

## 科学研究費助成事業（科学研究費補助金）研究成果報告書

平成25年 5月31日現在

機関番号：3 1 3 0 5

研究種目：基盤研究(B)

研究期間：2008～2012

課題番号：2 0 3 9 0 0 3 5

研究課題名（和文）新規立体的疎水性構造の活用による受容体機能制御とその創薬への応用

研究課題名（英文）Development of Receptor Regulators Utilizing Novel Hydrophobic Structure and Its Application for Medicinal Drug Design

## 研究代表者

遠藤 泰之 (ENDO YASUYUKI)

東北薬科大学・薬学部・教授

研究者番号：80126002

研究成果の概要（和文）：エストロゲン受容体、アンドロゲン受容体は性機能の調節だけではなく、骨組織、神経系等への機能ももつ。これらの作用を分離した組織選択的リガンドの創製には、受容体リガンド結合の下流の構造変化を考えた新たな骨格をもつ化合物の設計が必要である。本研究では、新しい疎水性構造を用いた受容体リガンドの設計、合成により、骨に選択的な骨粗しょう症治療薬、変異アンドロゲン受容体にも有効な前立腺がん治療薬のリードとなる化合物を見出した。

研究成果の概要（英文）：Estrogen receptor and androgen receptor participate sexual function as well as bone maintenance and nervous system. Creation of tissue selective ligands, which separate these functions, requires drug design in consideration of conformational change of receptor-ligand complex. In this project, we focused design and synthesis of new estrogen receptor ligands and androgen receptor ligands utilizing a new hydrophobic structure for the design. We have developed lead compounds for anti-osteoporosis agent and anti-prostate cancer agent which anti-androgen withdrawal syndrome.

## 交付決定額

（金額単位：円）

	直接経費	間接経費	合計
2008年度	4,400,000	1,320,000	5,720,000
2009年度	3,200,000	960,000	4,160,000
2010年度	2,300,000	690,000	2,990,000
2011年度	2,300,000	690,000	2,990,000
2012年度	2,500,000	750,000	3,250,000
総計	14,700,000	4,410,000	19,110,000

研究分野：医歯薬学

科研費の分科・細目：薬学・創薬化学

キーワード：医薬品化学

1. 研究開始当初の背景  
 医薬が生体内の受容体、酵素という分子標的との相互作用という分子レベルで評価されること

が当然となり、今後の医薬開発のためには、リード化合物探索に当たっても、受容体構造に立脚した大胆な論理的アプローチが必要となる。本研究者は医薬分子設計の基礎とな

る生理活性化合物の立体的疎水性構造単位に着目した。疎水性構造単位は分子全体を支持する骨格構造であるとともに、膜透過性や受容体との疎水性相互作用に関与し、受容体との結合親和性に大きな効果を発揮する。しかし、現代の合成医薬の多くは、芳香族あるいは複素芳香族骨格の組合せにより立体構造や水素結合性基の配置を巧みに制御することにより展開しており、立体的な疎水性骨格を積極的に利用した例は少ない。薬物と受容体との疎水性相互作用による形状認識の観点から考えると、適度な分子サイズをもった三次元的疎水性構造単位は医薬分子の設計に極めて有望な素材である。本研究者は上記の観点から、医薬分子設計における新規素材：ジカルバ-*closo*-ドデカボラン（カルボラン）に着目し、本骨格を受容体に認識される部分構造として用いた初の分子設計と合成を展開してきた。一方で、核内受容体、エストロゲン受容体、アンドロゲン受容体はそれぞれ、乳がん、前立腺がん等のホルモン依存性がんに関連する受容体であり、その拮抗薬が抗がん薬として用いられているが、他組織との作用の分離不十分による副作用、受容体の変異による抗がん薬に対する耐性などの課題を残している。

