開発
3. 学会等名 創薬懇話会2017 in 加賀
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 大高 章
2. 発表標題 モルフィネからはじまる薬の話
3. 学会等名 第56回日本薬学会・日本薬剤師会・日本病院薬剤師会 中国四国支部学術大会:高校生向けランチョンセミナー(招待講演)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 古曳 泰規、加藤 有介、西川 祐輔、頼田 和子、佐川 幾子、傳田 将也、猪熊 翼、重永 章、福井 清、大高 章
2. 発表標題 N-Sアシル基転移を基盤としたタンパク質ラベル化法を用いたD-アミノ酸酸化酵素阻害剤の結合サイト解明研究
3. 学会等名 第56回日本薬学会・日本薬剤師会・日本大学病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 大川内健人、成瀬公人、重永 章、大高 章
2. 発表標題 On-resinチオエステル化を利用した環状ペプチド合成法の開発
3. 学会等名 第56回日本薬学会・日本薬剤師会・日本大学病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 芳野 真奈, 宮本 理人, 山岡 朋美, 細井 麻由, 森崎 巧也, 安養寺 啓太央, 重永 章, 大高 章, 土屋 浩一郎
2. 発表標題 骨格筋培養細胞でのレプチン作用におけるSIRT1の役割
3. 学会等名 第56回日本薬学会・日本薬剤師会・日本病院薬剤師会 中国四国支部学術大会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 小宮千明、津田雄介、宮島 凜、猪熊 翼、重永 章、大高 章
2. 発表標題 タンパク質C末端特異的活性化反応の開発
3. 学会等名 第35回メディシナルケミストリーシンポジウム
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 寺中孝久、粟飯原圭佑、山岡浩輔、猪熊 翼、重永 章、大高 章
2. 発表標題 チオエステル等価体ユニットを利用した環状ペプチド効率的合成法の開発
3. 学会等名 第35回メディシナルケミストリーシンポジウム
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 小宮千明、月本 準、森崎巧也、津田雄介、宮島 凜、猪熊 翼、重永 章、伊藤孝司、大高 章
2. 発表標題 Development of methodology for producing thioesters from naturally occurring peptide sequence.
3. 学会等名 第54回ペプチド討論会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 成瀬公人、大川内健人、猪熊 翼、重永 章、伊藤孝司、大高 章
2. 発表標題 N-S-acyl-transfer-mediated On-resin Formation of Thioester with Practical Application to Peptide Synthesis.
3. 学会等名 第54回ペプチド討論会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 川原遥華、奥平桂一郎、宮下直樹、津田雄介、森本恭平、辻 耕平、重永 章、大高 章、石田竜弘
2. 発表標題 光応答性アポリポタンパク質の開発
3. 学会等名 日本薬学会第32年会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 猪熊 翼、西田 航大、重永 章、大高 章
2. 発表標題 ペプチドへの直接的不斉反応を基盤とする新規非天然アミノ酸含有ペプチド合成テクノロジーの開発
3. 学会等名 日本薬学会第137年会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 瀬井 亮, 原矢 佑樹, 西辻 和親, 内村 健治, 加藤 くみ子, 重永 章, 川上 徹, 大高 章, 北條 裕信, 坂下 直実, 斎藤 博幸
2. 発表標題 アルギニンペプチドのグリコサミノグリカン糖鎖を介した細胞膜透過機構に関する物理化学的解析
3. 学会等名 日本薬学会第137年会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 西田 航大, 寺中 孝久, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 MnO ₂ を用いた α -イミノカルボン酸誘導体の効率的合成法の開発
3. 学会等名 日本薬学会第137年会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 古曳 泰規, 傳田 将也, 藤川 昂樹, 猪熊 翼, 重永 章, 小暮 健太郎, 大高 章
2. 発表標題 N-Sulfanylethylamideを用いた細胞内標的タンパク質ラベル化法の開発
3. 学会等名 日本薬学会第137年会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 森本 恭平, 山次 建三, 粟飯原 圭佑, 猪熊 翼, 重永 章, 金井 求, 大高 章
2. 発表標題 DMAP誘導体を用いた環状ペプチド合成法の開発
3. 学会等名 日本薬学会第137年会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 成瀬 公人, 津田 修吾, 大川内 健人, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 効率的タンパク質合成のためのSEALideペプチドを用いたon-resinチオエステル化法の開発
3. 学会等名 日本薬学会第137年会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 河野誉良、成瀬公人、猪熊 翼、重永 章、大高 章
2. 発表標題 チオエステル等価体として機能するタンパク質の化学合成のための新規補助基の開発
3. 学会等名 日本薬学会第137年会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 Akira Otaka, Rin Miyajima, Yusuke Tsuda and Akira Shigenaga.
2. 発表標題 Regioselective S-Cyanylation-mediated Preparation of Peptide Thioester .
3. 学会等名 16th Akabori Conference Japanese-German Symposium on Peptide Science (招待講演) (国際学会)
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 Takahiro Nakamura, Akira Shigenaga, Naoto Naruse, Tsubasa Inokuma, Kouji Itou and Akira Otaka
