

令和 6 年 5 月 25 日現在

機関番号：32643

研究種目：基盤研究(C)（一般）

研究期間：2018～2023

課題番号：18K06556

研究課題名（和文）ビタミンD受容体リガンドの長寿命化：代謝抵抗性獲得と不活性化酵素選択的阻害剤の開発

研究課題名（英文）Elongation of half-life time of vitamin D receptor ligands: acquisition of metabolic resistance and development of selective inhibitors against inactivation enzyme of vitamin D

研究代表者

橘高 敦史 (Kittaka, Atsushi)

帝京大学・薬学部・教授

研究者番号：00214833

交付決定額（研究期間全体）：（直接経費） 3,400,000円

研究成果の概要（和文）：ビタミンD3の特異的な不活性化酵素CYP24A1に対する代謝抵抗性獲得の観点から、当該酵素の反応点である側鎖部22位から末端26,27位にフッ素原子を導入し、フッ素原子の位置、数および立体化学がCYP24A1代謝抵抗性に与える影響と、活性発現に重要な特異的核内受容体（VDR）への結合親和性に与える影響について調べた。本研究課題期間中に、CD環の側鎖23位から末端26,27位にフッ素を効率的に導入する合成法を開発し、25-水酸化ビタミンD誘導体合成に成功し、基本的生物活性とあわせて学術誌に報告した。また、CYP24A1と同じ代謝能をもつCYP105A1への新たな阻害剤を取得した。

研究成果の学術的意義や社会的意義

活性型ビタミンD3には骨粗鬆症、乾癬、二次性副甲状腺機能亢進症などの治療薬として臨床適用されている。側鎖末端をフッ素化した医薬品には日本で開発されたファレカルシトリオールが知られているが、側鎖の中央部分をフッ素化したビタミンD誘導体の生理活性について、系統的な薬理効果は知られていない。当研究課題ではまずこの課題を克服すべく側鎖を系統的にフッ素化し、様々なA環部とカップリングできるCD環原料を開発した。これを用いて系統的に側鎖フッ素化25-水酸化ビタミンD誘導体を合成し、フッ素を導入した位置、数、立体化学による生物活性への影響をまとめ、医薬品設計への重要な知見を明らかにした。

研究成果の概要（英文）：From the viewpoint of acquiring metabolic resistance to the specific inactivating enzyme CYP24A1 of vitamin D3, fluorine atoms were introduced from the C22-position of the side chain to the terminal C26,27-positions of vitamin D3. We investigated the effects of the position, number, and stereochemistry of the fluorine atom on CYP24A1 metabolic resistance and binding affinity to specific nuclear receptors (VDRs), which are important for expression of activity. During the period of this research project, we developed synthetic methods to efficiently introduce fluorine from the C23-position of the side chain of the CD ring to the terminal C26,27-positions, succeeded in synthesizing fluorinated 25-hydroxyvitamin D derivatives, and studied basic biological activity. The results were reported in academic journals. We also obtained a new inhibitor of CYP105A1, which shows the similar metabolic ability to CYP24A1.

研究分野：薬化学

キーワード：ビタミンD フッ素原子導入 ビタミンD受容体 CYP24A1 オステオカルシン転写活性 代謝抵抗性

## 様式 C-19、F-19-1、Z-19 (共通)

### 1. 研究開始当初の背景

(1) 活性型ビタミン D<sub>3</sub> [1 $\alpha$ ,25(OH)<sub>2</sub>D<sub>3</sub>] は、核内受容体の一つであるビタミン D レセプター (VDR) と特異的に結合し、標的遺伝子の転写を制御することで血中カルシウムやリンの恒常性を維持し、骨の育成をつかさどり、かつ、ケラチノサイトなどの標的細胞の分化・増殖を制御する脂溶性シグナル分子である。がん (前立腺、乳、大腸、血液、皮膚) 心血管系疾患、免疫系疾患、皮膚疾患、糖尿病、高血圧症、炎症、また筋力維持などとビタミン D との関わりが研究され、生命現象と健康維持に深く関わる内因性分子である。また、活性型ビタミン D<sub>3</sub> の作用により骨芽細胞で生産される骨基質タンパク質オステオカルシンは、多機能ホルモンとして注目され、糖脂質代謝調節、性ホルモン生産分泌および中枢神経系での記憶や学習能力への関与などが報告され、活性型ビタミン D<sub>3</sub> の働きによる骨組織を介するオステオカルシン作用についても健康維持に極めて重要であることが分かってきた。骨形成作用に関する我々の基礎研究では、活性型ビタミン D<sub>3</sub> に一連の 2 $\alpha$ -アゾールエチル基を導入して調べた結果、2 $\alpha$ -[2-(tetrazol-2-yl)ethyl]-1 $\alpha$ ,25-dihydroxy-vitamin D<sub>3</sub> (AH-1) が、活性型ビタミン D<sub>3</sub> の 4.3 倍のオステオカルシン転写活性があり、骨粗鬆症モデル (卵巣摘出 OVX) ラットを用いた *in vivo* 評価で、ビタミン D 製剤に認められる高カルシウム血症をとまわずに、0.02  $\mu$ g/kg/day という極低濃度の投与量で顕著な骨密度の改善と治療効果を確認した (Matsuo, Kittaka ら *ACS Med. Chem. Lett.* **2013**)。また、活性型ビタミン D<sub>3</sub> は細胞増殖抑制や細胞分化誘導作用が強く、制がん作用の研究が国内外で盛んであり、我々の開発したビタミン D 誘導体「MART-10」は、各種腫瘍細胞に対する増殖抑制効果が極めて高く、*in vivo* 研究ではヒト膵臓がんの担がんマウスで 0.3  $\mu$ g/kg 週 2 回 3 週間投与という極低用量で、体重低下や高カルシウム血症の副作用もなく、顕著な治療効果を収めている (Chiang, Kittaka ら *Cell Cycle* **2013**; Chen, Kittaka, and Norstedt *International Innovation* **2014**; Chen, Sakaki, and Kittaka *Adjacent Government* **2015**)。MART-10 と AH-1 は、VDR と結合時に 1 $\alpha$ -水酸基と 2 $\alpha$ -置換基上の水酸基あるいはテトラゾール環窒素原子を用いて VDR の Arg-274 とピンサー型水素結合を形成し、受容体-リガンド複合体を安定化することを X 線共結晶構造解析で明らかにした (図 1、Kittaka ら *J. Med. Chem.* **2006**, *Vitamins and Hormones* **2016**)。また、活性型ビタミン D<sub>3</sub> の不活化酵素 CYP24A1 に対して、MART-10 と AH-1 は代謝効率が約 1/25 に低下し、高い代謝抵抗性を示した。さらに AH-1 では CYP24A1 の 6 段階連続酸化反応のうち、速度の遅い 1 段階目の代謝産物が 24R-水酸化体であり、VDR を介する生物活性をなお維持することを見出した (Takano, Kittaka ら *J. Steroid Biochem. Mol. Biol.* **2017**)。MART-10 や AH-1 の更なる CYP24A1 代謝抵抗性の獲得は、生物学的半減期をより助長し、より極低用量で治療効果を発揮できるものと考えられる。

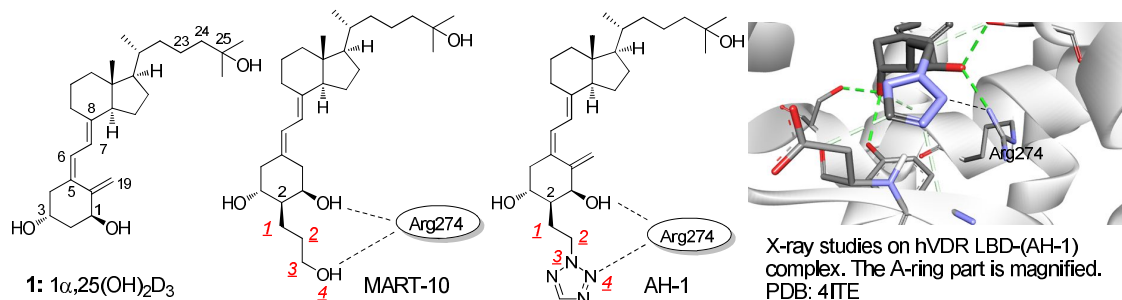


図 1 .活性型ビタミン D<sub>3</sub>、MART-10、AH-1 の構造および X 線共結晶構造解析によるヒト VDR リガンド結合領域 (LBD) に結合時の AH-1 の A 環部分拡大図 (PDB: 4ITE)

(2) これまでの P450 系代謝酵素阻害剤は、ケトコナゾール、クロトリマゾールなど、ヘム鉄に配位するアゾール環をもつが、CYP24A1 選択的な阻害剤ではない。その後 CYP24A1 選択性を高めた VID400 が報告されたが、これはビタミン D 誘導体ではない。今回、CYP24A1 選択的阻害剤の設計には、本来の基質であるビタミン D 骨格をもつことが望ましいと考え、CYP24A1 結晶構造に基づく分子モデリングの考察 (Iglesias-Gato, Kittaka ら *J. Steroid Biochem. Mol. Biol.* **2011**) から、MART-10 に一連の 2 $\alpha$ -アゾールアルキル基を導入し (Takano, Kittaka ら *Heterocycles* **2015**) 基質アゾール基のヘム鉄配位による CYP24A1 選択的阻害剤が開発できるものと考えられる。