## 2. 研究の目的

本研究では、リガンド-受容体複合体の構造化学的考察から、

(1) 受容体のアゴニスト領域の拡大による新規（部分）アゴニスト開発による組織選択的リガンドの創製

(2) 受容体の新規アンタゴニスト領域の探索による受容体変異に対抗しうる新規アンタゴニストの創製

の2つの方法論を核内受容体（エストロゲン受容体、アンドロゲン受容体、レチノイド受容体）に適用し、核内受容体制御医薬の開発を進展することを目的とした。医薬化学分野で、カルボラン骨格の立体形状と疎水性を利用して生物活性物質の部分構造として応用しようとする試みは本研究者の独創的研究であり、この方法論を広く医薬への実用化への情報提供することについても目的としている。

## 3. 研究の方法

(1) エストロゲン(ER)受容体の従来のアゴニストとの結合における Cavity には入らない直線構造を有する強力なアゴニストを見出し、受容体の His524 方向の構造変化が機能制御に利用できる可能性を見出している。その構造活性相関による解析とエストロゲン受容体の変異による耐性を克服しうる拮抗化合物の創製を行う。

(2) エストロゲン拮抗化合物の既存の機構

である helix12 の構造変化に対応する側鎖構造が骨格構造にカルボランあるいは環状炭化水素を中心疎水性構造として用いることでアゴニスト/アンタゴニスト バランスを制御する可能性を見出している。その構造活性相関による解析と組織選択的リガンドとしての活性評価を行う。

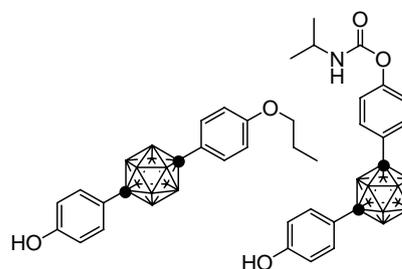
(3) アンドロゲン受容体はエストロゲン受容体よりも疎水性 Cavity が狭く、カルボラン骨格の嵩高さ自体が周辺を受容体疎水性部の構造変化を惹起し、拮抗作用が発現することが示唆されている。中心疎水性構造の球状炭化水素構造への変換等の構造活性相関により、アンドロゲン受容体のアゴニスト-アンタゴニスト作用の制御に寄与する化合物を創製する。これは、受容体の変異による耐性を克服しうる拮抗化合物の創製に繋がる。

(4) 本研究者が見出した立体的疎水性構造を中核とした ER リガンド及び AR リガンドの見知から ER アゴニストかつ AR アンタゴニストであるリガンドを見出している。この ER-AR デュアルモデュレーターはこれまでにない前立腺がん治療薬となる可能性があり、その構造活性相関を行う。

## 4. 研究成果

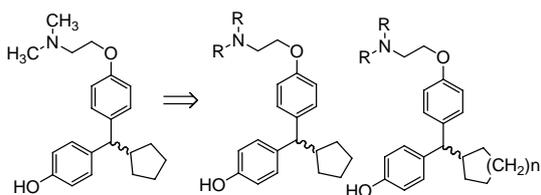
研究の方法のそれぞれに従って、研究を進め、以下の成果を得た。

(1) 受容体の従来のアゴニストとの結合における Cavity には入らない直線構造を有する *m*-, *p*-カルボランを骨格とする ER リガンドの構造活性相関を行い、*p*-カルボランを骨格とする ER アゴニストの構造活性相関から、*p*-カルボランビスフェノールモノアルキルエーテル類に ER アゴニスト活性を見出した。また、*m*-カルボランビスフェノールの側鎖をジアルキルアミノエチル基からアルキルカルバモイル基に換えることにより、受容体への結合親和性が強くなり、アンタゴニストからアゴニストへ活性が転換することを見出した。

