

研究期間全年度 研究業績

土井隆行（東北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) (*S*)-Stereoisomer of Telomestatin as a Potent G-quadruplex Binder and Telomerase Inhibitor
Doi, T.*; Shibata, K.; Yoshida, M.; Takagi, M.; Tera, M.; Nagasawa, K.; Shin-ya, K.; Takahashi, T.* *Org. Biomol. Chem.* **2011**, *9*, 387–393. (10.1039/C0OB00513D)
- (2) Continuous-Flow Synthesis of Vitamin D₃
Fuse, S.; Tanabe, N.; Yoshida, M.; Doi, T.; Takahashi, .T.* *Chem. Commun.* **2010**, *46*, 8722–8724. (10.1039/C0CC02239J)
- (3) Use of Molecular Oxygen as a Reoxidant in the Synthesis of 2-Substituted Benzothiazoles via Palladium-Catalyzed C-H Functionalization/Intramolecular C-S Bond Formation
Inamoto, K.*; Hasegawa, C.; Kawasaki, J.; Hiroya, K.; Doi, T.* *Adv. Synth. Catal.* **2010**, *352*, 2643–2655. (10.1002/adsc.201000604)
- (4) Synthesis, Structure Determination, and Biological Evaluation of Destruxin E
Yoshida, M.; Takeuchi, H.; Ishida, Y.; Yashiroda, Y.; Yoshida, M.; Takagi, M.; Shin-ya, K.; Doi, T.* *Org. Lett.* **2010**, *12*, 3792–3795. (10.1021/ol101449x)
- (5) Construction of the ABC Ring System of Taxanes via the Stereoselective One-Pot Three-Component Coupling Reaction and the Intramolecular Alkylation of Protected Cyanohydrin Ether
Serizawa, T.; Miyamoto, S.; Fuse, S.; Doi, T.; Takahashi, T.* *Bull. Chem. Soc. Jpn.* **2010**, *83*, 942–949. (10.1246/bcsj.20090341)
- (6) Facile Conversion of Thioamides into the Corresponding Amides in the Presence of Tetrabutylammonium
Inamoto, K.*; Shiraishi, M.; Hiroya, K.; Doi, T.* *Synthesis* **2010**, 3087–3090. (10.1055/s-0030-1258154)
- (7) Palladium-Catalyzed Intramolecular Amidation of C(sp²)-H Bonds: Synthesis of 4-Aryl-2-quinolinones
Inamoto, K.*; Saito, T.; Hiroya, K.; Doi, T.* *J. Org. Chem.* **2010**, *75*, 3900–3903. (10.1021/jo100557s)
- (8) Synthesis of Chiral Polyazamacrocycles of Variable Ring Size
Kamioka, S.; Sugiyama, S.; Takahashi, T.; Doi, T.* *Org. Biomol. Chem. Lett.* **2010**, *8*, 2529–2536. (10.1039/C001228A)

- (9) Derivatization of a Tris-oxazole Using Pd-catalyzed Coupling Reactions of a 5-Bromooxazole Moiety
Shibata, K.; Yoshida, M.; Doi, T.*; Takahashi, T.* *Tetrahedron Lett.* **2010**, *51*, 1674–1677. (10.1016/j.tetlet.2010.01.064)
- (10) Regioselective Synthesis of Flavone Derivatives via DMAP-catalyzed Cyclization of *o*-Alkynoylphenols
Yoshida, M.; Fujino, Y.; Saito, K.; Doi, T.* *Tetrahedron* **2011**, *67*, 9993–9997. (10.1016/j.tet.2011.09.063)
- (11) Synthesis of γ -Benzopyranone by TfOH-Promoted Regioselective Cyclization of *o*-Alkynoylphenols
Yoshida, M.; Fujino, Y.; Doi, T.* *Org. Lett.* **2011**, *13*, 4526–4529. (10.1021/ol2016934)
- (12) Total synthesis of spiruchostatin B aided by an automated synthesizer
Fuse, S.; Okada, K.; Iijima, Y.; Munakata, A.; Machida, K.; Takahashi, T.; Takagi, M.; Shin-ya, K.; Doi, T.* *Org. Biomol. Chem.* **2011**, *9*, 3825–3833. (10.1039/C0OB01169J)
- (13) Solid-phase Total Synthesis of (–)-Apratoxin A and Its Analogues and Their Biological Evaluation
Doi, T.*; Numajiri, Y.; Takahashi, T.; Takagi, M.; Shin-ya, K. *Chem. Asian J.* **2011**, *6*, 180–188. (10.1002/asia.201000549)
- (14) Use of Dimethyl Carbonate as a Solvent Greatly Enhances the Biaryl Coupling of Aryl Iodides and Organoboron Reagents without Adding Any Transition Metal Catalysts
Inamoto, K.*; Hasegawa, C.; Hiroya, K.; Kondo, Y.; Osako, T.; Uozumi, Y.; Doi, T.* *Chem. Commun.* **2012**, *48*, 2912–2914. (10.1039/C2CC17401D)
- (15) Development of a Near Infrared Fluorescence Labeling Reagent: Synthesis of Indole-Functionalized Indocyanine Green Derivatives
Doi, T.*; Oikawa, K.; Suzuki, J. Yoshida, M.; Iki, N. *Synlett* **2012**, 306–310. (10.1055/s-0031-1290139)
- (16) Conformationally Restricted Analog and Biotin-Labeled Probe Based on Beauveriolide III
Doi, T.*; Muraoka, T.; Ohshiro, T.; Matsuda, D.; Yoshida, M.; Takahashi, T.; Omura, S.; Tomoda, H. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2012**, *22*, 696–699. (10.1016/j.bmcl.2011.10.045)
- (17) A Concise Synthesis of 3-Aroylflavones via Lewis Base 9-Azajulolidine-catalyzed Tandem Acyl Transfer–Cyclization
Yoshida, M.; Saito, K.; Fujino, Y.; Doi, T.* *Chem. Commun.* **2012**, *48*, 11796–11798. (10.1039/C2CC37015H)