### 2. 研究の目的

本研究課題では、次の 2 点を主眼として研究することとした。

(1) 優れた骨形成作用および優れた制がん作用を有する新規活性型ビタミン D<sub>3</sub> 誘導体をビタミン D<sub>3</sub> の特異的な不活性化酵素 CYP24A1 に対する代謝抵抗性獲得の観点からそれぞれ見出すことを目的とする。すなわち、我々が見出した骨形成作用の強い AH-1 と制がん作用の強い MART-10 の CYP24A1 酸化反応点である 23 位、24 位、26 位に段階的にフッ素原子を導入し、酸化的

代謝を防止する。また、これまでに得た知見を活かし、代謝産物においても有効な生物活性を維持する活性物質の合成を行う。

(2) CYP24A1 選択的阻害剤を設計・合成する。CYP24A1 選択的阻害剤は、体内の活性型ビタミン D<sub>3</sub> やビタミン D 医薬品の生物学的半減期を延長すると考えられる。CYP24A1 の X 線結晶構造解析に基づき、基質となるビタミン D<sub>3</sub> 骨格にアゾール構造を導入してヘム鉄に配位させ、酸素の還元的活性化を阻止する選択的 CYP24A1 阻害剤を取得する。

### 3. 研究の方法

(1) MART-10 と AH-1 の CYP24A1 酸化反応点である 23 位、24 位、26 位に段階的にフッ素原子を効率よく導入し、生物学的半減期を大幅に延ばした MART-10-Fs および AH-1-Fs を開発した。それぞれの母核 (MART-10 と AH-1) がこれまでの *in vivo* 試験で高カルシウム血症を惹起しないので、副作用のない新規誘導体の取得が可能と考えられた。また、CYP24A1 の選択的阻害で活性型ビタミン D<sub>3</sub> やビタミン D 医薬品の生物学的半減期の増長が実現すると、薬物投与量の削減が可能となり、さらにはビタミン D 骨格を有する阻害剤自体が VDR のアゴニスト活性を示す可能性もあり、新機軸の骨粗鬆症治療薬や制がん剤になると考えられた。すなわち、我々は A 環 2 $\alpha$  方向への置換基の導入が、ビタミン D<sub>3</sub> 骨格に CYP24A1 代謝抵抗性を付与することを見出したので、さらなる抵抗性獲得のために側鎖 23, 24, 26 位に順次フッ素原子を導入した VDR の新規リガンドを構築することとした (図 2)。

23 位フルオロ化は、23-OH 体の DAST によるフッ素化を検討した。23-OH 体合成が立体化学を含めすでに完了しており、これを活用した (図 3)。

23-オキソ体から 23, 23-ジフルオロ体合成を検討した。

24 位ジフルオロ化は、既知法を改善し、CD 環側鎖 23 位アルデヒドへの Reformatsky 反応で構築することを計画した (図 3)。

26, 27 位両メチル基のトリフルオロメチル化は、医薬品としてファレカルシトリオールが上市されているが、我々は新規改良法として側鎖メチルエステルに対する CF<sub>3</sub>TMS による二段階トリフルオロメチル化反応 (Wiedemann ら *Angew. Chem. Int. Ed.* 1998) を利用して合成することとした。

合成 CD 環は、8 位プロモオレフィンあるいは二炭素増炭スルホン化し、我々独自の A 環前駆体とカップリングすることとした。

(2) MART-10 に一連の 2 $\alpha$ -アゾールアルキル基を導入し、アゾール基のヘム鉄配位による CYP24A1 選択的阻害剤を開発することとした (図 2)。

#### I. CYP24A1 抵抗性リガンドの創製

#### II. CYP24A1 選択的阻害剤の創製

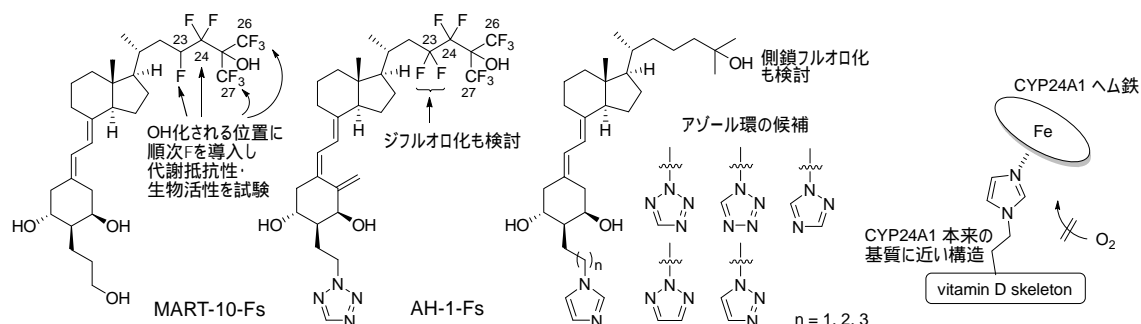


図 2 . CYP24A1 抵抗性リガンドと CYP24A1 阻害剤の分子設計

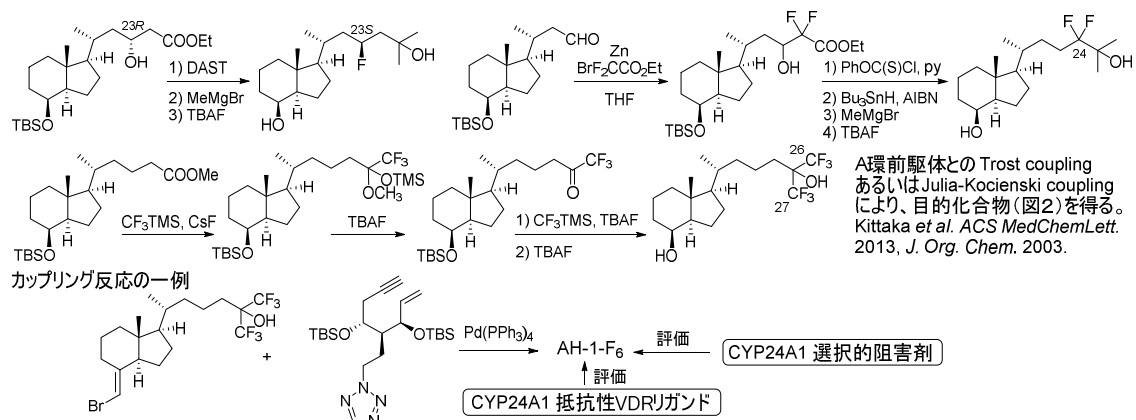


図 3 . MART-10-Fs および AH-1-Fs の CD 環部合成と A 環前駆体とのカップリングの一例

(3) 新規ビタミン D 誘導体について、富山県立大学工学部・神教授の研究グループと VDR 結合親和性および CYP24A1 代謝酵素抵抗性を共同研究で評価した。さらに、VDR を介するオステオカルシン転写活性を企業との共同研究で調べた。



## 図 6 . 26,27 位のフルオロ化合成経路と VDR 結合親和性、転写活性、代謝抵抗性

図 6 に一部示したように、それぞれの位置をフッ素化した一連の 25-水酸化ビタミン D 誘導体が合成でき、VDR 結合親和性、オステオカルシン転写活性、CYP24A1 代謝抵抗性をすべて調べることができた。生物活性の詳細をすべて英文学術誌として論文化し、「5 . 主な発表論文等」の項に示した。

(2) 代謝酵素への代謝抵抗性は、前段階としてビタミン D に対して CYP24A1 と同様の水酸化機能を有する CYP105A1 の単離に富山県立大学工学部榊教授の研究グループが成功し、今回我々が合成したアゾール系ビタミン D 誘導体で CYP105A1 に対する 阻害活性評価ができた。実際、阻害活性を有するビタミン D 誘導体を取得できた（未発表）。タンパク質単離という観点から難易度の高い CYP24A1 に対しても引き続き検討を続ける必要がある。一方で、CYP105A1 に対するアゾール系ビタミン D 誘導体の阻害活性を認めたので、今後の代謝阻害剤設計の研究がしやすくなったと考えられる。

