

## 研究教育業績（2014-2018 年度）

## I. 研究業績

## 1. 主な発表論文

[原著論文]

- 1) Kumamoto, H.; Imoto, S.; Amano, M.; Kuwata-Higashi, N.; Baba, M.; Mitsuya, H.; Odanaka, Y.; Shimbara-Matsubayashi, S.; Tanaka, H.; Haraguchi, K. “Synthesis, anti-HBV, and anti-HIV activities of 3'-halogenated bis(hydroxymethyl)cyclopentenyl adenines” *ACS Med. Chem. Lett.* **2018**, *9*, 1211-1216.
- 2) Kumamoto, H.; Fukano, M.; Imoto, S.; Kohgo, S.; Odanaka, Y.; Amano, M.; Kuwata-Higashi, N.; Mitsuya, H.; Hataguchi, K.; Fukuhara, K. “A novel entecavir analogue constructing with a spiro[2.4]heptane core structure in the aglycon moiety: its synthesis and evaluation for anti hepatitis B virus activity” *Nucleosides, Nucleotides and Nucleic Acids* **2017**, *36*, 463.
- 3) Kaizaki-Mitsumoto, A.; Hataoka, K.; Funada, M.; Odanaka, Y.; Kumamoto, H.; Numazawa, S. “Pyrolysis of UR-144, a synthetic cannabinoid, augments an affinity to human CB<sub>1</sub> receptor and cannabimimetic effects in mice” *J. Toxicol. Sci.* **2017**, *42*, 335-341.
- 4) Kumamoto, H.; Fukano, M.; Nakano, T.; Iwagami, K.; Takeyama, C.; Kohgo, S.; Imoto, S.; Amano, M.; Kuwata-Higashi, N.; Aoki, M.; Abe, H.; Mitsuya, H.; Fukuhara, K.; Haraguchi, K. “Diastereoselective synthesis of 6''-(*Z*)- and 6'' (*E*)-fluoro analogues of anti-hepatitis B virus agent entecavir and its evaluation of the activity and toxicity profile of the diastereomers” *J. Org. Chem.* **2016**, *81*, 2827-2836.
- 5) Kaizaki-Mitsumoto, A.; Noguchi, N.; Yamaguchi, S.; Odanaka, Y.; Matsubayashi, S.; Kumamoto, H.; Fukuhara, K.; Funada, M.; Wada, K.; Numazawa, S. “Three 25-NBOMe-type drugs, three other phenethylamine-type drugs (251 NBMD, RD34, and escitalopram), eight cathinone derivatives, and a phencyclidine analog MMXE, newly identified in ingredients of drug products before they were sold on the drug market” *Forensic Toxicol.* **2016**, *34*, 108-114.
- 6) Imoto, S.; Kohgo, S.; Tokuda, R.; Kumamoto, H.; Aoki, M.; Amano, M.; Kuwata-Higashi, N.; Mitsuya, H.; Haraguchi, K. “Design, synthesis and evaluation of anti-HBV activity of hybrid molecules of entecavir and adefovir: exomethylene acycloguanine nucleosides and their monophosphate derivatives” *Nucleosides, Nucleotides and Nucleic Acids* **2015**, *34*, 590-602.

[著書]

- 1) Haraguchi, K.; Takeda, S.; Kubota, Y.; Kumamoto, H.; Tanaka, H.; Hamasaki, T.; Baba, M.; Paintsil, E.; Cheng, Y.-C.; Urata, Y. “Next generation anti-HIV agent 4'-ethynylsyntavudine: from the bench to the clinic” *Frontiers in Clinical Drug Research; HIV Vol.1, A. Rahman Ed.* Bentham Science Publishers (2015).

## 2. 主な学会発表

[国内学会]

