

研究期間全年度 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) Synthesis and Properties of Chiral Thioureas Bearing an Additional Function at a Remote Position Tethered by a 1,5-Disubstituted Triazole
Takasu, K. *; Azuma, T.; Enkhtaivan, I.; Takemoto, Y. *Molecules*, **2010**, *15*, 8327-8348.
- (2) Catalytic Asymmetric Synthesis of Both Enantiomers of 4-Substituted 1,4-Dihydropyridines with the Use of Bifunctional Thiourea-Ammonium Salts Bearing Different Counter Ions
Yoshida, K.; Inokuma, T.; Takasu, K.; Takemoto, Y. * *Molecules*, **2010**, *15*, 8305-8326.
- (3) Enantioselective Total Synthesis of (-)- and (+)-Petrosin
Toya, H.; Okano, K.; Takasu, K.; Ihara, M.; Takahashi, A.; Tanaka H.; Tokuyama, H. * *Org. Lett.* **2010**, *12*, 5196-5199
- (4) Auto-tandem Catalysis: Facile Synthesis of Substituted Alkylidenecyclohexanones by Domino (4 + 2) Cycloaddition-Elimination Reaction
Takasu, K. *; Tanaka, T.; Azuma, T.; Takemoto, Y. *Chem. Commun.* **2010**, *46*, 8246-8248.
- (5) Stereocontrolled Synthesis of Spiro[n.2]alkenes by Ring Contraction of Fused-Cyclobutanols
Takasu, K. *; Nagamoto, Y.; Takemoto, Y. *Chem. Eur. J.* **2010**, *16*, 8427-8432.
- (6) Selective Accumulation of Rhodacyanine in the Plasmodial Mitochondria is Related to the Growth Inhibition of Malaria Parasites
Morisaki, D.; Kim, H.-S.; Inoue, H.; Terauchi, H.; Kuge, S.; Naganuma, A.; Tokuyama, H.; Ihara, M.; Takasu, K. * *Chem. Sci.* **2010**, *1*, 206-209.
- (7) Brønsted Acid—Thiourea Co-catalysis: Asymmetric Synthesis of Functionalized 1,4-Dihydropyridines from β -Enaminoesters and α,β -Unsaturated Aldehydes
Yoshida, K.; Inokuma, T.; Takasu, K.; Takemoto, Y. * *Synlett* **2010**, 1865-1869.
- (8) Synthesis of Trifunctional Thioureas Bearing 1,5-Disubstituted Triazole Tether by Ru-Catalyzed Huisgen Cycloaddition
Takasu, K. *; Azuma, T.; Takemoto, Y. * *Tetrahedron Lett.* **2010**, *51*, 2737-2740.
- (9) Total Synthesis of (\pm)-Lepadiformine A via Radical Translocation/Cyclization Reaction
Fujitani, M.; Tsuchiya, M.; Okano, K.; Takasu, K.; Ihara, M.; Tokuyama, H. * *Synlett* **2010**, 822-826.
- (10) Fluorinated Rhodacyanine (SJL-01) Possessing High Efficacy for Visceral Leishmaniasis (VL)

- Yang, M.; Arai, C.; Baker, Md. A.; Lu, J.; Ge, J.-F.; Pudhom, K.; Takasu, K.; Kasai, K.; Kaiser, M.; Brun, R.; Yardley, B.; Itoh, I.; Ihara, M.* *J. Med. Chem.* **2010**, *53*, 368-373.
- (11) 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.
- (12) 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.
- (13) Catalyst-Controlled Torquoselectivity Switch in the 4π Ring-Opening Reaction of 2-Amino-2-azetines Giving β -Substituted α,β -Unsaturated Amidines
Shindoh, N.; Kitaura, K.; Takemoto, Y.*; Takasu, K.* *J. Am. Chem. Soc.* **2011**, *133*, 8470-8473.
- (14) Unprecedented Synthesis of *N,N*-Divinylamines by Ti_2NH -Catalyzed Reaction of Ynamide with Ketimine
Shindoh, N.; Takemoto, Y.*; Takasu, K.* *Heterocycles* **2011**, *82*, 1133-1136.
- (15) 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.
- (16) 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), **2012**. (10.1002/047084289X.rm01414).
- (17) 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)、pp 72-77.
- (18) 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.
- (19) 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.
- (20) 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.