5. 主な発表論文等

〔雑誌論文〕 計39件（うち査読付論文 36件 / うち国際共著 3件 / うちオープンアクセス 11件）

1. 著者名 Takada Kazunari, Hagiwara Yukino, Togashi Moeka, Kittaka Atsushi, Kawagoe Fumihiro, Uesugi Motonari, Nishimoto-Kusunose Shoichi, Higashi Tatsuya	4. 巻 223
2. 論文標題 23,25-Dihydroxyvitamin D3 is liberated as a major vitamin D3 metabolite in human urine after treatment with $\beta$ -glucuronidase: Quantitative comparison with 24,25-dihydroxyvitamin D3 by LC/MS/MS	5. 発行年 2022年
3. 雑誌名 The Journal of Steroid Biochemistry and Molecular Biology	6. 最初と最後の頁 106133 ~ 106133
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.jsbmb.2022.106133	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 Nishikawa Miyu, Murose Naruhiro, Mano Hiroki, Yasuda Kaori, Isogai Yasuhiro, Kittaka Atsushi, Takano Masashi, Ikushiro Shinichi, Sakaki Toshiyuki	4. 巻 12
2. 論文標題 Robust osteogenic efficacy of 2 $\beta$ -heteroarylalkyl vitamin D analogue AH-1 in VDR (R270L) hereditary vitamin D-dependent rickets model rats	5. 発行年 2022年
3. 雑誌名 Scientific Reports	6. 最初と最後の頁 12517
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1038/s41598-022-16819-7	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 Mototani Sayuri, Kawagoe Fumihiro, Yasuda Kaori, Mano Hiroki, Sakaki Toshiyuki, Kittaka Atsushi	4. 巻 27
2. 論文標題 The First Convergent Synthesis of 23,23-Difluoro-25-hydroxyvitamin D3 and Its 24-Hydroxy Derivatives: Preliminary Assessment of Biological Activities	5. 発行年 2022年
3. 雑誌名 Molecules	6. 最初と最後の頁 5352 ~ 5352
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3390/molecules27165352	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 川越文裕、橋高敦史	4. 巻 96
2. 論文標題 フッ素化ビタミンD誘導体の化学	5. 発行年 2022年
3. 雑誌名 ビタミン	6. 最初と最後の頁 296-304
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 川越文裕、本谷小佑里、橘高敦史	4. 巻 42
2. 論文標題 ビタミンD3側鎖の効率的フッ素化	5. 発行年 2022年
3. 雑誌名 アレルギーの臨床	6. 最初と最後の頁 390-395
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 無
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 Yasuda Kaori, Nishikawa Miyu, Okamoto Kairi, Horibe Kyohei, Mano Hiroki, Yamaguchi Mana, Okon Risa, Nakagawa Kimie, Tsugawa Naoko, Okano Toshio, Kawagoe Fumihiro, Kittaka Atsushi, Ikushiro Shinichi, Sakaki Toshiyuki	4. 巻 296
2. 論文標題 Elucidation of metabolic pathways of 25-hydroxyvitamin D3 mediated by CYP24A1 and CYP3A using Cyp24a1 knockout rats generated by CRISPR/Cas9 system	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 Journal of Biological Chemistry	6. 最初と最後の頁 100668 ~ 100668
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.jbc.2021.100668	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 Kawagoe Fumihiro, Mendoza Aileen, Hayata Yuki, Asano Lisa, Kotake Kenjiro, Mototani Sayuri, Kawamura Satoshi, Kurosaki Shigeyuki, Akagi Yusuke, Takemoto Yasushi, Nagasawa Kazuo, Nakagawa Hayato, Uesugi Motonari, Kittaka Atsushi	4. 巻 64
2. 論文標題 Discovery of a Vitamin D Receptor-Silent Vitamin D Derivative That Impairs Sterol Regulatory Element-Binding Protein In Vivo	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 Journal of Medicinal Chemistry	6. 最初と最後の頁 5689 ~ 5709
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.jmedchem.0c02179	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 Kawagoe Fumihiro, Mototani Sayuri, Kittaka Atsushi	4. 巻 22
2. 論文標題 Design and Synthesis of Fluoro Analogues of Vitamin D	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 International Journal of Molecular Sciences	6. 最初と最後の頁 8191 ~ 8191
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3390/ijms22158191	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 Mendoza A, Takemoto Y, Cruzado K T, Masoud S S, Nagata A, Tantipanjaporn A, Okuda S, Kawagoe F, Sakamoto Ryota, Odagi Minami, Mototani Sayuri, Togashi M, Kawatani M, Aono H, Osada H, Nakagawa H, Higashi T, Kittaka A, Nagasawa K, Uesugi M	4. 巻 29
2. 論文標題 Controlled lipid -oxidation and carnitine biosynthesis by a vitamin D metabolite	5. 発行年 2022年
3. 雑誌名 Cell Chemical Biology	6. 最初と最後の頁 660 ~ 669.e12
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.chembiol.2021.08.008	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 Yasuda Kaori, Nishikawa Miyu, Mano Hiroki, Takano Masashi, Kittaka Atsushi, Ikushiro Shinichi, Sakaki Toshiyuki	4. 巻 22
2. 論文標題 Development of In Vitro and In Vivo Evaluation Systems for Vitamin D Derivatives and Their Application to Drug Discovery	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 International Journal of Molecular Sciences	6. 最初と最後の頁 11839 ~ 11839
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3390/ijms222111839	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 Kawagoe Fumihiro, Mototani Sayuri, Yasuda Kaori, Mano Hiroki, Sakaki Toshiyuki, Kittaka Atsushi	4. 巻 22
2. 論文標題 Stereoselective Synthesis of 24-Fluoro-25-Hydroxyvitamin D3 Analogues and Their Stability to hCYP24A1-Dependent Catabolism	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 International Journal of Molecular Sciences	6. 最初と最後の頁 11863 ~ 11863
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3390/ijms222111863	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 Kawagoe Fumihiro, Mototani Sayuri, Kittaka Atsushi	4. 巻 11
2. 論文標題 The Synthesis and Biological Evaluation of D-Ring-Modified Vitamin D Analogues	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 Biomolecules	6. 最初と最後の頁 1639 ~ 1639
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3390/biom11111639	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 Mizumoto Yuka, Sakamoto Ryota, Nagata Akiko, Sakane Suzuka, Kittaka Atsushi, Odagi Minami, Tera Masayuki, Nagasawa Kazuo	4. 巻 12
2. 論文標題 Synthesis of C2-Alkoxy-Substituted 19-Nor Vitamin D3 Derivatives: Stereoselectivity and Biological Activity	5. 発行年 2022年
3. 雑誌名 Biomolecules	6. 最初と最後の頁 69 ~ 69
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3390/biom12010069	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 Shun-suke Moriya, Yuki Yoneta, Keiko Kuwata, Yasutada Imamura, Yosuke Demizu, Masaaki Kurihara, Atsushi Kittaka, and Toru Sugiyama	4. 巻 5
2. 論文標題 PreQ1 Facilitates DNA Strand Invasion by PNA	5. 発行年 2022年
3. 雑誌名 Peptide Science 2021	6. 最初と最後の頁 111-112
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 川越文裕、本谷小佑里、橘高敦史	4. 巻 5
2. 論文標題 フッ素化ビタミンD3の効率的合成法	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 アグリバイオ	6. 最初と最後の頁 964-969
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 無
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 Shun-suke Moriya, Yuko Sasa, Keiko Kuwata, Yasutada Imamura, Yosuke Demizu, Masaaki Kurihara, Atsushi Kittaka, and Toru Sugiyama	4. 巻 56
2. 論文標題 An approach toward visual detection of single nucleotide polymorphism using pseudocomplementary peptide nucleic acid	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 Peptide Science 2019	6. 最初と最後の頁 173 ~ 174
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 Maruta Hiroshi, Kittaka Atsushi	4. 巻 25
2. 論文標題 Chemical evolution for taming the 'pathogenic kinase' PAK1	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 Drug Discovery Today	6. 最初と最後の頁 959 ~ 964
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.drudis.2020.03.008	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 該当する

1. 著者名 Nakamura Shunya, Saito Ryosuke, Yamamoto Shohei, Terauchi Yuta, Kittaka Atsushi, Takimoto-Kamimura Midori, Kurita Noriyuki	4. 巻 270
2. 論文標題 Proposal of novel inhibitors for vitamin-D receptor: Molecular docking, molecular mechanics and ab initio molecular orbital simulations	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 Biophysical Chemistry	6. 最初と最後の頁 106540 ~ 106540
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.bpc.2020.106540	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 Moriya Shun-suke, Shibasaki Hatsune, Kohara Misaki, Kuwata Keiko, Imamura Yasutada, Demizu Yosuke, Kurihara Masaaki, Kittaka Atsushi, Sugiyama Toru	4. 巻 39
2. 論文標題 Synthesis and characterization of PNA oligomers containing preQ1 as a positively charged guanine analogue	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters	6. 最初と最後の頁 127850 ~ 127850
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.bmcl.2021.127850	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 真野寛生、生城真一、高野真史、橘高敦史、榊 利之	4. 巻 94
2. 論文標題 VDRリガンドに応答して発光量が劇的に上昇する分割型ルシフェラーゼバイオセンサーの開発	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 ビタミン	6. 最初と最後の頁 307 ~ 313
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 丸田 浩、安井文彦、橘高敦史、小原道法	4. 巻 11号
2. 論文標題 COVID-19の食餌対策～PAKを遮断する野菜や食物成分～	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 食品と科学	6. 最初と最後の頁 59～64
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 無
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 該当する