- (18) Tandem-Type Pd(II)-Catalyzed Oxidative Heck Reaction/ Intramolecular C - H Amination Sequence: A Novel Route to 4-Aryl-2-quinolinones
Inamoto, K.*; Kawasaki, J.; Hiroya, K.; Kondo, Y.; Doi, T.* *Chem. Commun.* **2012**, 48, 4332–4334. (10.1039/C2CC30600J)
- (19) A Direct and Mild Formylation Method for Substituted Benzenes Utilizing Dichloromethyl Methyl Ether–Silver Trifluoromethanesulfonate
Ohsawa, K.; Yoshida, M.; Doi, T.* *J. Org. Chem.* **2013**, 78, 3438–3444. (10.1021/jo4000056k)
- (20) Synthesis of Hepta-oxazole Macrocyclic Analogues of Telomestatin and Evaluation of Their Telomerase Inhibitory Activities
Shibata, K.; Yoshida, M.; Takahashi, T.; Takagi, M.; Shin-ya, K.; Doi, T.* *Bull. Chem. Soc. Jpn.* **2013**, 86, 1453–1465. (10.1246/bcsj.20130198)
- (21) Scalable Solution-Phase Synthesis of the Biologically Active Cyclodepsipeptide Destruxin E, a Potent Negative Regulator of Osteoclast Morphology
Yoshida, M.; Sato, H.; Ishida, Y.; Nakagawa, H.; Doi, T.* *J. Org. Chem.* **2014**, 79, 296–306. (10.1021/jo402437z)

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) 生物活性環状デプシペプチドの全合成と機能解明を目指して
土井隆行，第 45 回天然物談話会，愛知，2010.7.6-8.（招待講演）
- (2) Synthesis, Structure Determination and Biological Evaluation of Destruxin E
Yoshida, M.; Takeuchi, H.; Ishida, Y.; Doi, T. The 5th International Conference on Cutting-Edge Organic Chemistry in Asia/The 1st New Phase International on Cutting-Edge Organic Chemistry in Asia (ICCEOCA-5/NICCEOCA-1), Hsinchu, Taiwan, 2010.11.7-11.（ポスター発表）
- (3) 環状ペプチド様生理活性天然物の全合成から機能解明へのアプローチ
土井隆行，創薬懇話会 2010 in 蔵王，宮城，2010.11.12-13.（招待講演）
- (4) 生物活性天然物の全合成と機能解明に向けた研究
土井隆行，第 32 回東北薬学セミナー，仙台，2010.12.3.（招待講演）
- (5) Total Synthesis, Biological Evaluation, and Binding Protein Network Analysis of Natural Product Cyclic Depsipeptide, Spiruchostatin A and Apratoxin A
Doi, T.; Numajiri, Y.; Iijima, Y.; Takahashi, T.; Takagi, T.; Shin-ya, K.; Iemura, S.; Natsume, T. 5th International Peptide Symposium/47th Japanese Peptide Symposium, Kyoto, 2010.12.4-9.（口頭発表）