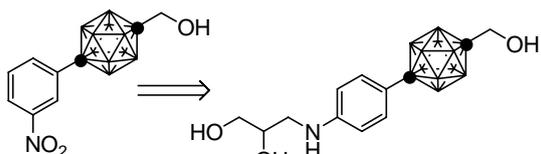


(2) 中心疎水性骨格の変換によるエストロゲン受容体リガンドのアゴニスト/アンタゴニスト バランスの制御を目的として、シクロペンチルジフェニルメタン骨格化合物に

側鎖アミノ基を導入した化合物の光学分割法の開発と構造活性相関研究を行い、新規エストロゲン受容体アンタゴニストを得た。また、側鎖アミノ基の構造変換、シクロペンチル基の他アルキル基への変換により、アンタゴニスト活性と受容体構造との作用様式を明らかにした。新規エストロゲン受容体アンタゴニスト候補として、ピロール環含有ビスフェノールを設計した。本化合物は、市販の試薬から短行程で合成することができ、これらの化合物が単純な構造ながら、強いエストロゲンアンタゴニスト活性を見出した。組織選択的及びエストロゲン受容体の $\alpha$ 、 $\beta$ サブタイプ選択的リガンドの創製を目指して、受容体のリガンド結合領域での相互作用を考慮した、フッ素置換基をもつ $\sigma$ -カルボランビスフェノールを設計した。しかし、その合成にはカルボラン環への選択的なフッ素化反応の適用が必要であり、合成法の検討により、誘導体合成に成功した。このフッ素化誘導体はMCF-7細胞を用いた増殖試験において、パーシャルアンタゴニスト活性を示すことを明らかにした。



(3) アンドロゲン受容体-アンタゴニスト複合体の結晶構造に基づき、カルボラン含有アンドロゲン受容体アンタゴニスト BA321 の構造をリードとして、ジフェニル  $m$ -カルボラン構造を用いて、形状的に再現し適切な親水性基を配置した化合物を合成し、新規 AR アンタゴニストを得た。 $p$ -カルボランを疎水性構造とするアンドロゲン受容体アンタゴニストの抗がん薬としての可能性を生物活性試験により評価した。アリールカルボラン誘導体である BA321, BA341 は強力な活性を有するが、抗がん薬抵抗性の変異細胞での効果は既存のフルタミド同様、低下していた。そこで、アンドロゲン受容体アンタゴニストであるビカルタミドの X 結晶構造解析の情報に基づき、受容体との水素結合に関与している水分子の構造要因を分子内に含



むカルボラン含有アンドロゲンアンタゴニストの設計と合成を行った。これらの化合物は変異 AR をもつ LNCaP 細胞にも有効性を示し、効果的な治療薬となる可能性を示した。

(4) 本研究者が見出した立体的疎水性構造を中核としたビアリール- $m$ -カルボランで得られた知見に基づき、AR アンタゴニスト活性に必要なニトロ基と ER アゴニスト活性に必要なヒドロキシ基を有する化合物を設計、合成し、前立腺がん治療に有効な、この両活性を併せもつ化合物を見出した。



上記の研究に関連する受容体リガンド、及び新規疎水性構造の物理化学的特性を明らかにし、それらを受容体リガンド設計に活かすために以下の研究も行い、成果を得た。

同じ核内受容体スーパーファミリーの一つであるビタミン D 受容体 (VDR) アゴニストとして、 $p$ -カルボランを疎水性構造として有する化合物の設計・合成及び活性評価を行った。合成した化合物はビタミン D と同様の活性を示し、カルボラン構造が VDR に対して有効な疎水性ファーマコフォアであることを見出した。

カルボラン類の受容体との疎水性相互作用の根源を探求するため、カルボランを有するホスト化合物の設計、合成を行い、結晶構造中、溶媒を分子内孔に取り込んだ分子の構造解析に成功した。

今後益々重要となる受容体構造に立脚した論理的な医薬分子設計には、受容体とリガンドとの結合の下流の構造変化と、それによる機能制御に関する考察が必要である。本研究は医薬分子設計における新規疎水性構造とその方法論を提供するとともに、有用な医薬の創製という面においても寄与するものと考えている。

## 5. 主な発表論文等

(研究代表者、研究分担者及び連携研究者には下線)

[雑誌論文] (計 28 件)

1. Facile Synthesis and Estrogenic Activity of Arylpyrrole-based Bisphenol Derivatives

Kiminori Ohta, Fumi Taguchi, Yasuyuki Endo  
*Heterocycles* **2012**, 86, 165-170 査読有