- (21) 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.
- (22) 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.
- (23) 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)*, 2013, Thieme, pp.195-210..
- (24) Heterogeneous Reactions
Takasu, K. * In *Microreactors in Organic Chemistry and Catalysis, 2nd edition*, Wirth, T. Ed.; Wiley-VCH: Weinheim, **2013**; pp. 151-196.
- (25) 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**, *69*, 3264-3273.
- (26) pH-sensitive DNA cleaving agents: in situ activation by ring contraction of benzo-fused cyclobutanols
Nagamoto, Y.; Hattori, A.; Takeya, H.; Takemoto, Y.; Takasu, K. * *Chem. Commun.* **2013**, *49*, 2622-2624.
- (27) 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.
- (28) Enhanced Rate and Selectivity by Carboxylate Salt as a Basic Co-catalyst in Chiral *N*-Heterocyclic Carbene-Catalyzed Asymmetric Acylation of Secondary Alcohols
Kuwano, S.; Harada, S.; Kang, B.; Raphael, O.; Yamaoka, Y.; Takasu, K. * ; Yamada, K. * *J. Am. Chem. Soc.* **2013**, *135*, 11485-11488. (10.1021/ja4055838)
- (29) Chiral Phosphoric Acid-Catalyzed Kinetic Resolution of Secondary Alcohols
Harada, S.; Kuwano, S.; Yamaoka, Y.; Yamada, K. * ; Takasu, K. * *Angew. Chem. Int. Ed.* **2013**, *52*, 10227-10230. (10.1002/anie.201304281)
- (30) Synthesis of 2,3,4,5-Tetra-substituted Pyrroles via a Base-Promoted Double Michael Reaction of Oxime-enoates with Nitroolefins

- Kuroda, Y.; Imaizumi, K.; Yamada, K.; Yamaoka, Y.; Takasu, K. * *Tetrahedron Lett.* **2013**, *54*, 4073-4075.
- (31) Selective Synthesis of Poly-Substituted Dihydroquinolines and α,β -Unsaturated Amidines by A Catalytic Reaction of Ynamides with Ketimines
Kuroda, Y.; Shindoh, N.; Takemoto, Y.; Takasu, K. * *Synthesis* **2013**, *45*, 2318-2326.
(10.1055/s-0033-1339191)
- (32) Synthesis of Functionalized Polycyclic Aromatic Compounds via a Formal [2+2]-cycloaddition
Nagamoto, Y.; Yamaoka, Y.; Fujimura, S.; Takemoto, Y.; Takasu, K. * *Org. Lett.* **2014**, *16*, 1008-1011. (10.1021/ol403757e)
- (33) Catalytic [2+2] Cycloaddition of Silyl Enol Ethers
Yamaoka, Y. and Takasu, K. * In *Methods and Applications of Cycloaddition Reactions in Organic Syntheses*; Nishiwaki, N. Ed.; Wiley, New York, 2014; pp.115-134.