2. 発表標題 Second-Generation Synthetic Strategy of GM2-Activator Protein (GM2AP) Analogues Applicable to the Preparation of a Protein Library
3. 学会等名 34th European Peptide Symposium 2016 & 8th International Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 Keisuke Aihara, Kosuke Yamaoka, Naoto Naruse, Tsubasa Inokuma, Akira Shigenaga and Akira Otaka
2. 発表標題 One-Pot/Sequential Native Chemical Ligation Using Photo-responsive Crypto-thioester
3. 学会等名 34th European Peptide Symposium 2016 & 8th International Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 Chiaki Komiya, Keisuke Aihara, Tsubasa Inokuma, Akira Shigenaga and Akira Otaka
2. 発表標題 Intein-inspired Amide Bond Processing Device.
3. 学会等名 34th European Peptide Symposium 2016 & 8th International Peptide Symposium (国際学会)
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 種子島 幸祐, 高橋 伶奈, 塗谷 秀子, 成瀬 公人, 辻 耕平, 重永 章, 大高 章, 原 孝彦
2. 発表標題 CXCケモカインCXCL14はCpG DNAに結合し, Toll-like receptor 9シグナルを活性化する
3. 学会等名 第39回日本分子生物学会年会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 成瀬 公人, 種子島 幸祐, 辻 耕平, 猪熊 翼, 重永 章, 原 孝彦, 大高 章
2. 発表標題 N-Sulfanylethylamideペプチドを利用したケモカイン誘導体の合成とToll-like receptor 9の活性化への影響について
3. 学会等名 第34回メディシナルケミストリーシンポジウム
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 森崎 巧也, 傳田 将也, 辻 大輔, 山本 純, 猪熊 翼, 伊藤 孝司, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 SEALideを基盤とした標的タンパク質精製ツールの開発研究
3. 学会等名 第34回メディシナルケミストリーシンポジウム
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 伊藤 幸裕, 粟飯原 圭佑, Paolo Mellini, 東條 敏史, 太田 庸介, 津元 裕樹, Viswas Raja Solomon, Peng Zhan, 鈴木 美紀, 小笠原 大介, 重永 章, 猪熊 翼, 中川 秀彦, 宮田 直樹, 水上 民夫, 大高 章, 鈴木 孝禎
2. 発表標題 ヒドラジン構造を持つペプチド性LSD1阻害薬の創製
3. 学会等名 第34回メディシナルケミストリーシンポジウム
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 津田雄介、重永 章、辻 耕平、傳田将也、佐藤浩平、北風圭介、中村太寛、猪熊 翼、伊藤孝司、大高 章
2. 発表標題 タンパク質位置選択的修飾を指向したチオエステル調製法の開発
3. 学会等名 第34回メディシナルケミストリーシンポジウム
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 水口 智晴, 三河 志穂, 馬場 照彦, 島内 寿徳, 重永 章, 奥平 桂一郎, 大高 章, 斎藤 博幸
2. 発表標題 アミロイドーシス変異アポA-I Iowaの脂質膜結合状態の解析
3. 学会等名 膜シンポジウム2016
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 成瀬 公人, 江藤 三弘, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 N-Sulfanylethylcoumarinylamide (SECmide) を利用したN-Sアシル転移促進剤の探 索とペプチド合成への応用
3. 学会等名 第42回反応と合成の進歩シンポジウム
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 西田 航大, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 非天然アミノ酸含有ペプチドの新規効率的合成法の開発
3. 学会等名 第55回日本薬学会・日本薬剤師会・日本大学病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 成瀬 公人, 佐藤 浩平, 中村 太寛, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 マンノース6リン酸修飾型GM2活性化タンパク質の合成研究
3. 学会等名 第55回日本薬学会・日本薬剤師会・日本大学病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 粟飯原 圭佑, 寺中 孝久, 山岡 浩輔, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 ケミカルバイオロジー研究を指向した環状ペプチドtrichamideの合成研究
3. 学会等名 第55回日本薬学会・日本薬剤師会・日本大学病院薬剤師会中国四国支部学術大会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 瀬井 亮, 原矢 佑樹, 西辻 和親, 内村 健治, 加藤 くみ子, 重永 章, 川上 徹, 大高 章, 北條 裕信, 坂下 直実, 齋藤 博幸
2. 発表標題 Sulfated glycosaminoglycans promote cell membrane penetration of arginine peptides via enthalpy-driven interactions
3. 学会等名 第53回ペプチド討論会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 三河 志穂, 水口 智晴, 森田 いずみ, 大山 浩之, 馬場 照彦, 重永 章, 島内 寿徳, 小林 典裕, 大高 章, 齋藤 博幸
2. 発表標題 Effect of heparin on amyloid fibril formation of apoA-I fragment peptides
