

研究期間全年度 研究業績

佐々木 誠 (東北大学大学院生命科学研究科、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) Stereoselective Synthesis of 2,6-*cis*-Substituted Tetrahydropyrans: Bronsted Acid-Catalyzed Intramolecular Oxa-Conjugate Cyclization of α,β -Unsaturated Ester Surrogates
Fuwa, H.*; Ichinokawa, N.; Noto, K.; Sasaki, M. *J. Org. Chem.* **2012**, *77*, 2588-2607.
(10.1021/jo202179s)
- (2) Total Synthesis of (-)-Brevenal: A Streamlined Strategy for Practical Synthesis of Polycyclic Ethers
Ebine, M.; Fuwa, H.*; Sasaki, M.* *Chem. Eur. J.* **2011**, *17*, 13754-13761.
(10.1002/chem.201101437)
- (3) Recent Applications of the Suzuki–Miyaura Cross-Coupling to Complex Polycyclic Ether Synthesis
Fuwa, H.; Ebine, M.; Sasaki, M.* *J. Syn. Org. Chem. Jpn.* **2011**, *69*, 1251-1262.
(10.5059/yukigoseikyokaishi.69.1251)
- (4) Binding and Selectivity of the Marine Toxins Neodysiherbaine A, and Its Synthetic Analogues, to GluK1 and GluK2 Kainate Receptors
Unno, M.*; Shinohara, M.; Takayama, K.; Tanaka, H.; Teruya, K.; Doh-ura, K.; Sakai, R.; Sasaki, M.; Ikeda-Saito, M.* *J. Mol. Biol.* **2011**, *413*, 667-683.
(10.1016/j.jmb.2011.08.043)
- (5) Synthetic Studies on Dragmacidin D: Synthesis and Assembly of Three Fragments towards an Advanced Intermediate
Oikawa, M.*; Ikoma, M.; Sasaki, M. *Eur. J. Org. Chem.* **2011**, 4654-4666.
(10.1002/ejoc.201100242)
- (6) Comparative Cytotoxicity of Gambierol Versus Other Marine Neurotoxins
Cagide, E.; Louzao, M. C.; Espina, B.; Ares, I. R.; Vieytes, M. R.; Sasaki, M.; Fuwa, H.; Tsukano, C.; Konno, Y.; Yotsu-Yamashita, M.; Paquette, L. A.; Yasumoto, T.; Botana, L. M.* *Chem. Res. Toxicol.* **2011**, *24*, 835-842. (10.1021/tx200038j)
- (7) Studies toward the Total Synthesis of Gambieric Acids, Potent Antifungal Polycyclic Ethers: Convergent Synthesis of a Fully Elaborated GHIJ-Ring Fragment
Tsubone, K.; Hashizume, K.; Fuwa, H.; Sasaki, M.* *Tetrahedron* **2011**, *67*, 6600-6615.
(10.1016/j.tet.2011.05.082)

- (8) Antinociceptive Effects of MSVIII-19, a Functional Antagonist of the GluK1 Kainate Receptor
Qiu, C.-S.; Wyhe, L. L.-V.; Sasaki, M.; Sakai, R.; Swanson, G. T.; Gereau IV, R. W.*
Pain **2011**, *152*, 1052-1060. (10.1016/j.pain.2011.01.018)
- (9) A New Strategy for the Synthesis of Substituted Dihydropyrones and Tetrahydropyrones via Palladium-Catalyzed Coupling of Thioesters
Fuwa, H.*; Mizunuma, K.; Matsukida, S.; Sasaki, M. *Tetrahedron* **2011**, *67*, 4995-5010.
(10.1016/j.tet.2011.03.114)
- (10) Biosynthesis-Inspired Intramolecular Oxa-Conjugate Cyclization of α,β -Unsaturated Thioesters: Stereoselective Synthesis of 2,6-*cis*-Substituted Tetrahydropyrans
Fuwa, H.*; Noto, K.; Sasaki, M. *Org. Lett.* **2011**, *13*, 1820-1823. (10.1021/ol200333p)
- (11) A Convergent Synthesis of the C1-C16 Segment of Goniiodomin A via Palladium-Catalyzed Organostannane-Thioester Coupling
Fuwa, H.*; Nakajima, M.; Shi, J.; Takeda, Y.; Saito, T.; Sasaki, M.* *Org. Lett.* **2011**, *13*, 1106-1109. (10.1021/ol1031409)
- (12) Total Synthesis and Biological Assessment of (-)-Exiguolide and Analogues
Fuwa, H.*; Suzuki, T.; Kubo, H.; Yamori, T.; Sasaki, M. *Chem. Eur. J.* **2011**, *17*, 2678-2688. (10.1002/chem.201003135)
- (13) Suppression of Colon Cancer Metastasis by Aes Through Inhibition of Notch Signaling
Sonoshita, M.; Aoki, M.; Fuwa, H.; Aoki, K.; Hosogi, H.; Sakai, Y.; Hashida, H.; Takabayashi, A.; Sasaki, M.; Robine, S.; Itoh, K.; Yoshioka, K.; Kakizaki, F.; Kitamura, T.; Oshima, M.; Taketo, M. M.* *Cancer Cell* **2011**, *19*, 125-137.
(10.1016/j.ccr.2010.11.008)
- (14) Asymmetric Synthesis and In Vivo Biological Inactivity of Right-Hand Terpenoid Fragment of Terpendole E
Oikawa, M.*; Hashimoto, R.; Sasaki, M. *Eur. J. Org. Chem.* **2011**, 538-546.
(10.1002/ejoc.201001104)
- (15) Studies toward the Total Synthesis of Gambieric Acids: Convergent Synthesis of the GHJ-Ring Fragment Having a Side Chain
Tsubone, K.; Hashizume, K.; Fuwa, H.; Sasaki, M.* *Tetrahedron Lett.* **2011**, *51*, 548-551.
10.1016/j.tetlet.2010.11.127)
- (16) Synthetic Studies on Goniiodomin A: Convergent Synthesis of the C15-C36 Segment via Palladium-Catalyzed Organostannane-Thioester Coupling
Saito, T.; Fuwa, H.; Sasaki, M.* *Tetrahedron* **2011**, *66*, 429-445.
(10.1016/j.tet.2010.11.017)

