

平成24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) Critical profiles of chiral diether-mediated asymmetric conjugate aminolithiation of enoate with lithium amide as a key to the total synthesis of (-)-kopsinine
Harada, S.; Sakai, T.; Takasu, K.; Yamada, K.; Tomioka, K. * *Tetrahedron* **2013**, *ASAP*.
- (2) pH-sensitive DNA cleaving agents: in situ activation by ring contraction of benzo-fused cyclobutanols
Nagamoto, Y.; Hattori, A.; Kakeya, H.; Takemoto, Y.; Takasu, K. * *Chem. Commun.* **2013**, *49*, 2622-2624.
- (3) Study of Ring-Opening Reaction of Spiro[5.2]octenes with Aqueous Hydro-halic Acid: Substituent Effect on the Regioselectivity
Nagamoto, Y.; Takemoto, Y.; Takasu, K. * *Synlett* **2013**, *24*, 120-124.
- (4) Total Synthesis of (+)-*trans*-Dihydronarciclasine Utilizing Asymmetric Conjugate Addition
Yamada, K.; Mogi, Y.; Mohamed, M. A.; Takasu, K.; Tomioka, K. * *Org. Lett.* **2012**, *14*, 5868-5871.
- (5) Total Synthesis of (-)-Kopsinine by an Asymmetric One-Pot [N+2+3] Cyclization
Harada, S.; Sakai, T.; Takasu, K.; Yamada, K.; Tomioka, K. * *Chem. Asian J.* **2012**, *7*, 2196-2198.
- (6) General Entry to Asymmetric One-Pot [N + 2 + n] Cyclization for the Synthesis of Three- to Seven-Membered Azacycloalkanes
Harada, S.; Sakai, T.; Takasu, K.; Yamada, K.; Tomioka, K. * *J. Org. Chem.* **2012**, *77*, 7212-7222.
- (7) Facile Isomerization of Silyl Enol Ethers Catalyzed by Triflic Imide and Its Application to One-pot Isomerization-(2 + 2) Cycloaddition
Inanaga, K.; Ogawa, Y.; Nagamoto, Y.; Daigaku, A.; Tokuyama, H.; Takemoto, Y.; Takasu, K. * *Beilstein J. Org. Chem.* **2012**, *8*, 658-661.
- (8) 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.

- (9) Reactions involving an α,β -Unsaturated Carbonyl Compound as Electrophilic Component with [2+2] Cycloaddition as the Key Step
Takasu, K.*
In *Science of Synthesis (Multicomponent Reactions)*, in press.
- (10) Heterogeneous Reactions
Takasu, K.*
In *Microreactors in Organic Chemistry and Catalysis, 2nd edition*, ed by Wirth, T. Wiley-VCH, **2013**, pp. 151-196.
- (11) 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**, pp.72-77.
- (12) Thiourea, *N*-[3,5-Bis(trifluoromethyl)phenyl]-*N'*-[(1*R*,2*R*)-2-(dimethylamino)cyclohexyl]
Takasu, K.*; Takemoto, Y.
In *Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis* (Wiley), **2012**. DOI: 10.1002/047084289X.rn01414

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) シクロブタンの合成化学：反応開発から天然物合成の応用まで
高須清誠, 関西学院大学工学部講演会・関学有機化学セミナー, 兵庫, 2012.4.21 (招待講演、口頭発表) .
- (2) 多置換シクロブタンの合成化学：多成分反応および天然物合成への応用
高須清誠, 近畿化学協会・第二回悠化会セミナー, 大阪, 2012.5.24 (招待講演、口頭発表) .
- (3) Chemoselective conversion of α -unbranched aldehydes to amides, esters, and carboxylic acids by NHC-catalysis
Kuwano, S.; Yamaoka, Y.; Takasu, K.; Yamada, K.; The 7th SKO Joint Symposium for Young Scientists, Kyoto, 2012.5.24-25 (招待講演、口頭発表) .
- (4) シクロブタンの合成化学：反応開発から機能性分子合成まで
高須清誠, 九州大学先導物質研究所セミナー, 福岡, 2012.6.25 (招待講演、口頭発表) .
- (5) シクロブタンの合成化学：反応開発から機能性分子合成まで
高須清誠, 九州大学大学院理学研究科講演会, 福岡, 2012.6.26 (招待講演、口頭発表) .

