

所属・氏名（ 健康科学部 医療栄養学科 氏名：手納 直規 ）

著書、学術論文等の名称		単著 共著 の別	発行又は発表 の年月	発行所、発表雑誌 等又は発表学会等 の名称	概 要
1	(学術論文) Discovery of orally active and nonsteroidal farnesoid X receptor (FXR) antagonist with propensity for accumulation and responsiveness in ileum. (筆頭論文)	共著	2021 年	<i>ACS Med. Chem. Lett.</i> 2021 , 12, 420- 425. American Chemical Society	著書全体の概要:肝マイクロソームでの安定性を指標に FXR アンタゴニストの分子修飾を行った結果、分子修飾を行ったアンタゴニストは短期投与において回腸での FXR 下流の遺伝子発現を制御した。 (著書全体の著者名:Teno, N.; Iguchi, Y.; Oda, K.; Yamashita, Y.; Masuda, A.; Fujimori, K.; Une, M.; Gohda, K.) (担当部分の概要:企画、化合物デザイン・合成、論文作成)
2	(学術論文) N ¹ -Substituted benzimidazole scaffold for farnesoid X receptor (FXR) agonists accompanying prominent selectivity against vitamin D receptor (VDR).	共著	2020 年	<i>Bioorg. Med. Chem.</i> 2020 , 28, 115512. Elsevier	著書全体の概要:GW4064の部分構造とN-置換ベンゾイミダゾール部のキメラ構造を持つFXRアゴニストの開発。CADD によるモデリングで N-置換部からの構造修飾が可能であることを示した。加えて、骨髄の分化にFXRの活性化が関わっていることを証明した。 (著書全体の著者名:Masuda, A.; Gohda, K.; Iguchi, Y.; Fujimori, K.; Yamashita, Y.; Oda, K.; Une, M.; Teno, N.) (担当部分の概要:企画、化合物デザイン・合成、論文作成)
3	(学術論文) Identification of potent farnesoid X receptor (FXR) antagonist showing favorable PK profile and distribution toward target tissues: Comprehensive understanding of structure-activity relationship of FXR antagonists. (筆頭論文)	共著	2019 年	<i>Bioorg. Med. Chem.</i> , 2019 . 27, 2220-2229. Elsevier	著書全体の概要:我々の FXR アンタゴニストの総合的に構造活性相関を理解し、活性を維持しつつ薬物動態などの化合物のプロファイルを変化できる部分構造を付き止めた。その結果 bioavailability を高め、加えて標的臓器(小腸、肝臓)への移行性も優位に高めることができた。 (著書全体の著者名:Teno, N.; Yamashita, Y.; Masuda, A.; Iguchi, Y.; Oda, K.; Fujimori, K.; Hiramoto, T.; Nishimaki-Mogami, T.; Une, M.; Gohda, K.) (担当部分の概要:企画、化合物デザイン・合成、論文作成)
4	(学術論文) Nonacidic chemotype possessing N-acylated piperidine moiety as potent farnesoid X receptor (FXR) antagonists. (筆頭論文)	共著	2018 月	<i>ACS Med. Chem. Lett.</i> , 2018 9, 78- 83, American Chemical Society	著書全体の概要:我々の FXR アンタゴニストは、選択性にも優れ、FXR の標的遺伝子も制御している。また、脂肪細胞の分化も阻害していることも確認できたため、現在 in vivo 試験の準備を整えている。 (著書全体の著者名:Teno, N.; Yamashita, Y.; Iguchi, Y.; Fujimori, K.; Une, M.; Nishimaki-Mogami, T.; Hiramoto, T.; Gohda, K.) (担当部分の概要:企画、化合物デザイン・合成、論文作成)