3. 学会等名 第53回ペプチド討論会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 伊藤 幸裕, 栗飯原 圭佑, Paolo Mellini, 東條 敏史, 太田 庸介, 津元 裕樹, Viswas Raja Solomon, Peng Zhan, 鈴木 美紀, 小笠原 大介, 重永 章, 猪熊 翼, 中川 秀彦, 宮田 直樹, 水上 民夫, 大高 章, 鈴木 孝禎
2. 発表標題 Design, synthesis and biological evaluation of SNAIL1 peptide-based lysine specific demethylase 1 inhibitors
3. 学会等名 第53回ペプチド討論会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 山岡 浩輔, 栗飯原 圭佑, 成瀬 公人, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 One-pot sequential native chemical ligations using photocaged crypto-thioester
3. 学会等名 第53回ペプチド討論会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 森崎 巧也, 傳田 将也, 山本 純, 辻 大輔, 猪熊 翼, 伊藤 孝司, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 Development of N-sulfanylethylanilide (SEALide)-based traceable linker for enrichment and selective labeling of target proteins
3. 学会等名 第53回ペプチド討論会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 寺中 孝久, 粟飯原 圭佑, 山岡 浩輔, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 Synthetic study of trichamide using Cys-free ligation
3. 学会等名 第53回ペプチド討論会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 中村 太寛, 重永 章, 成瀬 公人, 猪熊 翼, 大高 章
2. 発表標題 Tailored Synthesis of 162-Residue S-Monoglycosylated GM2-Activator Protein (GM2AP) Analogues Applicable to the Preparation of a Protein Library
3. 学会等名 第53回ペプチド討論会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 粟飯原 圭佑, 吉丸 哲郎, 小松 正人, 重永 章, 片桐 豊雅, 大高 章
2. 発表標題 Development of stapled peptides targeting BIG3-PHB2 interaction in breast cancer cells
3. 学会等名 第53回ペプチド討論会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 桑原 智希, 水野 彰, 福田 隼, 渡邊 瑞貴, 神田 敦宏, 石田 晋, 大高 章, 周東 智
2. 発表標題 Design and synthesis of the spiro-cyclopropane scaffold peptidomimetics mimicking both alpha-helix and beta-strand
3. 学会等名 第53回ペプチド討論会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 寺中 孝久, 粟飯原 圭佑, 重永 章, 猪熊 翼, 大高 章
2. 発表標題 Cys-free ligationを用いた環状ペプチドTrichamideの合成研究
3. 学会等名 第48回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 成瀬 公人, 佐藤 浩平, 中村 太寛, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 リソソーム移行型GM2活性化タンパク質の合成研究
3. 学会等名 第48回若手ペプチド夏の勉強会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 水口 智晴, 三河 志穂, 馬場 照彦, 島内 寿徳, 重永 章, 奥平 桂一郎, 大高 章, 斎藤 博幸
2. 発表標題 Iowa変異型アポA-Iによる脂質膜環境下でのアミロイド線維形成
3. 学会等名 第4回日本アミロイド シス研究会学術集会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 松浦 和則, 植村 明仁, 稲葉 央, 古曳 泰規, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 光誘起ペプチド繊維成長による走光性リボソームの創製
3. 学会等名 第26回バイオ・高分子シンポジウム
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 山岡 浩輔, 粟飯原 圭佑, 成瀬 公人, 猪熊 翼, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 光応答型チオエステル等価体を用いた多成分One-pot NCL法の開発研究
3. 学会等名 創薬懇話会2016 in 蓼科
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 寺中 孝久, 粟飯原 圭佑, 重永 章, 猪熊 翼, 大高 章
2. 発表標題 中分子創薬を指向した環状ペプチドTrichamideの合成研究
3. 学会等名 創薬懇話会2016 in 蓼科
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 頼田 和子, 黒澤 すみれ, 吉田 結理, 大高 章, 柏田 良樹, 佐野 茂樹, 南川 典昭, 福井 清
2. 発表標題 ヒトD-アミノ酸化酵素のエフェクター探索と構造活性相関
3. 学会等名 日本ビタミン学会第68回大会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 古曳 泰規, 傳田 将也, 森崎 巧也, 辻 大輔, 猪熊 翼, 伊藤 孝司, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 'SEAL-tag'を基盤とした細胞内での標的タンパク質ラベル化法の開発
3. 学会等名 日本ケミカルバイオロジー学会第11回年会
4. 発表年 2016年