DOI: 10.3987/COM-12-S(N)56

2. Estrogenic Activity of B-Fluorinated o-Carborane-1,2-bisphenol Synthesized via SNAr Reaction

- Kiminori Ohta, Takumi Ogawa, Yasuyuki Endo  
*Bioorg. Med. Chem.*, **2012**, *22*, 4728-4730 査読有  
DOI: 10.1016/j.bmcl.2012.05.068
3. Development of Androgen Receptor Ligands by Application of Ten-vertex p-Carborane as a Novel Hydrophobic Core Structure  
Shinya Fujii, Kiminori Ohta, Tokuhito Goto, Akifumi Oda, Hiroyuki Masuno, Yasuyuki Endo, Hiroyuki Kagechika  
*Med. Chem. Commun.*, **2012**, *3*, 680-684 査読有  
DOI: 10.1039/c2md00294a
4. Boron Cluster-based Development of Potent Non-Secosteroidal Vitamin D Receptor Ligands: Direct Observation of Hydrophobic Interaction between Protein Surface and Carborane  
Shinya Fujii, Hiroyuki Masuno, Yoshiyuki Taoda, Atsushi Kano, Angsuma Wongmayura, Makoto Nakabayashi, Nobutoshi Ito, Masato Shimizu, Emiko Kawachi, Tomoya Hirano, Yasuyuki Endo, Aya Tanatani, Hiroyuki Kagechika  
*J. Am. Chem. Soc.* **2011**, *133*, 20933-20941 査読有  
DOI: 10.1021/ja208797n
5. RXR-gamma is Implicated in Docosahexaenoic Acid Modulation of Despair Behaviors and Working Memory in Mice  
Marta Wietrzych-Schindler, Monika Szyszka-Niagolov, Kiminori Ohta, Yasuyuki Endo, Efrén Pérez, Angel R. de Lera, Pierre Chambon, Wojciech Krezel  
*Biological Psychiatry*, **2011**, *69*, 788-794 査読有  
DOI: 10.1016/j.biopsych.2010.12.017
6. Crystal Structure, Docking Study and Structure-activity Relationship of Carborane-containing Androgen  
Kiminori Ohta, Tokuhito Goto, Synya Fujii, Masatoshi Kawahata, Akifumi Oda, Shigeru Ohta, Kentaro Yamaguchi, Shuichi Hirono, Yasuyuki Endo  
*Bioorg. Med. Chem.*, **2011**, *19*, 3540-3548 査読有  
DOI: 10.1016/j.bmc.2011.04.017
7. p-Carborane Based Androgen Antagonists Active in LNCaP Cells with a Mutated Androgen Receptor  
Shinya Fujii, Ayumi Yamada, Keiko Tomita, Mao Nagano, Tokuhito Goto, Kiminori Ohta, Takashi Harayama, Yasuyuki Endo, Hiroyuki Kagechika  
*Med. Chem. Commun.*, **2011**, *2*, 877-880 査読有  
DOI: 10.1039/c1md00001b
8. Design and Synthesis of Potent Androgen Receptor (AR) Antagonists Bearing a p-Carborane Cage: Promising Ligand for Antiandrogen Withdrawal Syndrome.  
Tokuhito Goto, Kiminori Ohta, Shinya Fujii, Tomoharu Suzuki, Shigeru Ohta, Yasuyuki Endo  
*J. Med. Chem.* **2010**, *53*, 4917-4926 査読有  
DOI: 10.1021/jm100316f
9. Synthesis of 3-Aryl-1,2-dicarba-closo-dodecaboranes by Suzuki-Miyaura Coupling Reaction  
Koei Aizawa, Kiminori Ohta, Yasuyuki Endo  
*Heterocycles*, **2010**, *80*, 369-377 査読有  
DOI: 10.3987/COM-09-S(S)32
10. Conformational Control of Benzyl-o-carboranylbenzene Derivatives and Molecular Encapsulation of Acetone into the Dynamically-formed Space of 1,3,5-Tris(2-benzyl-o-carboran-1-yl)benzene  
Chermkiat Songkram, Kiminori Ohta, Kentaro Yamaguchi, Fabio Pichierri, Yasuyuki Endo  
*Inorg. Chem.*, **2010**, *49*, 11174-11183 査読有  
DOI: 10.1021/ic101862n
11. A novel carborane analog, BE360, with a carbon-containing polyhedral boron-cluster is a new selective estrogen receptor modulator for bone  
Michiko Hirata, Masaki Inada, Chiho Matsumoto, Morichika Takita, Takumi Ogawa, Yasuyuki Endo, Chisato Miyaura  
*Biochem. Biophys. Res. Commun.* **2009**, *380*, 218-222 査読有  
DOI: 10.1016/j.bbrc.2009.01.03
12. Novel estrogen receptor (ER) modulators: Carbamate and thiocarbamate derivatives with m-carborane bisphenol structure  
Kiminori Ohta, Takumi Ogawa, Tomoharu Suzuki, Shigeru Ohta, Yasuyuki Endo  
*Bioorg. Med. Chem.*, **2009**, *17*, 7958-7963 査読有  
DOI: 10.1016/j.bmc.2009.10.018
13. Synthesis and biological evaluation of p-carborane bisphenols and their derivatives: Structure-activity relationship for estrogenic activity  
Takumi Ogawa, Kiminori Ohta, Toru Iijima, Tomoharu Suzuki, Shigeru Ohta, Yasuyuki Endo  
*Bioorg. Med. Chem.*, **2009**, *17*, 1109-1117 査読有  
DOI: 10.1016/j.bmc.2008.12.044
14. Acidic heterocycles as novel hydrophilic pharmacophore of androgen receptor ligands with a carborane core structure  
Shinya Fujii, Kiminori Ohta, Tokuhito Goto, Hiroyuki Kagechika, Yasuyuki Endo  
*Bioorg. Med. Chem.*, **2009**, *17*, 344-350 査読有  
DOI: 10.1016/j.bmc.2008.10.060
15. Magnesium-assisted intramolecular demethylation utilizing carborane C-H geometry  
Kiminori Ohta, Hiroto Yamazaki, U  
*J. Organomet. Chem.* **2009**, *694*, 1646-1651 査読有  
DOI: 10.1016/j.jorganchem.2008.11.044
16. Design and synthesis of carborane-containing

