

## 平成23年度 研究業績

高須清誠 (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) Acid-Catalyzed [2 + 2] Cycloaddition at Room-Temperature with Suppression of Side Reactions by Using a Flow Microreactor System  
Kurahashi, K.; Takemoto, Y.; Takasu, K.\* *ChemSusChem* **2012**, 5, 270-273.
- (2) Formal (3 + 3) Cycloaddition of Silyl Enol Ethers Catalyzed by Trifric Imide: Domino Michael Addition-Claisen Condensation Accompanied with Isomerization of Silyl Enol Ethers  
Azuma, T.; Takemoto, Y.\*; Takasu, K.\* *Chem. Pharm. Bull.* **2011**, 1190-1193.
- (3) Catalyst-Controlled Torquoselectivity Switch in the  $4\pi$  Ring-Opening Reaction of 2-Amino-2-azetines Giving  $\beta$ -Substituted  $\alpha,\beta$ -Unsaturated Amidines  
Shindoh, N.; Kitaura, K.; Takemoto, Y.\*; Takasu, K.\* *J. Am. Chem. Soc.* **2011**, 133, 8470-8473.
- (4) Unprecedented Synthesis of *N,N*-Divinylamines by  $\text{TiF}_2\text{NH}$ -Catalyzed Reaction of Ynamide with Ketimine  
Shindoh, N.; Takemoto, Y.\*; Takasu, K.\* *Heterocycles* **2011**, 82, 1133-1136.
- (5) Gold(I)-Catalyzed Polycyclizations of Polyenyne-Type Anilines Based on Hydroamination and Consecutive Hydroarylation Cascade  
Hirano, K.; Inaba, Y.; Takasu, K.; Oishi, S.; Takemoto, Y.; Fujii, N.; Ohno, H.\* *J. Org. Chem.* **2011**, 76, 9068-9080.
- (6) Thiourea, *N*-[3,5-Bis(trifluoromethyl)phenyl]-*N'*-[(1*R*,2*R*)-2-(dimethylamino)cyclohexyl]-  
Takasu, K.\*; Takemoto, Y.\* *Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis* (Wiley), in press.
- (7) 軸性不斉をもつアミジンの触媒的不斉合成法の開発とキラル合成素子としての活用  
高須清誠\*, 薬学研究の進歩, **2011**, 31-36.
- (8) 原虫オルガネラの固有環境認識を基盤とした抗マラリア活性物質の創製  
高須清誠\*, ナノバイオ技術と創薬研究 (佐治英郎ら編)、メディカルドゥ (2012年)、72-77 ページ

### 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) 触媒制御での  $4\pi$  電子環状反応における回転選択性の逆転: 不飽和アミジンの立体選択的合成  
高須清誠, 平成23年度化学系学協会東北大会: 有機化学コロキウム, 仙台, 2011.9.17-18 (招待講演、口頭発表)

- (2) シクロブタンの合成化学：反応開発から生体機能性分子への応用まで  
高須清誠, 京都府立大学生命分子化学科セミナー・鴨叡会セミナー, 京都,  
2012.1.31 (招待講演、口頭発表)
- (3) 小員環の反応性を利用した低pH応答DNA切断分子の設計と合成  
高須清誠, 日本化学会第92春季年会「特別企画：有機合成化学を起点とするもの  
づくり戦略」, 横浜, 2012.3.24-27 (招待講演、口頭発表)
- (4) Synthesis of Kopsinine by Asymmetric Conjugate Amination–Alkylation–Annulation  
Process  
Harada, S.; Sakai, T.; Yamada, K.; Takasu, K.; Yamamoto, Y.; Tomioka, K. 5th  
ChemComm International Symposium, Kyoto, 2011.5.16 (ポスター発表)
- (5) NHC-Catalyzed Chemoselective Amidation of Amines with Aliphatic aldehydes  
Kuwano, S.; Takasu, K.; Yamada, K. 5th ChemComm International Symposium, Kyoto,  
2011.5.16 (ポスター発表)
- (6) Stereocotrolled Synthesis of Spirocyclopropanes from Fused-cyclobutanols by Ring  
Contraction  
Nagamoto, Y.; Takasu, K.; Takamoto, K. 5th ChemComm International Symposium,  
Kyoto, 2011.5.16 (ポスター発表)
- (7) Waste-minimized Enol Silylation Catalyzed by A Triflimide-amine Co-catalyst  
Takasu, K.; Kurahashi, K.; Takemoto, Y. The Second International Symposium on  
Process Chemistry (ISPC-2011), Kyoto, 2011.8.10-12 (口頭発表)
- (8) Diastereoselectivity Switch in the EtAlCl<sub>2</sub>-catalyzed (2 + 2) Cycloaddition of Silyl Enol  
Ethers  
Hata, K.; Takemoto, Y.; Takasu, K. 7th International Symposium on Integrated Synthesis  
(ISIS-7), Kobe, 2011.10.9-10 (ポスター発表)
- (9) Chemoselective Conversion of  $\alpha$ -branched Aldehyde to Amine, Ester and Carboxylic Acid  
by NHC-Catalysis  
Kuwano, S.; Yamada, K.; Takasu, K. 1st Germany-Japan Organocatalytic Symposium  
(GJOS-1), Kyoto, 2011.10.14-15 (ポスター発表)
- (10) Tf<sub>2</sub>NH-Catalyzed Domino Reaction of Ynamides with Imines: Synthesis of  
 $\alpha,\beta$ -Unsaturated Amidines and Quinolines  
Takasu, K. Kuroda, Y.; Shindoh, N.; Takemoto, Y. 1st Germany-Japan Organocatalytic  
Symposium (GJOS-1), Kyoto, 2011.10.14-15 (ポスター発表)
- (11) Halide-Free Enol Silylation Catalyzed by A Triflic Imide-Amine Co-catalyst  
Takasu, K.; Kurahashi, K.; Takamoto, K. 8th AFMC International Medicinal Chemistry  
Symposium (AIMECS08), Tokyo, 2011.11.29-12.2 (ポスター発表)