1. 発表者名 森崎 巧也, 傳田 将也, 辻 大輔, 山本 純, 猪熊 翼, 伊藤 孝司, 重永 章, 大高 章
2. 発表標題 標的タンパク質精製ツール"SEAlide-based traceable linker"の開発
3. 学会等名 日本ケミカルバイオロジー学会第11回年会
4. 発表年 2016年

〔図書〕 計2件

1. 著者名 大高 章、重永 章	4. 発行年 2017年
2. 出版社 株式会社 シーエムシー出版	5. 総ページ数 315
3. 書名 医療・診断をささえるペプチド科学 再生医療・DDS・診断への応用 第1編 第2章	

1. 著者名 大高 章、鳴海 哲夫	4. 発行年 2017年
2. 出版社 株式会社 技術情報協会	5. 総ページ数 557
3. 書名 ペプチド医薬品のスクリーニング・安定化・製剤化技術 第3章 第3節 ペプチドの不安定性を解決するペプチド結合の置換技術	

〔産業財産権〕

〔その他〕

-

6. 研究組織

	氏名 (ローマ字氏名) (研究者番号)	所属研究機関・部局・職 (機関番号)	備考
研究分担者	伊藤 孝司 (ITOU Kouji) (00184656)	徳島大学・大学院医歯薬学研究部(薬学域)・教授 (16101)	
研究分担者	真板 宣夫 (MAITA Nobuo) (00404046)	徳島大学・先端酵素学研究所(次世代)・准教授 (16101)	
研究分担者	広川 貴次 (HIROKAWA Takatsugu) (20357867)	国立研究開発法人産業技術総合研究所・生命工学領域・研究 チーム長 (82626)	
研究分担者	原 孝彦 (HARA Takahiko) (80280949)	公益財団法人東京都医学総合研究所・生体分子先端研究分 野・分野長 (82609)	