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) Synthesis of Chiral Thioureas Bearing an Additional Function at a Remote Position Tethered by 1,5-Disubstituted Triazole
Takasu, K.; Azuma, T.; Takemoto, Y., The 11th French-Japanese Symposium on Medicinal and Fine Chemistry, Kyoto, Japan, 2010.5.9-12 (ポスター発表) .
- (2) Asymmetric Synthesis of 3,4- and 2,3,4-Substituted 1,4-Dihydropyridines
Yoshida, K.; Inokuma, T.; Takasu, K.; Takemoto, Y., The 11th French-Japanese Symposium on Medicinal and Fine Chemistry, Kyoto, Japan, 2010.5.9-12 (ポスター発表) .
- (3) Atropisomerism of α,β -Unsaturated Amidines: Stereoselective Synthesis by Catalytic Cascade Reaction and Optical Resolution
Shindoh, N.; Takemoto, Y.; Takasu, K., 5th Seoul-Osaka-Kyoto Joint Symposium, Osaka, Japan, 2010.5.20-21 (口頭発表) .
- (4) Atropisomerism of α,β -Unsaturated Amidines: Stereoselective Synthesis.
Takasu, K.; Shindoh, N.; Takemoto, Y., 22nd International Symposium on Chirality, Sapporo, Japan, 2010.7.12-15 (口頭発表) .
- (5) Catalytic Synthesis of Silyl Enol Ethers by Bronsted Acid-Base Catalysis.
Takasu, K.; Kurahashi, K.; Takemoto, Y. 18th International Conference on Organic Synthesis, Bergen, Norway, 2010.8.1-6 (口頭発表) .
- (6) Stereoselective Synthesis and Optical Resolution of Axially Chiral α,β -Unsaturated Amidines

- Shindoh, N.; Takemoto, Y.; Takasu, K., 18th International Conference on Organic Synthesis, Bergen, Norway, 2010.8.1-6 (ポスター発表).
- (7) Total Synthesis of (-) and (+)-Petrosin
Toya, H.; Okano, K.; Takahashi, A.; Tanaka, H.; Takasu, K.; Ihara, M.; Tokuyama, H.. Tohoku University Global COE Program Summer School, Sendai, Japan, 2010.8.19-20 (依頼講演、口頭発表).
- (8) Synthetic Studies on (-)-Historionicotoxin
Daigaku, A.; Okano, K.; Takasu, K.; Tokuyama, H., Tohoku University Global COE Program Summer School, Sendai, Japan, 2010.8.19-20 (ポスター発表).
- (9) Halide-Free Silyl Enol Etherification Catalyzed by Brønsted Acid-Base Co-Catalyst
Takasu, K.; Kurahashi, K.; Takemoto, Y., The Sixth International Symposium on Integrated Synthesis, Kobe, Japan, 2010.10.23-24 (ポスター発表).
- (10) Total Synthesis of (-)- and (+)-Petrosin
Toya, H.; Okano, K.; Takasu, K.; Ihara, M.; Tokuyama, H., The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (ポスター発表).
- (11) 触媒制御での 4π 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)
- (12) 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)
- (13) 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)
- (14) 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)
- (15) NHC-Catalyzed Chemoselective Amidation of Amines with Aliphatic aldehydes
Kuвано, S.; Takasu, K.; Yamada, K. 5th ChemComm International Symposium, Kyoto, 2011.5.16 (ポスター発表)
- (16) 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)

- (17) Waste-minimized Enol Silylation Catalyzed by A Triflimide-amine Co-catalyst
Takasu, K.; Kurahashi, K.; Takamoto, Y. The Second International Symposium on Process Chemistry (ISPC-2011), Kyoto, 2011.8.10-12 (口頭発表)
- (18) Diastereoselectivity Switch in the EtAlCl₂-catalyzed (2 + 2) Cycloaddition of Silyl Enol Ethers
Hata, K.; Takamoto, Y.; Takasu, K. 7th International Symposium on Integrated Synthesis (ISIS-7), Kobe, 2011.10.9-10 (ポスター発表)
- (19) Chemoselective Conversion of α -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)
- (20) Tf₂NH-Catalyzed Domino Reaction of Ynamides with Imines: Synthesis of α,β -Unsaturated Amidines and Quinolines
Takasu, K. Kuroda, Y.; Shindoh, N.; Takamoto, Y. 1st Germany-Japan Organocatalytic Symposium (GJOS-1), Kyoto, 2011.10.14-15 (ポスター発表)
- (21) 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)
- (22) Development of low pH-induced DNA cleaving agents based on a ring contraction rearrangement
Nagamoto, Y.; Takamoto, Y.; Takasu, K. 8th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (AIMECS08), Tokyo, 2011.11.29-12.2 (ポスター発表)
- (23) 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)
- (24) 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)
- (25) 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)

- (26) 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)
- (27) 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)
- (28) 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)
- (29) 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)
- (30) 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)
- (31) 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)
- (32) 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), Melbourne, 2012.7.1-6 (ポスター発表)
- (33) 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), Melbourne, 2012.7.1-6 (ポスター発表)
- (34) 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), Melbourne, 2012.7.1-6 (ポスター発表).
- (35) 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).
- (36) 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).