- (12) Development of low pH-induced DNA cleaving agents based on a ring contraction rearrangement  
Nagamoto, Y.; Takemoto, Y.; Takasu, K. 8th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (AIMECS08), Tokyo, 2011.11.29-12.2 (ポスター発表)
- (13) Temperature Dependent High Performance of N-Boc-imine in Triethylborane-Mediated Tin-Free Radical Pivaloyloxymethylation  
Yamada, K.; Konishi, T.; Nakano, M.; Takasu, K.; Tomioka, K. 8th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (AIMECS08), Tokyo, 2011.11.29-12.2 (ポスター発表)
- (14) NHC-Controlled N,O-Selectivity in the Chemoselective Conversion of Primary Aldehyde to Amide, Ester, and Carboxylic Acid  
Kuwano, S.; Yamada, K.; Takasu, K. 8th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (AIMECS08), Tokyo, 2011.11.29-12.2 (ポスター発表)
- (15) A Potentially New Access to Octahydro-Indolizine Alkaloids  
Oriez, R.; Tomioka, K.; Yamada, K.; Takasu, K. 8th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (AIMECS08), Tokyo, 2011.11.29-12.2 (ポスター発表)
- (16) Formal (3 + 3) Cycloaddition of Silyl Enol Ethers Catalyzed by Trifric Imide: Domino Michael Addition—Claisen Condensation  
Azuma, T.; Takemoto, Y.; Takasu, K. 8th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (AIMECS08), Tokyo, 2011.11.29-12.2 (ポスター発表)

### 3. 特許

- (1) シリルエノールエーテル類の製造法  
国立大学法人京都大学, 高須清誠, 竹本佳司, 倉橋慧  
WO2011108661 (特願 2010-48290), 2011.3.2 出願

### 4. 学会・シンポジウム等の開催状況

- (1) (予定) 日本プロセス化学会サマーシンポジウム, 京都, 2012.7.19-20 (高須清誠, 世話人).
- (2) (予定) 第42回複素環化学討論会, 京都, 2012.10.11-13 (高須清誠, 事務局).
- (3) (予定) 第48回天然物化学談話会, 長浜, 2013.7 (高須清誠, 実行委員長).
- (4) (予定) 第55回天然有機化合物討論会, 京都, 2013.9 (高須清誠, 世話人).

## 5. 受賞等

(1) 原田慎吾 (博士 2 年)

Poster Award, 5th ChemComm International Symposium, 2011.5.16

(2) 山田健一 (准教授)

第 9 回有機合成化学協会関西支部賞, 有機合成化学協会関西支部, 2011.10.28

(3) 倉橋慧 (修士 2 年)

優秀発表賞, 第 37 回反応と合成の進歩シンポジウム, 2011.11.8

(4) 永本祐樹 (博士 2 年)

ポスター賞, 第 37 回有機合成若手セミナー, 2011.11.16

## 6. 新聞報道等

該当なし

## 7. 国民との科学・技術対話

該当なし

## 8. 領域内の共同研究の準備・実施状況とその成果

なし