- (17) A Convergent Assembly of the Spiroacetal Subunit of Didemnaketal B
Fuwa, H.*; Noji, S.; Sasaki, M. *Org. Lett.* **2010**, *12*, 5354-5357. (10.1021/ol1024713)
- (18) An Enantioselective Total Synthesis of Aspergillides A and B
Fuwa, H.*; Yamaguchi, H.; Sasaki, M. *Tetrahedron* **2010**, *66*, 7492-7503.
(10.1016/j.tet.2010.07.062)
- (19) Studies toward the Total Synthesis of Gambieric Acids: Stereocontrolled Synthesis of a DEFG-Ring Model Compound
Fuwa, H.*; Noji, S.; Sasaki, M.* *J. Org. Chem.* **2010**, *75*, 5072-5082.
(10.1021/jo1008146)
- (20) A Concise Total Synthesis of (±)-Centrolobine
Fuwa, H.*; Noto, K.; Sasaki, M. *Heterocycles* **2010**, *82*, 641-647.
(10.3987/COM-10S(E)37)
- (21) The Marine Polyether Gambierol Enhances Muscle Contraction and Blocks a Transient K⁺ Current in Skeletal Muscle Cells
Schlumberger, S.; Ouanounou, G.; Girard, E.; Sasaki, M.; Fuwa, H.; Louzao, M. C.; Botana, L. M.; Benoit, E.; Molgó, J.* *Toxicon* **2010**, *55*, 785-791.
(10.1016/j.toxicon.2010.06.001)
- (22) A Series Of Structurally Novel Heterotricyclic α -Amino-3-Hydroxyl-5-Methyl-4-Isoxazole-Propionate Receptor-Selective Antagonists
Gill, M. B.; Frausto, S.; Ikoma, M.; Sasaki, M.; Oikawa, M.; Sakai, R.; Swanson, G. T.* *Br. J. Pharmacol.* **2010**, *159*, 1417-1429. (10.1111/j.1476-5381.2010.00784.x)
- (23) Improved Synthesis and In Vitro/In Vivo Activities of Natural Product-Inspired, Artificial Glutamate Analogs
Oikawa, M.*; Ikoma, M.; Sasaki, M.; Gill, M. B.; Swanson, G. T.; Shimamoto, K.; Sakai, R. *Bioorg. Med. Chem.* **2010**, *18*, 3795-3804.
- (24) An Efficient Synthesis of 2,6-Disubstituted 2,3-Dihydro-4H-Pyran-4-Ones via Sonogashira Coupling of *p*-Toluenethiol Esters
Fuwa, H.*; Matsukida, S.; Sasaki, M. *Synlett* **2010**, 1239-1242.
(10.1055/s-0029-1219794)
- (25) A Unified Total Synthesis of Aspergillides A and B
Fuwa, H.*; Yamaguchi, H.; Sasaki, M. *Org. Lett.* **2010**, *12*, 1848-1851.
(10.1021/ol100463a)
- (26) Stereoselective Synthesis of Substituted Tetrahydropyrans via Domino Olefin Cross-Metathesis/Intramolecular Oxa-Conjugate Cyclization
Fuwa, H.*; Noto, K.; Sasaki, M. *Org. Lett.* **2010**, *12*, 1636-1639. (10.1021/ol100431m)

(27) A Concise Total Synthesis of (+)-Neopeltolide

Fuwa, H.*; Saito, A.; Sasaki, M. *Angew. Chem., Int. Ed.* **2010**, *49*, 3041-3044.
(10.1002/anie.201000624)

(28) Calcium Oscillations Induced by Gambierol in Cerebellar Granule Cells

Alonso, E.; Vale, C.; Sasaki, M.; Fuwa, H.; Konno, Y.; Botana, L. M.* *J. Cell. Biochem.*
2010, *109*, 497-508. (10.1002/jcb.22566)

査読無し

平成22年度 理科年表 (国立天文台編, 丸善)

佐々木 誠 編集、生体物質 物182 物193, 生理活性物質 物195 - 物99.