- (37) 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).
- (38) 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).
- (39) Kinetic Resolution of Secondary Alcohols by NHC Catalyzed Esterification
鎌野哲,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).
- (40) 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).
- (41) 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).
- (42) 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).
- (43) 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 (依頼講演、口頭発表).
- (44) 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).
- (45) 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).
- (46) Chiral Phosphoric Acid-Catalyzed Kinetic Resolution of Secondary Alcohols
Harada, S.; Yamaoka, Y.; Yamada, K.; Takasu, K. 23rd French-Japanese Symposium on Medicinal and Fine Chemistry (FJS2013), Nagasaki, 2013.5.12-15 (ポスター発表).
- (47) Kinetic Resolution of Diols and Amino Alcohols by NHC-Catalyzed Esterification

Kuwano, S.; Yamaoka, Y.; Takasu, K.; Yamada, K. 第1回国際会議 (兼) 第6回 有機触媒シンポジウム, Ootsu, 2013. 5. 27-28 (ポスター発表).

(48) Synthesis of Chiral Cyclitols by NHC-Catalyzed Benzoin Cyclization of Dialdehydes

Kang, B.; Yamaoka, Y.; Takasu, K.; Yamada, K. 第1回国際会議 (兼) 第6回 有機触媒シンポジウム, Ootsu, 2013. 5. 27-28 (ポスター発表).

(49) 小員環ひずみを利用する機能性分子の創製

高須清誠, 東北大学大学院薬学研究科セミナー, 仙台, 2013.6.25 (招待講演、口頭発表).

(50) 小員環ひずみを利用する機能性分子の創製

高須清誠, 東北薬科大学創薬研究センター講演会, 仙台2013.6.25 (招待講演、口頭発表).

(51) Efficient Syntheses of Polycyclic Quinolines Using Ynamides Toward the Total Synthesis of Aplidiopsamine A

Yamaoka, Y.; Yoshida, T.; Yamada, K.; Takasu, K. The 1st Asian Conference for "MONODUKURI" Strategy by Synthetic Organic Chemistry (ACMS), Naha, 2013.7.18-19 (口頭発表).

(52) 熱帯性原虫感染症治療薬の創製を目指した有機化学研究

高須清誠, 第37回大学分析者の会, 京都, 2013.7.31 (招待講演、口頭発表).

(53) Base-Induced Stereoselective Formation of Benzo-fused Cyclobutanols from Biarylketones

Yamaoka, Y.; Fujimura, S.; Nagamoto, Y.; Kishida, A.; Yamada, K.; Takemoto, Y.; Takasu, K. 10th International Symposium on Carbanion Chemistry (ISCC-10), Kyoto, 2013.9.23-26 (招待講演、口頭発表)

(54) Enhanced rate and selectivity by carboxylate salt as a basic cocatalyst in chiral NHC-catalyzed asymmetric acylation of secondary alcohols

Kuwano, S.; Yamaoka, Y.; Yamada, K.; Takasu, K. 13rd International Conference on the Chemistry of Antibiotics and other bioactive compounds: ICCA-13, Yamanashi, 2013.9.24-26 (口頭発表).

(55) Chiral Phosphoric Acid-Catalyzed Kinetic Resolution of Secondary Alcohols

Takasu, K. 9th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium in 2013 (AIMECS13), Taipei, 2013.10.15-18 (口頭発表).

(56) Enhanced rate and selectivity by carboxylate salt as a basic cocatalyst in chiral *N*-heterocyclic carbene-catalyzed asymmetric acylation of secondary alcohols

Kuwano, S.; Yamaoka, Y.; Takasu, K.; Yamada, K. 14th Tetrahedron Symposium Asia, Seoul, 2013.10.21-24 (ポスター発表).