1. 著者名 Nagata Akiko, Akagi Yusuke, Masoud Shadi Sedghi, Yamanaka Masahiro, Kittaka Atsushi, Uesugi Motonari, Odagi Minami, Nagasawa Kazuo	4. 巻 84
2. 論文標題 Stereoselective Synthesis of Four Calcitriol Lactone Diastereomers at C23 and C25	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 The Journal of Organic Chemistry	6. 最初と最後の頁 7630～7641
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.joc.9b00403	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 Kawagoe Fumihiro, Mototani Sayuri, Yasuda Kaori, Nagasawa Kazuo, Uesugi Motonari, Sakaki Toshiyuki, Kittaka Atsushi	4. 巻 195
2. 論文標題 Introduction of fluorine atoms to vitamin D3 side-chain and synthesis of 24,24-difluoro-25-hydroxyvitamin D3	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 The Journal of Steroid Biochemistry and Molecular Biology	6. 最初と最後の頁 105477～105477
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.jsbmb.2019.105477	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 Kawagoe Fumihiro, Yasuda Kaori, Mototani Sayuri, Sugiyama Toru, Uesugi Motonari, Sakaki Toshiyuki, Kittaka Atsushi	4. 巻 4
2. 論文標題 Synthesis and CYP24A1-Dependent Metabolism of 23-Fluorinated Vitamin D3 Analogues	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 ACS Omega	6. 最初と最後の頁 11332～11337
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acsomega.9b01500	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 Toru Sugiyama, Hatsune Shibasaki, Shun-suke Moriya, Keiko Kuwata, Yasutada Imamura, Yosuke Demizu, Masaaki Kurihara, and Atsushi Kittaka	4. 巻 55
2. 論文標題 PNA Oligomers Possessing PreQ1 as a Cationic Analogue of Guanine	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 Peptide Science 2018	6. 最初と最後の頁 44
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 Nagata Akiko, Akagi Yusuke, Asano Lisa, Kotake Kenjiro, Kawagoe Fumihito, Mendoza Aileen, Masoud Shadi Sedghi, Usuda Kosuke, Yasui Koji, Takemoto Yasushi, Kittaka Atsushi, Nagasawa Kazuo, Uesugi Motonari	4. 巻 14
2. 論文標題 Synthetic Chemical Probes That Dissect Vitamin D Activities	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 ACS Chemical Biology	6. 最初と最後の頁 2851 ~ 2858
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acscchembio.9b00718	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 橋高敦史	4. 巻 94
2. 論文標題 ビタミンD構造異性体タキステロールと類縁体の化学	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 ビタミン	6. 最初と最後の頁 155-161
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 CHIANG KUN-CHUN, YEH CHUN-NAN, YEH TA-SEN, JUANG HORNG-HENG, CHEN LI-WEI, KUO SHENG-FONG, CHEN MING-HUANG, CHEN TAI C., TAKANO MASASHI, KITTAKA ATSUSHI, PANG JONG-HWEI S.	4. 巻 38
2. 論文標題 MART-10, a 1,25(OH)2D3 Analog, Potently Represses Metastasis of ER+ Breast Cancer Cells with VEGF-A Overexpression	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Anticancer Research	6. 最初と最後の頁 3879 ~ 3887
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.21873/anticancerres.12672	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 該当する

1. 著者名 Mano Hiroki, Takano Masashi, Ikushiro Shinichi, Kittaka Atsushi, Sakaki Toshiyuki	4. 巻 505
2. 論文標題 Novel biosensor using split-luciferase for detecting vitamin D receptor ligands based on the interaction between vitamin D receptor and coactivator	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Biochemical and Biophysical Research Communications	6. 最初と最後の頁 460 ~ 465
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.bbrc.2018.09.122	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 Atsushi Kittaka	4. 巻 72
2. 論文標題 Creation of Potent Vitamin D Receptor Agonists and Antagonists with 2 <sup>1</sup> -(-Hydroxyalkylation) Concept to the seco-Steroid Skeleton	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 CHIMIA International Journal for Chemistry	6. 最初と最後の頁 859 ~ 865
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.2533/chimia.2018.859	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 Atsushi Kittaka	4. 巻 2018
2. 論文標題 Novel structure development of vitamin D-derived photoreactive isomers: development of bone effect enhancement and half-life extension molecules in vivo	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Impact	6. 最初と最後の頁 54 ~ 56
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.21820/23987073.2018.10.54	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 Terauchi Yuta, Suzuki Rie, Takeda Ryosuke, Kobayashi Ittetsu, Kittaka Atsushi, Takimoto-Kamimura Midori, Kurita Noriyuki	4. 巻 186
2. 論文標題 Ligand chirality can affect histidine protonation of vitamin-D receptor: ab initio molecular orbital calculations in water	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 The Journal of Steroid Biochemistry and Molecular Biology	6. 最初と最後の頁 89 ~ 95
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.jsbmb.2018.09.020	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 Kawagoe Fumihito, Sugiyama Toru, Yasuda Kaori, Uesugi Motonari, Sakaki Toshiyuki, Kittaka Atsushi	4. 巻 186
2. 論文標題 Concise synthesis of 23-hydroxylated vitamin D3 metabolites	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 The Journal of Steroid Biochemistry and Molecular Biology	6. 最初と最後の頁 161 ~ 168
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.jsbmb.2018.10.010	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 Moriya Shun-suke, Funaki Kaoru, Demizu Yosuke, Kurihara Masaaki, Kittaka Atsushi, Sugiyama Toru	4. 巻 88
2. 論文標題 Synthesis and properties of PNA containing a dicationic nucleobase based on N4-benzoylated cytosine	5. 発行年 2023年
3. 雑誌名 Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters	6. 最初と最後の頁 129287 ~ 129287
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.bmcl.2023.129287	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 Kawagoe Fumihito, Mototani Sayuri, Yasuda Kaori, Takeuchi Akiko, Mano Hiroki, Kakuda Shinji, Saitoh Hiroshi, Sakaki Toshiyuki, Kittaka Atsushi	4. 巻 88
2. 論文標題 Synthesis of (2 <i>R</i> )-, (2 <i>S</i> )-22-Fluoro-, and 22-Difluoro-25-hydroxyvitamin D <sub>3</sub> and Effects of Side-Chain Fluorination on Biological Activity and CYP24A1-Dependent Metabolism	5. 発行年 2023年
3. 雑誌名 The Journal of Organic Chemistry	6. 最初と最後の頁 12394 ~ 12408
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.joc.3c01134	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 Kawagoe Fumihito, Mototani Sayuri, Yasuda Kaori, Mano Hiroki, Takeuchi Akiko, Saitoh Hiroshi, Sakaki Toshiyuki, Kittaka Atsushi	4. 巻 71
2. 論文標題 Synthesis of New 26,27-Difluoro- and 26,26,27,27-Tetrafluoro-25-hydroxyvitamin D <sub>3</sub> ; Effects of Terminal Fluorine Atoms on Biological Activity and Half-	5. 発行年 2023年
3. 雑誌名 Chemical and Pharmaceutical Bulletin	6. 最初と最後の頁 717 ~ 723
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1248/cpb.c23-00395	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 Kawagoe Fumihiro, Mototani Sayuri, Mendoza Aileen, Takemoto Yasushi, Uesugi Motonari, Kittaka Atsushi	4. 巻 14
2. 論文標題 Structure?activity relationship studies on vitamin D-based selective SREBP/SCAP inhibitor KK-052	5. 発行年 2023年
3. 雑誌名 RSC Medicinal Chemistry	6. 最初と最後の頁 2030 ~ 2034
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1039/d3md00352c	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 Kawagoe Fumihiro, Mototani Sayuri, Kittaka Atsushi	4. 巻 14
2. 論文標題 Efficient Stereo-Selective Fluorination on Vitamin D3 Side-Chain Using Electrophilic Fluorination	5. 発行年 2023年
3. 雑誌名 Biomolecules	6. 最初と最後の頁 37 ~ 37
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3390/biom14010037	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 Kittaka Atsushi, Kawagoe Fumihiro, Mototani Sayuri, Takemoto Yasushi, Uesugi Motonari	4. 巻 56
2. 論文標題 An Improved and Scalable Synthesis of the Potent SREBP Inhibitor KK-052 via [3+2] Cycloaddition	5. 発行年 2023年
3. 雑誌名 Synthesis	6. 最初と最後の頁 1460 ~ 1464
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1055/a-2236-0413	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 -

〔学会発表〕 計116件 (うち招待講演 14件 / うち国際学会 15件)

1. 発表者名 上村みどり、栗原典之、橘高敦史
2. 発表標題 量子構造生命科学をめざして
3. 学会等名 日本分析化学会第82回分析化学討論会 (茨城大学水戸キャンパス) (招待講演)
4. 発表年 2022年



1. 発表者名	Daichi Takimoto, Yuta Terauchi, Ryosuke Saito, Atsushi Kittaka, Midori Takimoto-Kamimura, Noriyuki Kurita
2. 発表標題	Protonation states of amino acid residues in protein can affect protein-ligand interactions: Ab initio fragment molecular orbital calculations
3. 学会等名	The 25th International Workshop on Quantum Systems in Chemistry, Physics and Biology (QSCP) (Nicolaus Copernicus University, Torun, Poland) (招待講演) (国際学会)
4. 発表年	2022年