androgen receptor (AR) antagonist bearing a pyridine ring

Kiminori Ohta, Tokuhito Goto, Sinya Fujii, Tomoharu Suzuki, Shigeru Ohta, Yasuyuki Endo  
*Bioorg. Med. Chem.* **2008**, *16*, 8022-8028 査読有  
DOI: 10.1016/j.bmc.2008.07.055

17. Promising core structure for nuclear receptor ligands: Design and synthesis of novel estrogen receptor ligands based on diphenylamine skeleton

Kiminori Ohta, Yuki Chiba, Takumi Ogawa, Yasuyuki Endo

*Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2008**, *18*, 5050-5053 査読有

DOI: 10.1016/j.bmcl.2008.08.004

18. Complexation of  $\beta$ -cyclodextrin with carborane derivatives in aqueous solution

Kiminori Ohta, Shunsuke Konno, Yasuyuki Endo  
*Tetrahedron Lett.*, **2008**, *49*, 6525-6528 査読有

DOI: 10.1016/j.tetlet.2008.08.107

19. Identification of an intermediate in the deboronation of ortho-carborane: an adduct of ortho-carborane with two nucleophiles on one boron atom

Yoshiyuki Taoda, Takehiko Sawabe, Yasuyuki Endo, Kentaro Yamaguchi, Shinya Fujii, Hiroyuki Kagechika

*Chem. Commun.*, **2008**, 2049-2051 査読有

DOI: 10.1039/b716079h

[学会発表] (計 72 件)

