

平成22年度 研究業績

大野浩章 (京都大学大学院薬学研究科、A02班 公募班員)

1. 発表論文等 (査読付き論文, 著書, 総説等の発表状況)

- (1) Enantioselective Total Synthesis of (+)-Lysergic Acid, (+)-Lysergol, and (+)-Isolysergol by Palladium-Catalyzed Domino Cyclization of Allenes Bearing Amino and Bromoindolyl Groups  
Inuki, S.; Iwata, A.; Oishi, S.; Fujii, N.\*; Ohno, H.\* *J. Org. Chem.* in press.
- (2) Direct Synthesis of Fused-Indoles by Gold-Catalyzed Cascade Cyclization of Diynes  
Hirano, K.; Inaba, Y.; Takahashi, N.; Shimano, M.; Oishi, S.; Fujii, N.\*; Ohno, H.\* *J. Org. Chem.* **2011**, *76*, 1212–1227.
- (3) Direct Synthesis of Quinazolines through Copper-Catalyzed Domino C–H Alkynylation and Cyclization of Aniline-Derived Benzamidines  
Ohta, Y.; Tokimizu, Y.; Oishi, S.; Fujii, N.\*; Ohno, H.\* *Org. Lett.* **2010**, *12*, 3963–3965.
- (4) Stereoselective Divergent Synthesis of Four Diastereomers of Pachastrissamine (Jaspine B)  
Yoshimitsu, Y.; Inuki, S.; Oishi, S.; Fujii, N.\*; Ohno, H.\* *J. Org. Chem.* **2010**, *75*, 3843–3846.
- (5) Ring-Construction/Stereoselective Functionalization Cascade: Total Synthesis of Pachastrissamine (Jaspine B) through Palladium-Catalyzed Bis-cyclization of Propargyl Chlorides and Carbonates  
Inuki, S.; Yoshimitsu, Y.; Oishi, S.; Fujii, N.\*; Ohno, H.\* *J. Org. Chem.* **2010**, *75*, 3831–3842.
- (6) Construction of Linked Nitrogen Heterocycles by Palladium(0)-Catalyzed Intramolecular Domino Cyclization of 2-Alkynylaziridines Bearing a 2-Aminoethyl Group via Ring Expansion with Isocyanate  
Okano, A.; Oishi, S.; Tanaka, T.; Fujii, N.\*; Ohno, H.\* *J. Org. Chem.* **2010**, *75*, 3396–3400.
- (7) Synthesis of Fused and Linked Bicyclic Nitrogen Heterocycles by Palladium-Catalyzed Domino Cyclization of Propargyl Bromides  
Okano, A.; Tsukamoto, K.; Kosaka, S.; Maeda, H.; Oishi, S.; Tanaka, T.\*; Fujii, N.\*; Ohno, H.\* *Chem. Eur. J.* **2010**, *16*, 8410–8418.

- (8) Gold-Catalyzed Intramolecular Alkyne Cycloisomerization Cascade: Direct Synthesis of Aryl-Annulated[a]carbazoles from Aniline-Substituted Diethynylarenes  
Hirano, K.; Inaba, Y.; Watanabe, T.; Oishi, S.; Fujii, N.\*; Ohno, H.\* *Adv. Synth. Catal.* **2010**, 352, 368–372.
- (9) Efficient Synthesis of Pyrimido[1,2-c][1,3]benzothiazin-6-imines and Related Tricyclic Heterocycles by S<sub>N</sub>Ar-Type C-S, C-N, or C-O Bond Formation with Heterocumulenes  
Mizuhara, T.; Oishi, S.; Fujii, N.\*; Ohno, H.\* *J. Org. Chem.* **2010**, 75, 265–268.

## 2. 学会発表等（国内外の招待講演および国際会議での発表状況）

- (1) 触媒的連続結合形成反応による縮環型複素環骨格の挙構築と天然物合成への応用  
大野浩章, 6th Organic Syntheses Lectureship, 東京大学大学院薬学研究科, 東京, 2011.2.22 (招待講演).
- (2) 触媒的連続結合形成反応による複素環骨格構築法の開発研究  
大野浩章, 京都大学グローバル COE 有機若手ワークショップ, 京都大学院理学研究科セミナーハウス, 京都, 2010.9.13-14 (招待講演).
- (3) Ring-Construction/Stereoselective Functionalization Cascade: Total Synthesis of Pachastrissamine (Jaspine B) through Palladium-Catalyzed Bis-cyclization of Bromoallenes and Propargyl Carbonates  
Inuki, S.; Yoshimitsu, Y.; Oishi, S.; Fujii, N.; Ohno, H. The 5th Seoul-Kyoto-Osaka Joint Symposium on Pharmaceutical Sciences for Young Scientists, Osaka University, Osaka, Japan, 2010.5.20-21 (口頭発表).

## 3. 特許

- (1) キナーゼ阻害剤  
国立大学法人京都大学, 学校法人近畿大学, 公立大学法人大阪府立大学, 辻本豪三, 平澤明, 村田克美, 藤井信孝, 大野浩章, 大石真也, 鈴木大和, 侯増燁, 仲西功, 木下誉富  
特願 2011-48325, 2011.3.4

#### 4. 学会・シンポジウム等の開催状況

- (1) 第8回次世代を担う有機化学シンポジウム, 日本薬学会長井記念ホール, 2010.5.13-14 (大野浩章, 実行委員長).

#### 5. 受賞等

- (1) 太田悠介 (2010年3月博士課程修了)  
Springer Theses Award ドイツ Springer 社, 2010.4.7

#### 6. 新聞報道等

該当事項はありません.

#### 7. 領域内の共同研究の準備・実施状況とその成果

- (1) 共同研究先: 京都大学, 高須研究室 (A02 班, 公募班員)  
派遣人員 (派遣): 稲葉祐介 (修士2年)  
派遣期間 (派遣): 2010.11.24-2010.11.25  
共同研究内容: 高度縮環型カルバゾールの結晶構造解析  
成果: 論文作成中
- (2) 共同研究先: 京都大学, 高須研究室 (A02 班, 公募班員)  
派遣人員 (受入): 進藤直哉 (博士3年)  
派遣期間 (受入): 2011.1.11-2011.1.13  
共同研究内容: 動的不斉をもつ不飽和カルボニル型化合物の円二色性スペクトル  
成果: 論文作成中

#### 8. その他特記事項

該当事項はありません.