1. 発表者名	本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題	側鎖22位がジフルオロ化されたビタミンD3誘導体の合成
3. 学会等名	日本ビタミン学会第74回大会(福岡大学)
4. 発表年	2022年

1. 発表者名	川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題	ビタミンD3側鎖22位への立体選択的フッ素導入法開発
3. 学会等名	日本ビタミン学会第74回大会(福岡大学)
4. 発表年	2022年

1. 発表者名	岩井悠一郎、大下遥己、真野寛生、川越文裕、高野真史、橘高敦史、榊 利之、安田佳織
2. 発表標題	側鎖にフッ素を有するビタミンD誘導体の代謝およびヒト乳がん細胞株に対する増殖抑制効果
3. 学会等名	日本ビタミン学会第74回大会(福岡大学)
4. 発表年	2022年

1. 発表者名 Fumihiro KAWAGOE, Sayuri MOTOTANI, Kaori YASUDA, Hiroki MANO, Toshiyuki SAKAKI, Atsushi KITTAKA
2. 発表標題 Comprehensive synthesis of side-chain fluorinated vitamin D3 analogues: Construction of chemical library and exploration of drug candidates
3. 学会等名 Asia Pacific Society for Materials Research 2022 Annual Meeting (on line) (招待講演) (国際学会)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 竹本 靖、Mendoza Aileen、Cruzado Kevin Tan、Masoud Shadi Sedghi、永田亜希子、Tantipanjaporn Ajcharapan、奥田 聡、川越文裕、坂本良太、小田木陽、本谷小佑里、富樫萌香、川谷 誠、青野晴美、長田裕之、中川勇人、東 達也、橘高敦史、長澤和夫、上杉志成
2. 発表標題 ビタミンD代謝産物による脂質ベータ酸化とカルニチン生合成の制御
3. 学会等名 第64回天然有機化合物討論会 (清水文化会館マリナート)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 22位フッ素化ビタミンD3誘導体の立体選択的合成
3. 学会等名 第66回日本薬学会関東支部大会 (横浜薬科大学)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖22位へのジフルオロ部位導入法の開発と22,22-ジフルオロビタミンD3誘導体の合成
3. 学会等名 第66回日本薬学会関東支部大会 (横浜薬科大学)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 橘高敦史、安田佳織、榊 利之、岡田只士
2. 発表標題 炎症性疾患あるいはがんを抑制するフッ素化ビタミンD誘導体の開発
3. 学会等名 NEDO, JST主催：イノベーションジャパン2022
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 橘高敦史、高野真史、川越文裕
2. 発表標題 CYP24A1代謝に抵抗するVD3誘導体の合成化学
3. 学会等名 情報計算化学生物学会(CBI学会)2022年大会(タワーホール船堀)(招待講演)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 Shun-suke Moriya, Misaki Yonezu, Yuzu Kondo, Yosuke Demizu, Masaaki Kurihara, Atsushi Kittaka, and Toru Sugiyama
2. 発表標題 SYNTHESIS OF DICATIONIC CYTOSINE DERIVATIVE FOR PEPTIDE NUCLEIC ACID
3. 学会等名 第59回ペプチド討論会(トークネットホール仙台)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 Shun-suke Moriya, Misaki Yonezu, Yuzu Kondo, Yosuke Demizu, Masaaki Kurihara, Atsushi Kittaka, Toru Sugiyama
2. 発表標題 Synthesis of peptide nucleic acid possessing dicationic cytosine derivative
3. 学会等名 第49回国際核酸化学シンポジウム(東京理科大・葛飾キャンパス)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 (22R)-および(22S)-フルオロ-25-ヒドロキシビタミンD3の立体選択的合成
3. 学会等名 第48回反応と合成の進歩シンポジウム(千葉市民会館)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 ビタミンD3側鎖22位へのジフルオロ部位の効率的導入法開発
3. 学会等名 第48回反応と合成の進歩シンポジウム(千葉市民会館)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖フッ素化ビタミンD3誘導体合成とライブラリー構築、医薬品への展開
3. 学会等名 第17回Neo Vitamin D Workshop学術集会(ホテルイースト21東京)(招待講演)
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 22位がフッ素化された25-ヒドロキシビタミンD3誘導体の合成
3. 学会等名 日本薬学会 第143年会(札幌)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 CD環側鎖22位への効率的ジフルオロ部位の導入と22,22-ジフルオロ-25-ヒドロキシビタミンD3の合成
3. 学会等名 日本薬学会 第143年会（札幌）
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 森谷俊介、米津実咲、近藤有寿、出水庸介、栗原正明、橘高敦史、杉山 亨
2. 発表標題 ペプチド核酸のinvasionを目指したジカチオンを持つシトシン誘導体の合成
3. 学会等名 日本薬学会 第143年会（札幌）
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 橘高敦史、川越文裕、本谷小佑里、竹本 靖、長澤和夫、中川勇人、上杉志成
2. 発表標題 脂質生合成の司令塔SREBP/SCAP系を選択的に抑制するビタミンD誘導体開発
3. 学会等名 第368回脂溶性ビタミン総合研究委員会（招待講演）
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 橘高敦史
2. 発表標題 人工ビタミンDの可能性：ビタミンD受容体（VDR）リガンドと非VDRリガンドの研究
3. 学会等名 日本ビタミン学会第73回大会（招待講演）
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 岡田只士、安田佳織、西川美宇、生城真一、橘高敦史、加藤茂明、榊 利之
2. 発表標題 ビタミンDによる新規炎症性腸疾患治療戦略
3. 学会等名 日本ビタミン学会第73回大会
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 23,23-ジフルオロビタミンD3誘導体の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第73回大会
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖23位がフッ素化されたビタミンD3誘導体の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第73回大会
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 23位フッ素化ビタミンD3誘導体の効率的合成法開発
3. 学会等名 第65回日本薬学会関東支部大会
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、竹本 靖、長澤和夫、中川勇人、上杉志成、橘高敦史
2. 発表標題 SREBP経路を介する脂質生合成を選択的に阻害するビタミンD誘導体の合成
3. 学会等名 第47回反応と合成の進歩シンポジウム
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 23位がジフルオロ化されたビタミンD3誘導体の合成
3. 学会等名 第47回反応と合成の進歩シンポジウム
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 24位がヒドロキシ化された23,23-ジフルオロビタミンD3誘導体の合成
3. 学会等名 日本薬学会 第142年会
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 23,23-ジフルオロ-25-ヒドロキシビタミンD3の効率的合成法開発
3. 学会等名 日本薬学会 第142年会
4. 発表年 2022年