- (6) Syntheses of Heterocycles by Asymmetric Conjugate Amination-Alkylation-Annulation Process
Harada, S.; Yamada, K.; Takasu, K.; Tomioka, K.; 19th International Conference on Organic Synthesis (ICOS-19), Melbourn, 2012.7.1-6 (ポスター発表) .
- (7) NHC-Controlled N,O-Selectivity in the Chemoselective Conversion of Primary Alkyl Aldehyde to Carboxylic Acid Derivatives
Kuwano, S.; Yamada, K.; Takasu, K.; 19th International Conference on Organic Synthesis (ICOS-19), Melbourn, 2012.7.1-6 (ポスター発表) .
- (8) Synthesis of Steroid Derivatives Bearing A Small Ring on the D-Ring by Utilizing EtAlCl₂-catalyzed (2 + 2) Cycloaddition
Takasu, K.; Hata, K.; Takemoto, Y.; 19th International Conference on Organic Synthesis (ICOS-19), Melbourn, 2012.7.1-6 (ポスター発表) .
- (9) シリルエノールエーテルに関連する反応開発とマイクロリアクター合成の利用
高須清誠, フローマイクロ合成研究会第26回公開講演会, 大阪, 2012.8.3 (招待講演、口頭発表) .
- (10) Radical One-Pot α,β -Dual and β -Mono Oxymethylation of Alkylidenemalonate
山田健一, 小西健人, 仲野真由, 山岡庸介, 高須清誠, 山本康友, 富岡清, 第6回武田科学振興財団薬科学シンポジウム, 大阪, 2012.9.13-14 (ポスター発表) .
- (11) Syntheses of Multicyclic Quinolines toward the Total Syntheses of Marinoquinolines
山岡庸介, 吉田琢紘, 山田健一, 高須清誠, 第6回武田科学振興財団薬科学シンポジウム, 大阪, 2012.9.13-14 (口頭発表) .
- (12) The First Chiral Brønsted Acid-Catalyzed Kinetic Resolution of Secondary Alcohol
原田慎吾, 山岡庸介, 山田健一, 高須清誠, 第6回武田科学振興財団薬科学シンポジウム, 大阪, 2012.9.13-14 (ポスター発表) .
- (13) Kinetic Resolution of Secondary Alcohols by NHC Catalyzed Esterification
鍬野哲, 山岡庸介, 高須清誠, 山田健一, 第6回武田科学振興財団薬科学シンポジウム, 大阪, 2012.9.13-14 (ポスター発表) .
- (14) Total Synthesis of (+)-trans-Dihydronarciclasine
茂木雄三, Magdi A. Mohamed, 高須清誠, 山田健一, 富岡清, 第6回武田科学振興財団薬科学シンポジウム, 大阪, 2012.9.13-14 (ポスター発表) .
- (15) Synthesis of Estrone Derivatives in the Conformational Control of D-Ring Side Chain
有地法人, 畑健二, 竹本佳司, 山田健一, 山岡庸介, 高須清誠, 第6回武田科学振興財団薬科学シンポジウム, 大阪, 2012.9.13-14 (ポスター発表) .

- (16) Waste-Minimized Silyl Enol Etherification Catalyzed by Brønsted Acid- Base Co-catalyst
高須清誠, 倉橋慧, 山岡庸介, 竹本佳司, 第6回武田科学振興財団薬科学シンポジウム,
大阪, 2012.9.13-14 (ポスター発表) .
- (17) 小員環の特性を活用する 刺激応答プロドラッグの創製
高須清誠, アステラス病態代謝研究会 第43回研究報告会, 東京, 2012.10.20 (招待
講演、口頭発表) .
- (18) The First Chiral Brønsted Acid-Catalyzed Kinetic Resolution of Secondary Alcohol
Harada, S.; Yamaoka, Y.; Yamada, K.; Takasu, K.; IKCOC-12 The Twelfth International
Kyoto Conference on New Aspects of Organic Chemistry, Kyoto, 2012.11.12-16 (ポスター
発表) .
- (19) 小員環の有機化学-分子ひずみエネルギーの付加と解消をどう利用するか-
高須清誠, 徳島大学HBS研セミナー, 徳島, 2012.12.17 (招待講演、口頭発表) .

3. 特許

- (1) ピペラジン誘導体およびその用途
国立大学法人京都大学, 株式会社京都コンステラ・テクノロジーズ, 神戸天然物
化学株式会社, 高須清誠, 奥野恭史, 瀬木恵理, 原貴史, 山本佳宏, 金井千里,
吉川達也, 関正博, 河野晋哉
特願 2012-177572, 2012.8.9.

4. 学会・シンポジウム等の開催状況

- (1) 日本プロセス化学会 2012 サマーシンポジウム, 京都テルサ, 2012.7.19-20 (高須清
誠, 世話人代表).
- (2) 第42回複素環化学討論会, 京都テルサ, 2012.10.11-13. (高須清誠, 事務局).

5. 受賞等

- (1) 原田慎吾 (博士3年)
2012年度日本薬学会近畿支部奨励賞、日本薬学会近畿支部、2012.10.20.

6. 新聞報道等

なし

7. 国民との科学・技術対話

1. 京都大学薬学部オープンキャンパス（2012.8.10.）にて模擬講義（講演タイトル：くすりと有機化学）を行った。対象は高校生および高校卒業者であり、約200人の参加であった。アンケートは出席者対象にオープンキャンパス行事全体で行っており、模擬授業は大学の講義の一端に触れたということでおおむね好評であった。その後、研究室にて小グループ（20名）対象に、実験体験を行った。
2. スーパーサイエンスハイスクール（滋賀県立膳所高校および京都府立日吉高校）の学生が各1名ずつの訪問があり、大学・大学院における最先端の有機化学研究について概説した。アンケートは実施していない。

8. 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：大阪大学，神戸研究室（A01班，公募班員）

派遣人員（派遣）：有地法人（博士後期1年）

派遣期間（派遣）：2012.6.26, 2010.6.27, 2010.6.29

共同研究内容：生理活性物質合成のために、神戸研究室で開発したNiならびにCu触媒によるカップリング反応の実験手技の習得およびディスカッション

共同研究成果：研究進行中