- (57) Syntheses of steroid derivatives bearing a small ring for the conformational fixation of D-ring side chain
Arichi, N.; Hata, K.; Yamada, K.; Yamaoka, Y.; Takasu, K. 14th Tetrahedron Symposium Asia, Seoul, 2013.10.21-24 (ポスター発表).
- (58) Synthetic Studies towards Protoilludane Terpenoids
Mogi, Y.; Inanaga, K.; Ishii, T.; Tokuyama, H.; Ihara, M.; Yamada, K.; Yamaoka, K.; Takasu, K. The Eighth International Symposium on Integrated Synthesis (ISIS-8), Nara, 2013.11.29-12.1 (ポスター発表).
- (59) Synthesis of 2,3,4,5-Tetra-substituted Pyrroles via a Base-promoted Double Michael Reaction of Oxime-enoates
Kuroda, Y.; Harada, S.; Yamada, K.; Yamaoka, K.; Takasu, K. The Eighth International Symposium on Integrated Synthesis (ISIS-8), Nara, 2013.11.29-12.1 (ポスター発表).
- (60) 小員環炭化水素化学の発掘
高須清誠, 有機合成2月セミナー「有機合成のニュートレンド2014」, 大阪, 2014.2.4-5 (招待講演、口頭発表).

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
PCT/JP2011/54945, 2011.3.2.
- (2) 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サマーシンポジウム, 京都, 2012.7.19-20(高須清誠, 世話人).
- (2) 第42回複素環化学討論会, 京都, 2012.10.11-13(高須清誠, 組織委員・事務局).
- (3) 第48回天然物化学談話会, 大津, 2013.7(高須清誠, 世話人).
- (4) 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) 10th International Symposium on Carbanion Chemistry, Kyoto, 2013.9.23-26(高須清誠, Local Organizing Committee).
- (6) 8th International Symposium on Integrated Synthesis, Nara, 2013.11.29-12.1(高須清誠, Organizing Committee).

5 . 受賞等

- (1) 進藤直哉 (博士 3 年)
ポスター賞 第 30 回有機合成若手セミナー、2010.11.10.
- (2) 戸谷博希 (博士 2 年)
優秀発表賞 Tohoku University Global COE Program Summer School、2010.8.20.
- (3) 原田慎吾 (博士 2 年)
Poster Award, 5th ChemComm International Symposium, 2011.5.16
- (4) 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
- (5) 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
- (6) 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
- (7) 原田慎吾 (博士 2 年)
優秀発表賞、日本薬学会第 132 年会、日本薬学会、2012.3.31.
- (8) 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.
- (9) 鋤野哲 (博士 2 年)
優秀発表賞、日本薬学会第 133 年会、日本薬学会、2013.3.30.
- (10) 黒田悠介 (修士 2 年)
優秀発表賞、日本薬学会第 133 年会、日本薬学会、2013.3.30.

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。

3. 大学分析者の会（2013.7.31）にて、講演を行った。対象は大学等の研究機関の機器分析施設に勤務する技術者であり、約25名の参加であった。大学研究者と技術専門職の間で機器分析についての意見交換も行った。アンケートは実施しなかったが、お互いの立場の理解が深まった。
4. 京都大学薬学部オープンキャンパス（2013.8.7.）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。

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：京都大学大学院工学研究科，吉田研究室（A01班，計画班員）
共同機器の借入
借入期間：2010.10.16-2011.1.26
共同研究内容：フローマイクロリアクターシステムによる触媒的シリルエノールエーテル化および連続反応への展開
共同研究成果：特許 PCT 出願
- (2) 共同研究先：京都大学，大野研究室（A02班，公募班員）
派遣人員（受入）：稲葉祐介（修士2年）
派遣期間（受入）：2010.11.24-25
共同研究内容：高度縮環型カルバゾールの結晶構造解析
共同研究成果：論文発表
- (3) 共同研究先：京都大学，大野研究室（A02班，公募班員）
派遣人員（派遣）：進藤直哉（博士3年）
派遣期間（派遣）：2011.1.11-13.
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
共同研究成果：論文発表
- (4) 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