- (6) Continuous-flow Synthesis of Vitamin D₃
Fuse, S.; Tanabe, N.; Yoshida, M.; Yoshida, H.; Doi, T.; Takahashi, T. 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (PACIFICHEM 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20. (口頭発表)
- (7) Development of Acid or Base Promoted Regioselective Cyclization: Synthesis of Flavone-Related Natural Products
Yoshida, M.; Fujino, Y.; Doi, T. 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (PACIFICHEM 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20. (口頭発表)
- (8) Total Synthesis of Apratoxin A and its Analogs and their Biological Evaluation
Doi, T.; Numajiri, Y.; Takahashi, T.; Takagi, M.; Shin-ya, K. 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (PACIFICHEM 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20. (口頭発表)
- (10) Synthesis of Indocyanine Green Derivatives toward Near Infrared Fluorescent Probes.
Doi, T.; Oikawa, K.; Yoshida, M. 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (PACIFICHEM 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20. (口頭発表)
- (11) Synthesis, Structure Determination and Biological Evaluation of Destruxin E
Yoshida, M.; Takeuchi, H.; Ishida, Y.; Yashiroda, Y.; Yoshida, M.; Takagi, M.; Shin-ya, K.; Doi, T. 2010 International Chemical Congress of Pacific Basin Societies (PACIFICHEM 2010), Honolulu, Hawaii, USA, 2010.12.15-20. (ポスター発表)
- (12) 生物活性機能発現を目指した天然物合成 , 類縁体合成 , 分子プローブ合成
土井隆行 , 平成 23 年度前期 (春季) 有機合成化学講習会 , 東京 , 2011.6.22-23, (招待講演)
- (13) Total Synthesis of Cyclicdepsipeptide Destruxin E and its Derivatives as a Potent V-ATPase Inhibitor
Yoshida, M.; Ishida, Y.; Takeuchi, H.; Yashiroda, Y.; Yoshida, M.; Takagi, M.; Shin-ya, K.; Doi, T. 8th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (AIMECS11), Tokyo, 2011.11.29-12.01. (ポスター発表)
- (14) Total Synthesis of Thielocin B1
Ohsawa, K.; Yoshida, M.; Takagi, M.; Shin-ya, K.; Doi, T. 8th AFMC International Medicinal Chemistry Symposium (AIMECS11), Tokyo, 2011.11.29-12.01. (ポスター発表)
- (15) Development of Lewis Base-Catalyzed Tandem Acyl Transfer-Cyclization: Synthesis of 3-Acylflavone Derivatives
Yoshida, M.; Saito, K.; Fujino, Y.; Doi, T. The Twelfth International Kyoto Conference on New Aspects of Organic Chemistry, Kyoto, 2012.11.12-16. (ポスター発表)

- (16)生物活性環状デプチペプチド天然物の全合成と機能解明に向けたアプローチ
土井隆行、第44回若手ペプチド夏の勉強会、大阪、2012.8.7 (招待講演)。
- (17)Solid-phase Total Synthesis of Biologically Active Cyclodepsipeptide Natural Products
Takayuki Doi, 2nd Campus Asia Symposium on Frontiers of Chemistry and Materials,
Nanjing, China, 2013.3.11-13 (招待講演)。
- (18)天然物の全合成と機能解明に向けたアプローチ
土井隆行、日本薬学会第133年会、横浜、2013.3.28 (受賞講演)。
- (19)生物活性環状デプチペプチド天然物の合成，誘導體合成，活性評価，機能構造解析
土井隆行，第30回有機合成セミナー，岡山，2013.9.19 (招待講演)
- (20)Synthetic Study of 3-Acyl-4-Quinolones via Lewis base-Catalyzed Tandem Acyl Transfer–Cyclization
Yoshida, M.; Saito, K.; Doi, T. International Conference on the Chemistry of Antibiotics and Other Bioactive Compounds (ICCA-13), Yamanashi, 2013.9.24-27. (ポスター発表)
- (21)A Selective DIBAL Reduction of α,β -Unsaturated Esters to Aldehydes in Flow
Yoshida, M.; Otaka, H.; Doi, T. International Symposium for the 70th Anniversary of the Tohoku Branch of the Chemical Society of Japan, Sendai, 2013.9.28-30. (ポスター発表)
- (22)Solid-Phase Synthesis of Spiruchostatin A and its Derivatives Using a Silyl Linker
Yoshida, M.; Sasahara, K.; Doi, T. International Symposium for the 70th Anniversary of the Tohoku Branch of the Chemical Society of Japan, Sendai, 2013.9.28-30. (ポスター発表)
- (23)Efficient Synthesis of 3-Acylflavone Derivatives via Lewis Base-Catalyzed Intramolecular Tandem Acyl Transfer–Cyclization
Yoshida, M.; Saito, K.; Fujino, Y.; Doi, T. International Symposium for the 70th Anniversary of the Tohoku Branch of the Chemical Society of Japan, Sendai, 2013.9.28-30. (ポスター発表)
- (24)Total Synthesis and Conformational Analysis of Apratoxin C
Masuda, Y.; Suzuki, J.; Yoshida, M.; Doi, T. 4th Asia-Pacific International Peptide Symposium/50th Japanese Peptide Symposium (APIPS 2013), Osaka, 2013.11.6-7. (口頭発表)
- (25)Solid-Phase Synthesis of Spiruchostatin A and its derivatives Using a Silyl Linker
Yoshida, M.; Sasahara, K.; Doi, T. 4th Asia-Pacific International Peptide Symposium/50th Japanese Peptide Symposium (APIPS 2013), Osaka, 2013.11.6-8. (ポスター発表)