- 1) 鬼塚健吾、井本修平、山口翔、熊本浩樹、徳田亮、鎌田（東）伸好、前田賢二、原口一広、満屋裕

- 明 ”B型肝炎治療薬を目指した4'置換イソヌクレオシドの合成” 日本薬学会第139年会（千葉）2018年3月
- 2) 林佐奈衣、鎌田伸好、熊本浩樹、村上周子、尾曲克己、五十川正記、前田賢次、満屋裕明、田中靖人 “ヒト肝細胞キメラマウスを用いた長期CFCP投与による抗HBV効果～cccDNAは低下するか？” 第28回抗ウイルス療法学会総会（札幌）2018年6月
  - 3) 熊本浩樹、榎本彩花、鈴木桃子、中城健夫、鄭侑利、井本修平、鎌田（東）伸好、天野将之、青木学、阿部洋、福原潔、満屋裕明、原ロー広 “2'-フルオロBCA誘導体の合成と抗ウイルス作用の評価” 日本薬学会第138年会（金沢）2018年3月
  - 4) 井本修平、徳田亮、鬼塚健吾、鎌田（東）伸好、青木学、熊本浩樹、天野将之、向後悟、前田賢次、満屋裕明、原ロー広 “4'位にアジド基を有する新規核酸アナログの合成と抗ウイルス作用の評価” 第27回抗ウイルス療法学会総会（熊本）2017年5月
  - 5) 林佐奈衣、鎌田伸好、熊本浩樹、村上周子、尾曲克己、五十川正記、前田賢次、満屋裕明、田中靖人 “Entecavirよりも持続的かつ強力に抗HBV活性を有する新規核酸アナログCFCPの同定” 第27回抗ウイルス療法学会総会（熊本）2017年5月
  - 6) 鎌田伸好、林佐奈衣、熊本浩樹、服部真一朗、橋本麻衣、林弘典、松田幸樹、青木学、前田賢次、小田切優樹、田中靖人、満屋裕明 “新規抗HBV薬候補化合物CFCPの*in vitro*ウイルス学・細胞生物学的特性” 第27回抗ウイルス療法学会総会（熊本）2017年5月
  - 7) 井本修平、鬼塚健吾、徳田亮、鎌田（東）伸好、青木学、熊本浩樹、天野将之、向後悟、前田賢次、満屋裕明、原ロー広 “4'位にアジド基を有するヌクレオシド誘導体の合成と抗HBV活性評価” 日本薬学会第137年会（仙台）2017年3月
  - 8) 熊本浩樹、秋川佳美、井本修平、鎌田伸好、青木学、天野将之、向後悟、満屋裕明、福原潔、原ロー広 “5'-ビニルおよびエチニルネプラノシンA類の合成と抗ウイルス作用の評価” 日本薬学会第137年会（仙台）2017年3月
  - 9) 熊本浩樹、深野実里、中野智彦、岩上啓人、竹山千晶、向後悟、井本修平、天野将之、鎌田（東）伸好、青木学、阿部洋、満屋裕明、福原潔、原ロー広 “新規6"-フルオロエンテカビルの立体選択的合成と抗ウイルス作用の評価” 第34回メディシナルケミストリーシンポジウム（つくば）2016年12月
  - 10) 熊本浩樹、深野実里、中野智彦、岩上啓人、竹山千晶、向後悟、井本修平、天野将之、鎌田（東）伸好、青木学、満屋裕明、福原潔、原ロー広 “エキソメチレン部位にフッ素原子を有するエンテカビル誘導体の立体選択的合成と抗HBV作用の評価” 第26回抗ウイルス療法学会総会（名古屋）2016年5月
  - 11) 熊本浩樹、深野実里、中野智彦、岩上啓人、竹山千晶、小田中友紀、向後悟、井本修平、天野将之、鎌田（東）伸好、青木学、満屋裕明、福原潔、原ロー広 “ラジカル反応を基軸とする新規6'-フルオロエンテカビルの合成と抗ウイルス作用の評価” 日本薬学会第136年会（横浜）2016年3月
  - 12) 井本修平、向後悟、徳田亮、熊本浩樹、青木学、天野将之、鎌田（東）伸好、満屋裕明、原ロー広 “エンテカビルとアデホビルのハイブリッド化合物：メチレンアシクロヌクレオシド誘導体の合成と抗HBV活性” 第25回抗ウイルス療法学会総会（東京）（東京）2015年5月
  - 13) 熊本浩樹、深野実里、天野将之、鎌田（東）伸好、原ロー広、満屋裕明、福原潔 “スピロ[2.4]ヘプタン骨格を有する炭素環ヌクレオシドの合成と抗ウイルス作用の評価” 日本薬学会第135年会（神戸）2015年3月
  - 14) 井本修平、向後悟、徳田亮、熊本浩樹、青木学、天野将之、鎌田（東）伸好、満屋裕明、原ロー広 “エンテカビルとアデホビルのハイブリッド化合物：メチレンアシクロヌクレオシド誘導体の合成と抗HBV活性” 日本薬学会第135年会（神戸）2015年3月

### 3. その他特筆すべき研究業績

[特許]

- 1) Mitsuya, H.; Kumamoto, H. “Preparation of carbocyclic nucleoside derivatives having physical activities including anti-viral activity” From PCT Int. Appl. (2018), WO 2018092728 A1 20180524
- 2) Fukuhara, K.; Kumamoto, H.; Higuchi, A.; Tsubota, K. “Preparation of novel stilbene derivatives for the treatment of corneal and conjunctival disease or presbyopia” *Jpn. Kokai Tokkyo koho* **2016**, JP2016050172A 20160411.

[研究費受け入れ状況]

- 1) 平成 29 年度～平成 33 年度 AMED 感染症実用化研究事業 肝炎等克服実用化研究事業 B 型肝炎創薬実用化等研究事業分担研究費「野生型と薬剤耐性 B 型肝炎ウイルスに強力な活性を發揮する新規治療薬」研究分担者：熊本浩樹 平成 30 年度 4,000 千円

## II. 教育業績

### 1. 担当授業科目

- 1) 2018 年度；薬学部第 2 学年「有機化合物としての医薬品 III」講義（15 コマ）  
薬学部第 2 学年「有機化合物としての医薬品 IV」講義（15 コマ）  
薬学部第 6 学年「薬学総合演習 II」演習講義（2 コマ）  
薬学部第 2 学年「有機化学実習」実習
- 2) 2017 年度；薬学部第 6 学年「理論・実践薬学演習」講義（3 コマ）  
薬学部第 2 学年「医薬品の化学 I」実習
- 3) 2016 年度；薬学部第 3 学年「医薬品・生体分子の化学」講義（6 コマ）  
薬学部第 3 学年「ターゲット分子の合成」講義（6 コマ）  
薬学部第 6 学年「理論・実践薬学演習」講義（3 コマ）  
薬学部第 2 学年「医薬品の化学 I」実習
- 4) 2015 年度；薬学部第 3 学年「医薬品・生体分子の化学」講義（6 コマ）  
薬学部第 3 学年「ターゲット分子の合成」講義（6 コマ）  
薬学部第 6 学年「理論・実践薬学演習」講義（3 コマ）  
薬学部第 2 学年「医薬品の化学 I」実習
- 5) 2014 年度；薬学部第 3 学年「医薬品・生体分子の化学」講義（6 コマ）  
薬学部第 3 学年「ターゲット分子の合成」講義（6 コマ）  
薬学部第 6 学年「理論・実践薬学演習」講義（3 コマ）  
薬学部第 2 学年「医薬品の化学 I」実習