

# 生物有機化学研究室

SDGs達成に向けた取り組み

SUSTAINABLE  
DEVELOPMENT  
GOALS

キーワード・研究テーマ / Keywords・Research Themes

## ■ 核酸医薬

Nucleic Acid Therapeutics

## ■ KRAS変異癌治療薬

Drug for KRAS Mutant Cancers

## ■ トリプルネガティブ乳癌治療薬

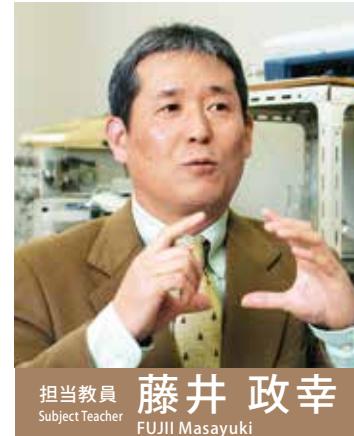
Drug for Triple Negative Breast Cancer

## ■ 多発性硬化症治療薬

Drug for Multiple Sclerosis

## ■ インフルエンザAウイルス感染治療薬

Drug for Influenza A Virus Infection

担当教員  
Subject Teacher藤井 政幸  
FUJII Masayuki

## 核酸マルチコンジュゲートの 新規合成法の開発と高機能核酸医薬への応用

Synthesis of nucleic acid multiple conjugates and application to clinical drugs

## PROFILE

職位 Position 教授・大学院教授 Professor・Professor at Graduate School  
 大学院 Graduate School 生物環境化学コース Biological and Environmental Chemistry Course  
 学位 Degree 博士(理学) Doctor of Science

担当講義科目 Charge of Subjects 生物有機化学、分子遺伝学など  
 Bioorganic Chemistry, Molecular Genetics etc

e-mail mfujii@fuk.kindai.ac.jp

FOR  
MORE

FUJII Masayuki

## 研究概要 / Research Outline

核酸医薬は病気の原因遺伝子に直接働きかけて副作用なく病気を治療する先進医薬です。薬剤耐性癌、未診断稀少疾患などの難病にも応用することが期待されています。

We aim to develop nucleic acid therapeutics which can target and control the expression of the specific disease-causing gene without any side effects.

## 進行中の研究内容 / Research Contents in Progress

Research Contents in Progress

1 核酸マルチコンジュゲートの新規合成法の開発:生体内で働く多彩な機能性分子を集積した核酸マルチコンジュゲート合成法の開発に成功し、標的遺伝子に強く作用する高機能核酸医薬の分子設計を可能にしました。

Novel synthesis of nucleic acid multiple conjugates: We have developed a new approach to nucleic acid multiple conjugates which effectively suppress the target gene expression.

2 難治性疾患治療薬の開発:核酸マルチコンジュゲートを利用してKRAS変異癌、トリプルネガティブ乳癌などの化学療法抵抗性癌、多発性硬化症などの中枢神経未診断疾患などに有効な核酸医薬を開発しています。

Drug for incurable diseases: We are aiming to develop nucleic acid therapeutics for incurable diseases such as KRAS mutant cancers, triple negative breast cancer and multiple sclerosis.

3 立体規則的ホスホチオエート核酸の酵素的合成法:核酸医薬として優れた特性を有するホスホチオエート核酸の酵素的立体選択的合成法の開発をめざしています。

Enzymatic synthesis of stereoregular phosphorothioate nucleic acids: We are aiming to develop a novel method of enzymatic synthesis of stereoregular phosphorothioate nucleic acids.

4 一塩基変異識別定量PCR法:化学修飾プライマーを用いて、癌ドライバー遺伝子や新型コロナウイルスの一塩基変異を識別できるリアルタイムPCR法の開発をめざしています。

Quantitative PCR method discriminating a single base mutation: We are aiming to develop a novel quantitative PCR method which can discriminate a single base mutation using chemically modified primers.

## 最近の研究実績 / Recent Research Results

## &lt;著書/Books&gt;

■ 核酸科学ハンドブック(分担執筆)、(株)講談社サイエンティフィク、監修 杉本直己(2020年1月) 藤井政幸 第2部ペプチド核酸コンジュゲート

Peptide-Nucleic Acid Conjugates, Masayuki Fujii, Chapter 2 (2020) Ed by Naoki Sugimoto, Hand Book of Nucleic Acid Science, Kodansha Scientific Co. Ltd.

■ 中分子医薬開発に資するペプチド・核酸・糖鎖の合成・高機能化技術、(株)シーエムシー出版(2018) 第III編第9章「核酸コンジュゲートの合成」新貝恭広、藤井政幸

Synthesis of peptides, nucleic acids, sugars and their applications. CMC Inc. (2018) Chapter III, Section 9 "Synthesis of Nucleic Acid Conjugates", Yasuhiro Shinkai, Masayuki Fujii.

■ 第5版 マクマリー生物有機化学 菅原二三男監訳、丸善(2018)  
 第4章 生化学エネルギーの発生 藤井政幸  
 第11章 化学メッセンジャー:ホルモン、神経伝達物質、薬物 藤井政幸

McMurry Organic and Biological Chemistry, Maruzen Inc. (2018)  
 Masayuki Fujii  
 Chap 4. Generation of Biological Energy  
 Chap 11. Chemical Messenger: Hormones, Neurotransmitters, Drugs

## &lt;論文/Published Papers&gt;

■ Protein disulfide isomerase A1-associated pathways in the development of stratified breast cancer therapies  
 Emry Yosef Bakter, Masayuki Fujii, Marija Krstic-Demonacos, Constantinos Demonacos, Rashed Alhammad, International Journal of Oncology, 2022, 60 (2):16. doi: 10.3892/ijo.2022.5306.

■ Telomerase Inhibition, Telomere Attrition and Proliferation Arrest of Cancer Cells Induced by Phosphorothioate ASO-NLS Conjugates Targeting hTERT and siRNAs Targeting hTERT  
 Irmina Diala, Yasuo Shiohama, Takashi Fujita, Yojiro Kotake, Constantinos Demonacos, Marija Krstic-Demonacos, Gianpiero Di Leva, Masayuki Fujii  
*Nucleosides, Nucleotides and Nucleic Acids*, 2020, 39, 1-3, 407-425.

■ Silencing of BCR/ABL Chimeric Gene in Human Chronic Myelogenous Leukemia Cell Line K562 by siRNA-Nuclear Export Signal Peptide Conjugates. *Nucleic Acid Therapeutics*, 2017, 27, 168-175.