1. 2-メトキシエストラジオールをリード化合物とした新規疎水性骨格を有するチューブリン重合阻害剤の開発

皆瀬麻子、太田公規、遠藤泰之、日本薬学会第 133 年会、横浜、2013 年 3 月

2. カルボラン化合物 BA321 の新規選択的アンドロゲン受容体モジュレーターとしての作用

上部 良輔, 松本 千穂, 富成司, 稲田 全規, 遠藤 泰之, 宮浦 千里, 第 85 回日本生化学会大会、福岡、2012 年 12 月

3. 新規キサントニンオキシダーゼ (XO) 阻害剤の探索

太田公規、小川真澄、伊藤将、遠藤泰之、第 30 回メディシナルケミストリーシンポジウム、東京、2012 年 11 月

4. エストロゲン代謝物を基にデザインした新規カルボラン含有チューブリン重合阻害剤

皆瀬麻子、太田公規、遠藤泰之、第 30 回メディシナルケミストリーシンポジウム、東京、2012 年 11 月

5. エストロゲン活性を有するジフェニルメタン誘導体の疎水性構造活性相関

佐藤学、北尾聡一郎、太田公規、遠藤泰之  
日本薬学会第 132 年会、札幌、2012 年 3 月

6. 変異アンドロゲン受容体 (AR) にも有効な新規カルボラン含有 AR アンタゴニストの創製

皆瀬麻子、後藤徳仁、藤井晋也、太田公規、遠藤泰之

日本薬学会第 132 年会、札幌、2012 年 3 月

7. Design and Synthesis of Estrogen Receptor Modulators: Controlling of the Agonist/Antagonist Balance in m-Carborane Bisphenol Derivatives

Kiminori Ohta, Takumi Ogawa, Shigeru Ohta, Yasuyuki Endo

AIMECS11, Tokyo, Japan, Nov, 2011

8. Design and Synthesis of Novel Carborane-containing AR Antagonists Having a Glycerol Moiety Based on the Co-crystal Structure of Bicalutamide with hAR LBD

Asako Kaise, Tokuhito Goto, Shinya Fujii, Kiminori Ohta, Yasuyuki Endo

AIMECS11, Tokyo, Japan, Nov, 2011

9. ジフェニルメタン骨格への新規疎水性部位導入による ER リガンドの創製

佐藤 学、北尾聡一郎、太田公規、遠藤泰之  
第 50 回日本薬学会東北支部大会、仙台、2011 年 10 月

10. Design and Synthesis of Diphenylamine-based Novel Anion Receptors Bearing o-Carborane Cages

Shuhei Takahashi, Hiroto Yamazaki, Kiminori Ohta, Yasuyuki Endo

IME Boron XIV, Niagara falls, Canada, Sep, 2011

11. Design and Synthesis of Novel AR Antagonists having a glycerol moiety

Asako Kaise, Tokuhito Goto, Shinya Fujii, Kiminori Ohta, Yasuyuki Endo

IME Boron XIV, Niagara falls, Canada, Sep, 2011

12. ベンジル-o-カルボラニルベンゼンのコンフォメーション制御とアセトン分子の包接

太田公規、Songkram Chalermkiat、Fabio Pichierri、山口健太郎、遠藤泰之

第 7 回ホスト・ゲスト化学シンポジウム、広島、2011 年 5 月

13. 新規立体的疎水性構造の活用による受容体機能制御とその創薬への応用(招待講演)

遠藤泰之  
創薬懇話会 2010 in 蔵王、2010 年 11 月

14. Application of Carboranes for Medicinal Drug Design Utilizing Their Globular Geometry and Hydrophobicity.

Yasuyuki Endo  
JSPS Japan-Spain Joint Research Project, Institut de Ciència de Materials de Barcelona (C.S.I.C.)

Campus U.A.B., Barceloan, Spain, September, 2010

15. Conformational Controls of

Benzyl-o-carboranylbenzene Derivatives and Molecular Encapsulation of Acetone

Kiminori Ohta, Chalermkiat Songkram, Masatoshi Kawahata, Kentaro Yamaguchi, Pichierra Fabio, Yasuyuki Endo

5th International Symposium on Macrocyclic & Supramolecular Chemistry, Nara, Japan, June, 2010