1. 発表者名 森谷俊介、米田有希、桑田啓子、今村保忠、出水庸介、栗原正明、橘高敦史、杉山 亨
2. 発表標題 PreQ1塩基を持つペプチド核酸の合成とその性質
3. 学会等名 日本薬学会 第142年会
4. 発表年 2022年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖24位がフルオロ化された25-水酸化ビタミンD3の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第72回大会(ういんく愛知) オンライン
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 高野真史、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 2位にアゾールアルキル基を有する19-ノルビタミンD誘導体の予想代謝物の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第72回大会(ういんく愛知) オンライン
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 (24R)-および(24S)-24-Fluoro-25-hydroxyvitamin D3の立体選択的合成
3. 学会等名 第64回日本薬学会関東支部大会(武蔵野大学薬学部) オンライン
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 水本結花、坂本良太、Shadi Sedghi Masoud、永田亜希子、橘高敦史、小田木 陽、長澤和夫
2. 発表標題 2位置換型19-ノルピタミンD3合成における立体選択性
3. 学会等名 第64回日本薬学会関東支部大会（武蔵野大学薬学部）オンライン
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 石澤通康、高野真史、橘高敦史、横島 誠
2. 発表標題 脂肪由来多能性細胞を利用したビタミンD誘導体の骨芽細胞分化誘導評価
3. 学会等名 第365回脂溶性ビタミン総合研究委員会（北里大学薬学部）オンライン
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 水本結花、坂本良太、永田亜希子、橘高敦史、小田木 陽、寺 正行、長澤和夫
2. 発表標題 C2位置換型19-ノルピタミンD3合成における立体選択性および生物活性評価
3. 学会等名 日本化学会 第101春季年会(2021)（日本大学理工学部）オンライン
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖がフッ素化されたビタミンD3誘導体の設計と合成
3. 学会等名 日本薬学会 第141年会（広島）オンライン
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖24位が水酸化されたビタミンD3誘導体の立体選択的合成
3. 学会等名 日本薬学会 第141年会 (広島) オンライン
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 F. Kawagoe, S. Mototani, K. Yasuda, K. Nagasawa, M. Uesugi, T. Sakaki, and A. Kittaka
2. 発表標題 INTRODUCTION OF FLUORINE ATOMS ON VITAMINE D3 SIDE-CHAIN AT C24 POSITION
3. 学会等名 22nd Vitamin D Workshop (New York City, USA) (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 M. Takano, K. Yasuda, H. Mano, T. Sakaki, and A. Kittaka
2. 発表標題 SYNTHESIS OF 2-(2-TRIAZOLYLETHYL)-1,25-DIHYDROXY-19-NORVITAMIN D3 AND ITS METABOLISM
3. 学会等名 22nd Vitamin D Workshop (New York City, USA) (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 K. Yasuda, K. Okamoto, M. Nishikawa, F. Kawagoe, K. Nakagawa, N. Tsugawa, T. Okano, A. Kittaka, S. Ikushiro, T. Sakaki
2. 発表標題 ELCIDATION OF 25-HYDROXYVITAMIN D3 METABOLISM USING Cyp24a1-KNOCKOUT RATS GENERATED BY CRISPR/Cas9 SYSTEM
3. 学会等名 22nd Vitamin D Workshop (New York City, USA) (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 高野真史, 安田佳織, 真野寛生, 榊 利之, 橘高敦史
2. 発表標題 2位にトリアゾリルエチル基を有する19-ノルビタミンD誘導体の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第71回大会 (鳥取、とりぎん文化会館)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 川越文裕, 本谷小佑里, 安田佳織, 上杉志成, 榊 利之, 橘高敦史
2. 発表標題 側鎖24位がジフルオロ化されたビタミンD3 CD環部の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第71回大会 (鳥取、とりぎん文化会館)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 西川美宇, 安田佳織, 真野寛樹, 高野真史, 橘高敦史, 生城真一, 榊 利之
2. 発表標題 変異型VDR導入ラットを用いた25(OH)ビタミンD3およびビタミンD誘導体の骨形成作用評価
3. 学会等名 日本ビタミン学会第71回大会 (鳥取、とりぎん文化会館)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 安田佳織, 岡本海利, 西川美宇, 真野寛樹, 川越文裕, 中川公恵, 津川尚子, 岡野登志夫, 橘高敦史, 生城真一, 榊 利之
2. 発表標題 生体内におけるCYP24A1およびCYP3A依存性ビタミンD代謝解析
3. 学会等名 日本ビタミン学会第71回大会 (鳥取、とりぎん文化会館)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 真野寛生、生城真一、高野真史、橘高敦史、榊 利之
2. 発表標題 VDRリガンドに応答して発光量が劇的に上昇する分割型ルシフェラーゼバイオセンサーの開発
3. 学会等名 日本ビタミン学会第71回大会（鳥取、とりぎん文化会館）
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 橘高敦史
2. 発表標題 ビタミンD 類縁体合成
3. 学会等名 第5回 Neo Vitamin D Workshop 学術集会（ホテル イースト21東京）（招待講演）
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖24位がフッ素化されたビタミンD誘導体の合成
3. 学会等名 第5回 Neo Vitamin D Workshop 学術集会（ホテル イースト21東京）
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 栗田典之、上村みどり、橘高敦史
2. 発表標題 高精度分子シミュレーションによるVitamin D受容体とリガンド間の相互作用解析：リガンドのキラリティーの影響
3. 学会等名 第5回 Neo Vitamin D Workshop 学術集会（ホテル イースト21東京）
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 岡田侑奈、瓜本篤史、青柳珠実、有坂慧秋、川合美羽、高野真史、橘高敦史
2. 発表標題 2-(2-トリアゾリルエチル) 基を有する19-ノルピタミンD3の合成
3. 学会等名 第63回日本薬学会関東支部大会（北里大学薬学部）
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 CYP24A1代謝抵抗性をもつビタミンD3誘導体合成
3. 学会等名 第63回日本薬学会関東支部大会（北里大学薬学部）
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 佐孝大樹、黒澤俊樹、手賀悠真、高野真史、橘高敦史、出口芳春
2. 発表標題 ヒトiPS由来脳毛細血管内皮細胞におけるP糖タンパク質の発現誘導
3. 学会等名 第63回日本薬学会関東支部大会（北里大学薬学部）
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Shun-suke Moriya, Yuko Sasa, Keiko Kuwata, Yasutada Imamura, Yosuke Demizu, Masaaki Kurihara, Atsushi Kittaka, and Toru Sugiyama
2. 発表標題 An approach toward visual detection of single nucleotide polymorphism using pseudocomplementary peptide nucleic acid
3. 学会等名 第56回ペプチド討論会（東京医科歯科大学）
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 高野真史, 安田佳織, 真野寛生, 榊 利之, 橘高敦史
2. 発表標題 19-ノルビタミンD3への2-(2-トリアゾリルエチル)基の導入
3. 学会等名 第45回反応と合成の進歩シンポジウム (倉敷市芸文館)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 本谷小佑里, 川越文裕, 安田佳織, 上杉志成, 榊 利之, 橘高敦史
2. 発表標題 側鎖がフッ素化されたビタミンD誘導体群の合成
3. 学会等名 第45回反応と合成の進歩シンポジウム (倉敷市芸文館)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 森谷俊介, 柴崎初音, 桑田啓子, 今村保忠, 出水庸介, 栗原正明, 橘高敦史, 杉山 亨
2. 発表標題 7-Aminomethyl-7-deazaguanine をもつ PNA 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 (倉敷市芸文館)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 高野真史, 安田佳織, 真野寛生, 榊 利之, 橘高敦史
2. 発表標題 2位にアゾリルアルキル基を有する活性型ビタミンD3の19-ノル体合成と代謝
3. 学会等名 第37回メディシナルケミストリーシンポジウム (八王子、いちょうホール)
4. 発表年 2019年