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) 鈴木-宮浦クロスカップリング反応を活用した天然物の全合成

佐々木 誠, 平成 23 年度有機合成化学前期講習会, 東京, 2011.6.22 (招待講演).

(2) 複雑な海洋天然物の全合成

佐々木 誠, 第 13 回生命化学研究会「分子で拓く生命化学」, 秋保, 2011.1.8. (招待講演).

(3) Synthetic Studies on Polycavernoside A

Kasai, Y.; Sasaki, M. The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (ポスター発表).

(4) Studies toward the Total Synthesis of goniiodomin A: Convergent synthesis of the C12-C36 Fragment

Saito, T.; Fuwa, H.; Sasaki, M. The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (ポスター発表).

(5) Convergent Synthesis of the GHIJ-Ring Fragment of Gambieric Acids

Tsubone, K.; Hashizume, K.; Fuwa, H.; Sasaki, M. The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (ポスター発表).

(6) Convergent Synthesis of the A/BCD-Ring Fragment of Gambieric Acid A

Ishigai, K.; Fuwa, H.; Sasaki, M. The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (ポスター発表).

- (7) Exploration of Skeletal Structure-Activity Relationships of Gambierol
Suga, Y.; Goto, T.; Ogata, Y.; Fuwa, H.; Sasaki, M. The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (ポスター発表) .
- (8) Studies toward the Total Synthesis of Didemnaketals
Noji, S.; Fuwa, H.; Sasaki, M. The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (ポスター発表) .
- (9) Practical Total Synthesis of (+)-Neopeltolide
Saito, A.; Fuwa, H.; Sasaki, M. The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (ポスター発表) .
- (10) Concise Total Synthesis of (+)-Neopeltolide
Fuwa, H.; Saito, A.; Sasaki, M. The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (口頭発表) .
- (11) 環状エーテル構造を含む海洋天然物の全合成
佐々木 誠 , 第 27 回有機合成化学セミナー , 神戸 , 2010.9.2-4 (招待講演) .
- (12) Enantioselective Synthesis of Allenes via Carbolithiation of Conjugated Enynes with Organolithiums Using Integrated Flow Microreactor Systems
Tomida, Y.; Nagaki, A.; Yoshida, J. The 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (Pacifichem 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20 (口頭発表) .
2010.12.15-20 (口頭発表) .

3 . 特許

- (1) 抗癌作用を有するマクロリド化合物
国立大学法人東北大学 , 不破春彦 , 佐々木 誠 , 久保裕司 , 鈴木隆哉
特願 2010-286945 , 2010.12.24

4 . 学会・シンポジウム等の開催状況

5 . 受賞等

- (1) 能登健吉 (修士 2 年)
平成 23 年度生命科学研究科長賞 東北大学大学院生命科学研究科、2012.3.27
- (2) 関根久美子 (修士 1 年)
優秀ポスター賞 平成 23 年度化学系学協会東北大会、2011.9.18

(3) 不破春彦 (准教授、研究協力者)

平成 23 年度科学技術分野の文部科学大臣表彰若手科学者賞 文部科学省、
2011.4.13

(4) 野地沙也加 (修士 2 年)

生命科学研究科長賞 東北大学大学院生命科学研究科、2011.3.25

6 . 新聞報道等

(1) 海綿から抗がん剤

不破春彦, 佐々木 誠, 高知新聞 20 面, 2011.5.11

(2) 海綿から新たな抗がん剤 <科学スコープ>

不破春彦, 佐々木 誠, 埼玉新聞 9 面, 2011.4.6

(3) 海綿から新抗がん剤

不破春彦, 佐々木 誠, 中部経済新聞 9 面, 2011.4.5

(4) 抗がん物質 合成成功 東北大グループ新薬開発へ応用も

不破春彦, 佐々木 誠, 河北新報 3 面, 2011.2.7

7 . 国民との科学・技術対話

8 . 領域内の共同研究の準備・実施状況とその成果

9 . その他特記事項

(1) 海洋天然物イグジグオリドの化学合成と生物活性評価の研究が、NHK 教育テレビの番組サイエンス ZERO で紹介された。

(2) 論文 “Stereoselective Synthesis of 2,6-*cis*-Substituted Tetrahydropyrans: Bronsted Acid-Catalyzed Intramolecular Oxa-Conjugate Cyclization of α,β -Unsaturated Ester Surrogates”が *J. Org. Chem.*の front cover に選ばれた。