

平成22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) Unprecedented Synthesis of *N,N*-Divinylamines by Tf₂NH-Catalyzed Reaction of Ynamide with Ketimine, Shindoh, N.; Takemoto, Y.; Takasu, K. *Heterocycles*, **2011**, *82*, 1133-1136.
- (6) 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.
- (7) 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.
- (8) 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.
- (9) 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.
- (10) 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.

- (11) 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.
- (12) 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.

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 (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).

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

4. 学会・シンポジウム等の開催状況

(1) (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).

(2) (予定) 日本プロセス化学会サマーシンポジウム, 京都, 2012.8. (高須清誠, 実行委員).

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

6. 新聞報道等

なし

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：現在，論文準備中． 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：論文準備中
- (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：論文準備中

8. その他特記事項

なし