1. 発表者名 安田佳織、西川美宇、真野寛生、川越文裕、中川公恵、津川尚子、岡野登志夫、橘高敦史、生城真一、榊 利之
2. 発表標題 各種遺伝子改変ラットに対する 25-ヒドロキシビタミン D3 の投与効果および代謝解析
3. 学会等名 第364回脂溶性ビタミン総合研究委員会（富山）
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 坂本良太、永田亜希子、Shadi Sedghi Masoud、竹本 靖、橘高敦史、上杉志成、小田木陽、長澤和夫
2. 発表標題 ビタミンDラクトンの立体選択的合成と標的タンパク質の探索
3. 学会等名 日本化学会第100春季年会(2020)（東京理科大）
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 水本結花、永田亜希子、坂本良太、Shadi Sedghi Masoud、折原辰弥、川越文裕、橘高敦史、小田木 陽、長澤和夫
2. 発表標題 2位置換型19-ノルビタミンD合成におけるJuliaオレフィン化反応の立体選択性
3. 学会等名 日本化学会第100春季年会(2020)（東京理科大）
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 CYP24A1代謝抵抗性をもつビタミンD3誘導体の設計と合成
3. 学会等名 日本薬学会 第140年会（京都）
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 高野真史, 安田佳織, 真野寛生, 榊 利之, 橘高敦史
2. 発表標題 2 -2-トリアゾリルエチル基を有する19-ノルピタミンD誘導体の合成と代謝
3. 学会等名 日本薬学会 第140年会 (京都)
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 森谷俊介, 笹 祐子, 桑田啓子, 今村保忠, 出水庸介, 栗原正明, 橘高敦史, 杉山 亨
2. 発表標題 ペプチド核酸によるdouble duplex invasionを応用した目視判定可能な一塩基多型検出系の検討
3. 学会等名 日本薬学会 第140年会 (京都)
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 F. Kawagoe, M. Uesugi, K. Yasuda, T. Sakaki, and A. Kittaka
2. 発表標題 ALTERNATIVE SYNTHESIS OF 23,25-DIHYDROXYVITAMINE D3
3. 学会等名 21st Vitamin D Workshop (Barcelona, Spain) (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 M. Takano, K. Yasuda, H. Mano, T. Sakaki, and A. Kittaka
2. 発表標題 SYNTHESIS OF 2-[2-(TETRAZOL-2-YL)ETHYL]-1 ,25-DIHYDROXY-19-NORVITAMIN D3 AND ITS METABOLISM
3. 学会等名 21st Vitamin D Workshop (Barcelona, Spain) (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 高野真史、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 2位にテトラゾリルエチル基を有する19-ノルビタミンD誘導体の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第70回大会(高槻現代劇場)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 川越文裕、上杉志成、安田佳織、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 23,25-ジヒドロキシビタミンD3の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第70回大会(高槻現代劇場)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 安田佳織、岡本海利、西川美宇、阿部圭祐、真野寛生、中川公恵、津川尚子、岡野登志夫、川越文裕、橘高敦史、生城真一、榊 利之
2. 発表標題 CYP24A1遺伝子改変ラットを用いた25-ヒドロキシビタミンD3の代謝解明
3. 学会等名 日本ビタミン学会第70回大会(高槻現代劇場)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 岡本海利、安田佳織、真野寛生、西川美宇、川越文裕、橘高敦史、生城真一、榊 利之
2. 発表標題 23位置換基付加型25-ヒドロキシビタミンD3の代謝と生理作用
3. 学会等名 日本ビタミン学会第70回大会(高槻現代劇場)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 真野寛生、生城真一、高野真史、橘高敦史、榊 利之
2. 発表標題 ビタミンDバイオセンサーを用いたCYP27B1活性の新規評価方法
3. 学会等名 日本ビタミン学会第70回大会(高槻現代劇場)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 西川美宇、安田佳織、高松将士、阿部圭祐、堀部恭平、真野寛樹、橘高敦史、高野真史、中川公恵、岡野登志夫、生城真一、榊 利之
2. 発表標題 ゲノム編集法で作製したビタミン D 関連遺伝子改変ラットを用いた新規ビタミン D 作用機序の解明
3. 学会等名 日本ビタミン学会第70回大会(高槻現代劇場)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 阿部圭祐、西川美宇、堀部恭平、安田香織、真野寛生、橘高敦史、高野真史、中川公恵、岡野登志夫、生城真一、榊 利之
2. 発表標題 ゲノム編集法で作製した変異型 VDR 導入ラットにおける 25(OH)ビタミン D3 およびビタミン D 誘導体の活性評価
3. 学会等名 日本ビタミン学会第70回大会(高槻現代劇場)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Akane Shimoda, Miyu Ito, Hikari Uemura, Toru Sugiyama, Atsushi Kittaka, Yoshitomo Suhara
2. 発表標題 Synthesis of collagen mimetic incorporated -amino acid
3. 学会等名 256th American Chemical Society National Meeting (Boston, USA) (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 川越文裕、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖23位がフッ素化されたビタミンD誘導体の合成
3. 学会等名 第4回 Neo Vitamin D Workshop 学術集会（都市センターホテル）（招待講演）
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 栗田典之、上村みどり、河合健太郎、橘高敦史
2. 発表標題 高精度分子シミュレーションによるVitamin D受容体とリガンド間の特異的相互作用の解明
3. 学会等名 第4回 Neo Vitamin D Workshop 学術集会（都市センターホテル）（招待講演）
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 安田佳織、西川美宇、岡本海利、阿部圭祐、中川公恵、津川尚子、岡野登志夫、川越文裕、橘高敦史、生城真一、榊 利之
2. 発表標題 ゲノム編集法により作製したCYP24A1遺伝子欠損ラットを用いた25-ヒドロキシビタミンD3代謝様式の解明
3. 学会等名 第4回 Neo Vitamin D Workshop 学術集会（都市センターホテル）（招待講演）
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 上野滉一、川越文裕、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 代謝酵素に高い抵抗性を示すビタミンD3誘導体の合成研究
3. 学会等名 第62回日本薬学会関東支部大会（帝京平成大学薬学部）
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 川越文裕、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 25-ヒドロキシビタミンD3代謝物とその誘導体の合成研究
3. 学会等名 第62回日本薬学会関東支部大会（帝京平成大学薬学部）
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 杉山 亨、柴崎初音、森谷俊介、栗原正明、橘高敦史
2. 発表標題 電荷を帯びたグアニンアナログをもつPNAオリゴマーの合成
3. 学会等名 第62回日本薬学会関東支部大会（帝京平成大学薬学部）
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Yuta Terauchi, Rie Suzuki, Atsushi Kittaka, Midori Takimoto-Kamimura, Noriyuki Kurita
2. 発表標題 Ligand chirality can affect histidine protonation of vitamin-D receptor: ab initio molecular orbital calculations in water
3. 学会等名 CBI学会2018年大会（タワーホール船堀）
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 高野真史、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 2位置換基上にアゾールを有する新規19-ノルビタミンD誘導体の合成と代謝
3. 学会等名 第44回反応と合成の進歩シンポジウム（熊本）
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 川越文裕、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 含フッ素ビタミンD誘導体群の合成
3. 学会等名 第44回反応と合成の進歩シンポジウム(熊本)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 高野真史、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 2-(2-テトラゾールエチル)活性型ビタミンD3とその19-ノル体の合成と代謝
3. 学会等名 第36回メディシナルケミストリーシンポジウム(京都テルサ)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 川越文裕、安田佳織、上杉志成、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 23位修飾25-ヒドロキシビタミンD3の合成と代謝研究
3. 学会等名 第36回メディシナルケミストリーシンポジウム(京都テルサ)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 杉山 亨、柴崎初音、森谷俊介、桑田啓子、今村保忠、出水庸介、栗原正明、橘高敦史
2. 発表標題 正電荷を帯びたグアニン誘導体をもつPNAオリゴマーの合成
3. 学会等名 第36回メディシナルケミストリーシンポジウム(京都テルサ)
4. 発表年 2018年



1. 発表者名 Midori Takimoto-Kamimura, Atsushi Kittaka and Noriyuki Kurita
2. 発表標題 Quantum chemical consideration of the mechanism in which a slight structural difference of the ligand produces a large activity difference of VDR affinity
3. 学会等名 The Asian Crystallographic Association Conference (AsCA 2018) (Auckland, New Zealand) (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Toru Sugiyama, Hatsune Shibasaki, Shun-suke Moriya, Keiko Kuwata, Yasutada Imamura, Yosuke Demizu, Masaaki Kurihara, and Atsushi Kittaka
2. 発表標題 PNA OLIGOMERS POSSESSING PREQ1 AS A CATIONIC ANALOGUE OF GUANINE
3. 学会等名 第10回国際ペプチドシンポジウム / 第55回ペプチド討論会 (ロームシアター京都、みやこめっせ、京都府京都市) (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Fumihiro Kawagoe, Motonari Uesugi, Atsushi Kittaka
2. 発表標題 Efficient introduction of fluorine to CYP24A1-dependent catabolic site on vitamin D3 side-chain
3. 学会等名 第5回AMED-CREST・JSTさきがけ合同領域会議 (神戸) 「疾患における代謝産物の解析および代謝制御に基づく革新的医療基盤技術の創出」研究領域
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 高野真史、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 2-[2-(テトラゾール-2-イル)エチル]活性型ビタミンD3の19-ノル体合成と代謝
3. 学会等名 日本薬学会 第139年会 (千葉、幕張メッセ)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 森谷俊介、柴崎初音、桑田啓子、今村保忠、出水庸介、栗原正明、橘高敦史、杉山 亨
2. 発表標題 新規カチオン性グアニンアナログをもつPNAオリゴマー
3. 学会等名 日本薬学会 第139年会 (千葉、幕張メッセ)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 西川美宇、阿部圭祐、安田佳織、真野寛生、生城真一、高野真史、橘高敦史、榊 利之
2. 発表標題 変異型VDR導入ラットを用いた新規ビタミンD誘導体の評価
3. 学会等名 日本薬学会 第139年会 (千葉、幕張メッセ)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 安田佳織、岡本海利、西川美宇、中川公恵、津川尚子、川越文裕、橘高敦史、生城真一、岡野登志夫、榊 利之
2. 発表標題 生体内における CYP24A1 および CYP3A 依存性ビタミン D 代謝解析
3. 学会等名 日本薬学会 第139年会 (千葉、幕張メッセ)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 26,27-ジフルオロ-25-ヒドロキシビタミンD3および26,26,27,27-テトラフルオロ-25-ヒドロキシビタミンD3の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第75回大会(東北大学)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 24,24-ジフルオロ-26,27-ジメチルビタミンD3誘導体の合成
3. 学会等名 日本ビタミン学会第75回大会(東北大学)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 高野真史、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 2位にテトラゾリルエチル基を有する19-ノルビタミンD誘導体の合成と代謝
3. 学会等名 日本ビタミン学会第75回大会(東北大学)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 岩井悠一郎、高橋 秀、Vanshita Sharma、真野寛生、川越文裕、高野真史、橘高敦史、中西友子、佐藤栄人、榊 利之、安田佳織
2. 発表標題 ヒトCYP24A1発現アデノウイルスベクターを用いたビタミンD誘導体代謝予測系の開発
3. 学会等名 日本ビタミン学会第75回大会(東北大学)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 橘高敦史
2. 発表標題 フッ素の基礎化学とビタミンD3への適用：予測不能な生物活性
3. 学会等名 第50回日本毒性学会学術年会(パシフィコ横浜)(招待講演)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名	Fumihiro Kawagoe, Sayuri Mototani, Kaori Yasuda, Hiroki Mano, Toshiyuki Sakaki, and Atsushi Kittaka
2. 発表標題	Synthesis of 22,22-difluoro-25-hydroxyvitamin D3 and effects of side chain fluorination on vitamin D receptor binding affinity and CYP24A1-dependent metabolism
3. 学会等名	AIMECS 2023 (ソウル) 14th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (国際学会)
4. 発表年	2023年

1. 発表者名	Sayuri Mototani, Fumihiro Kawagoe, Kaori Yasuda, Hiroki Mano, Toshiyuki Sakaki, and Atsushi Kittaka
2. 発表標題	Synthesis of 23,23-difluorovitamin D3 analogues using convergent route
3. 学会等名	AIMECS 2023 (ソウル) 14th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (国際学会)
4. 発表年	2023年

1. 発表者名	Fumihiro Kawagoe, Sayuri Mototani, Kaori Yasuda, Hiroki Mano, Toshiyuki Sakaki, Atsushi Kittaka
2. 発表標題	Comprehensive synthesis of side-chain fluorinated vitamin D3 derivatives and their stability to hCYP24A1-dependent catabolism
3. 学会等名	日本薬物動態学会第38回年会・第23回シトクロムP450国際会議国際合同大会 (静岡) (招待講演) (国際学会)
4. 発表年	2023年