16. エストロゲン受容体リガンドの創製：m-カルボランビスフェノール誘導体におけるアゴニスト-アンタゴニストバランスの制御

太田 公規、小川 卓巳、太田 茂、遠藤 泰之

日本薬学会第 130 年会、岡山、2010 年 3 月

17. 変異受容体にも有効な新規アンドロゲンアンタゴニストの創製

山田 歩、富田 景子、長野 麻央、藤井 晋也、原山 尚、太田 公規、遠藤 泰之、影近 弘之

日本薬学会第 130 年会、岡山、2010 年 3 月

18. ジフェニルメタン骨格を利用したエストロゲン受容体制御化合物の探索

北尾 聡一朗、小川 卓巳、太田 公規、猪股 浩平、遠藤 泰之

日本薬学会第 130 年会、岡山、2010 年 3 月

19. ジフェニルメタン骨格を有するエストロゲン受容体リガンドの創製

北尾 聡一朗、小川 卓巳、太田 公規、猪股 浩平、遠藤 泰之

第 28 回メディシナルケミストリーシンポジウム、東京、2009 年 11 月

20. 10-vertex カルボランを用いたアンドロゲン受容体リガンドの創製

藤井 晋也、太田 公規、遠藤 泰之、影近 弘之

日本薬学会第 129 年会、京都、2009 年 3 月

21. Diarylcarborane 構造を利用したエストロゲン活性および抗アンドロゲン活性を併せ持つ化合物の創製

太田公規、後藤徳仁、小川卓巳、藤井晋也、鈴木智晴、太田茂、遠藤泰之

第 19 回日本レチノイド研究会学術集会、東京、2008 年 11 月

22. 核内受容体リガンドに対する新規 Privileged structure の探索: ジフェニルアミン骨格を用いた ER リガンドの創製

千葉由紀、小川卓巳、太田公規、遠藤泰之

第 27 回メディシナルケミストリーシンポジウム、大阪、2008 年 11 月

23. カルボラン骨格を利用したアンドロゲン受容体変異に対しても有効な拮抗剤の創製

太田公規、後藤徳仁、藤井晋也、鈴木智晴、太田茂、遠藤泰之

第 27 回メディシナルケミストリーシンポジウム、大阪、2008 年 11 月

24. Utility of boron cluster for drug design:

Design of androgen receptor/ estrogen receptor dual ligands bearing carborane for anti-prostate cancer drug

Yasuyuki Endo, Tokuhiro Goto, Kiminori Ohta, Shinya Fujii, Hiroyuki Kagechika

13th International Conference on Boron Chemistry, Platja d' Aro, Spain, September, 2008

25. Androgen receptor antagonists based on boron cluster as a hydrophobic core structure

Shinya Fujii, Kiminori Ohta, Tokuhiro Goto, Tomoharu Suzuki, Shigeru Ohta, Yuichi Hashimoto, Hiroyuki Kagechika, Yasuyuki Endo,

13th International Conference on Boron Chemistry, Platja d' Aro, Spain, September, 2008

26. Design and Synthesis of halogenated carboranylphenols as estrogen receptor b selective ligands.

Takumi Ogawa, Kiminori Ohta, Motoshi Miyazawa, Yasuyuki Endo,

13th International Conference on Boron Chemistry, Platja d' Aro, Spain, September, 2008

[その他]

ホームページ等

<http://www.tohoku-pharm.ac.jp/laboratory/soyaku/english0.html>

## 6. 研究組織

### (1)研究代表者

遠藤 泰之 (ENDO YASUYUKI)

東北薬科大学・薬学部・教授

研究者番号：80126002

### (2)研究分担者

猪股 浩平 (INOMATA KOHEI)

東北薬科大学・薬学部・准教授

研究者番号：60221785

太田 公規 (OHTA KIMINORI)

東北薬科大学・薬学部・講師

研究者番号：90347906

### (3)連携研究者

影近 弘之 (KAGECHIKA HIROYUKI)

東京医科歯科大学・疾患生命科学研究部・教授

研究者番号：20177348

藤井 晋也 (FUJII SHINYA)

東京医科歯科大学・疾患生命科学研究部・助教

研究者番号：60389179

ピキエリ ファビオ (PICHIERRI FABIO)

東北大学・工学研究科・COE フェロー

研究者番号：40374920