1. 発表者名	SAYURI MOTOTANI, FUMIHIRO KAWAGOE, KAORI YASUDA, HIROKI MANO, TOSHIYUKI SAKAKI, ATSUSHI KITTAKA
2. 発表標題	Synthesis and preliminary biological evaluation of 23,23-difluorovitamin D3 analogues
3. 学会等名	日本薬物動態学会第38回年会・第23回シトクロムP450国際会議国際合同大会 (静岡) (国際学会)
4. 発表年	2023年

1. 発表者名 M Takano, K Yasuda, H Mano, T Sakaki, and A Kittaka
2. 発表標題 Synthesis of 2-[2-(Tetrazol-2-yl)ethyl]-1,25-dihydroxy-19-norvitamin D3 and Its Metabolism
3. 学会等名 日本薬物動態学会第38回年会・第23回シトクロムP450国際会議国際合同大会（静岡）（国際学会）
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 高野真史、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 2-(2-テトラゾール-2-イルエチル)-1,25(OH)2-19-ノルVD3の合成と代謝
3. 学会等名 第67回日本薬学会関東支部大会（明治薬科大学）
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 ビタミンD3側鎖26,27位へのジフルオロ化およびテトラフルオロ化
3. 学会等名 第67回日本薬学会関東支部大会（明治薬科大学）
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖22位へのジフルオロ部位導入法の開発と22,22-ジフルオロビタミンD3誘導体の合成
3. 学会等名 第67回日本薬学会関東支部大会（明治薬科大学）
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 Shun-suke Moriya, Yosuke Demizu, Masaaki Kurihara, Atsushi Kittaka, Toru Sugiyama
2. 発表標題 Strand invasion by PNA containing preQ1
3. 学会等名 第50回国際核酸化学シンポジウム (宮崎市民プラザ)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 側鎖26位および27位がフッ素化されたビタミンD3誘導体の合成研究
3. 学会等名 第49回反応と合成の進歩シンポジウム (じゅうろくプラザ、岐阜)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 本谷小佑里, 川越文裕, 安田佳織, 真野寛生, 榊 利之, 橘高敦史
2. 発表標題 求電子的フッ素化反応を用いるビタミンD3側鎖への立体選択的フッ素導入
3. 学会等名 第49回反応と合成の進歩シンポジウム (じゅうろくプラザ、岐阜)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 Shun-suke Moriya, Mai Kiyosue, Yosuke Demizu, Masaaki Kurihara, Atsushi Kittaka, Toru Sugiyama
2. 発表標題 PROPERTIES OF PEPTIDE NUCLEIC ACID CONTAINING N4-BIS(AMINOMETHYL)BENZOYLATED CYTOSINE FOR ENHANCED DNA BINDING
3. 学会等名 第60回ペプチド討論会 (滋賀県立劇場 びわ湖ホール・ピアザ淡海)
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 22位修飾25-ヒドロキシビタミンD3の合成と代謝研究
3. 学会等名 第40回メディシナルケミストリーシンポジウム（名古屋大学）
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 ビタミンD3側鎖22,24位への求電子的フッ素化反応を用いた立体選択的フッ素導入
3. 学会等名 第40回メディシナルケミストリーシンポジウム（名古屋大学）
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 高野真史、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 2位にテトラゾリルエチル基を有する活性型ビタミンD3の19-ノル体合成と代謝
3. 学会等名 第40回メディシナルケミストリーシンポジウム（名古屋大学）
4. 発表年 2023年

1. 発表者名 橘高敦史
2. 発表標題 多様な活性をもつビタミンD誘導体の開発研究
3. 学会等名 日本薬学会第144年会（パシフィコ横浜）（招待講演）
4. 発表年 2024年

1. 発表者名 川越文裕、本谷小佑里、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 25-ヒドロキシビタミンD3の側鎖フッ素化と生物活性
3. 学会等名 日本薬学会第144年会（パシフィコ横浜）
4. 発表年 2024年

1. 発表者名 本谷小佑里、川越文裕、安田佳織、真野寛生、榊 利之、橘高敦史
2. 発表標題 求電子的フッ素化剤を用いたビタミンD3側鎖への効率的フッ素原子導入
3. 学会等名 日本薬学会第144年会（パシフィコ横浜）
4. 発表年 2024年

1. 発表者名 森谷俊介、大石真菜、出水庸介、栗原正明、橘高敦史、杉山 亨
2. 発表標題 DNAへの結合を強めるカチオン性シトシン誘導体のペプチド核酸
3. 学会等名 日本薬学会第144年会（パシフィコ横浜）
4. 発表年 2024年

〔図書〕 計7件

1. 著者名 橘高 敦史	4. 発行年 2022年
2. 出版社 化学同人	5. 総ページ数 352
3. 書名 創薬科学・医薬化学 第2版	



1. 著者名 橘高敦史 (分担)	4. 発行年 2022年
2. 出版社 厚生労働省	5. 総ページ数 201
3. 書名 第十八改正日本薬局方第一追補	

1. 著者名 日本ビタミン学会 (分担)	4. 発行年 2021年
2. 出版社 朝倉書店	5. 総ページ数 672
3. 書名 ビタミン・バイオフィクター総合事典	

1. 著者名 厚生労働省 (分担)	4. 発行年 2021年
2. 出版社 厚生労働省	5. 総ページ数 2497
3. 書名 第十八改正日本薬局方	

1. 著者名 N. K. Dunlap, D. M. Hury, 長野哲雄 監訳 (橘高敦史 共訳)	4. 発行年 2020年
2. 出版社 東京化学同人	5. 総ページ数 376
3. 書名 ダンラップ・ヒューリン創薬化学	

1. 著者名 橘高敦史ら 編著	4. 発行年 2018年
2. 出版社 時事通信社	5. 総ページ数 1155
3. 書名 新・毒物劇物取扱の手引	

1. 著者名 橘高敦史ら 編著	4. 発行年 2019年
2. 出版社 東京化学同人	5. 総ページ数 290
3. 書名 知っておきたい有機反応100 第2版	

〔出願〕 計6件

産業財産権の名称 C D環側鎖置換ビタミンD誘導体	発明者 橘高敦史、川越文 裕、榊 利之、安田 佳織	権利者 帝京大学、富山 県立大学
産業財産権の種類、番号 特許、特願2022-168144	出願年 2022年	国内・外国の別 国内

産業財産権の名称 C D環側鎖置換ビタミンD誘導体	発明者 橘高敦史、川越文 裕、榊 利之、安田 佳織	権利者 帝京大学
産業財産権の種類、番号 特許、PCT/JP2022/39059	出願年 2022年	国内・外国の別 外国

産業財産権の名称 C D環側鎖置換ビタミンD誘導体	発明者 橘高敦史、川越文 裕、榊 利之、安田 佳織	権利者 帝京大学、富山 県立大学
産業財産権の種類、番号 特許、特願2021-171650	出願年 2021年	国内・外国の別 国内

産業財産権の名称 VDR-SILENT VITAMIN D DERIVATIVE AS INHIBITORS OF SREBP AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF	発明者 上杉、竹本、長澤、 橘高、川越、中川	権利者 京都大学、東京 農工大学、帝京 大学、東京大学
産業財産権の種類、番号 特許、US 63/080,010	出願年 2020年	国内・外国の別 外国

産業財産権の名称 ビタミンDラクトンによる脂質蓄積	発明者 上杉、竹本、メン ドーザ、長澤、橘 高、川越、本谷、中	権利者 京都大学、東京 農工大学、帝京 大学
産業財産権の種類、番号 特許、特願2021-027813	出願年 2021年	国内・外国の別 国内

産業財産権の名称 C D環側鎖置換ビタミンD誘導体含有I L - 1 9 分泌抑制剤	発明者 橘高敦史、川越文裕	権利者 帝京大学
産業財産権の種類、番号 特許、特願2023-068498	出願年 2023年	国内・外国の別 国内

〔取得〕 計1件

産業財産権の名称 VDR-SILENT VITAMIN D DERIVATIVE AS INHIBITORS OF SREBP AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF	発明者 上杉、竹本、長澤、橘高、川越、中川	権利者 京都大学、東京農工大学、帝京大学、東京大学
産業財産権の種類、番号 特許、US-2022-0081381-A1	取得年 2022年	国内・外国の別 外国

〔その他〕

<a href="https://researchmap.jp/read0025684/">https://researchmap.jp/read0025684/</a> <a href="http://www.pharm.teikyo-u.ac.jp/">http://www.pharm.teikyo-u.ac.jp/</a> 橘高敦史
--

#### 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	高野 真史  (Takano Masashi)  (50386611)	帝京大学・薬学部・講師   (32643)	

	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
研究協力者	榊 利之  (Sakaki Toshiyuki)		
研究協力者	安田 佳織  (Yasuda Kaori)		

#### 7. 科研費を使用して開催した国際研究集会

〔国際研究集会〕 計0件

8 . 本研究に関連して実施した国際共同研究の実施状況

共同研究相手国	相手方研究機関			
その他の国・地域 台湾	Chang Gung Memorial Hospital	Taipei Veterans General Hospital	College of Medicine, Gung University	
米国	Boston University School of Medicine			