(26)Solid-Phase Total Synthesis of Spiruchostatin A

Doi, T. International Symposium on Integrated Synthesis 8 (ISIS-8), Nara, 2013.11.29-12.1. (招待講演)

(27)A Pratial Reduction of α,β -Unsaturated Esters to Aldehydes in Flow

Yoshida, M.; Otaka, H.; Doi, T. International Symposium on Integrated Synthesis 8 (ISIS-8), Nara, 2013.11.29-12.1. (ポスター発表)

3 . 特許

特になし

4 . 学会・シンポジウム等の開催状況

- (1) 新学術領域研究「反応集積化の合成化学 革新的手法の開拓と有機物質創成への展開」第6回若手シンポジウム(東北地区), 東北大学, 2012.7.14(土井隆行, A02班 公募班員).

5 . 受賞等

- (1) 土井隆行(公募班員)
平成25年度日本薬学会学術振興賞, 2013.03.27.
- (2) 吉田将人(COEフェロー)
有機合成化学協会 ロンザジャパン研究企画賞, 2011.02.18.
- (3) 石田恵崇(学部4年)
ポスター賞 平成22年度化学系学協会東北支部大会, 2010.09.26
- (4) 大澤宏祐(博士1年)
ポスター賞, 平成23年度化学系学協会東北支部大会, 2011.09.18.
- (5) 市橋佑介(博士3年)
ポスター賞, 平成23年度化学系学協会東北支部大会, 2011.09.18.
- (6) 川瀬歩(修士1年)
ポスター賞, 平成24年度化学系学協会東北支部大会, 2012.09.16.
- (7) 関岡直樹(博士1年)
優秀発表賞, 日本薬学会第133年会, 2013.03.30.
- (8) 笹原健一(修士2年)
ポスター賞, International Symposium for the 70th Anniversary of the Tohoku Branch of the Chemical Society of Japan, 2013.09.30

(9) 中村早希 (修士 1 年)

ポスター賞 , International Symposium for the 70th Anniversary of the Tohoku Branch of the Chemical Society of Japan, Sendai, 2013.9.28-30.

(10) 笹原健一 (修士 2 年)

ポスター賞 , 4th Asia-Pacific International Peptide Symposium/50th Japanese Peptide Symposium (APIPS 2013) , 2013.11.7.

(11) 齋藤虹矢 (修士 2 年)

若手研究者発表賞 , 第 52 回日本薬学会東北支部大会 , 2013.11.30.

(12) 大澤宏祐 (博士 3 年)

若手研究者発表賞 , 第 52 回日本薬学会東北支部大会 , 2013.11.30.

6 . 新聞報道等

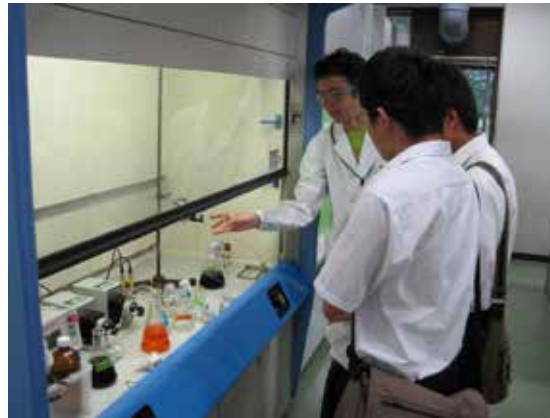
特になし

7. 国民との科学・技術対話

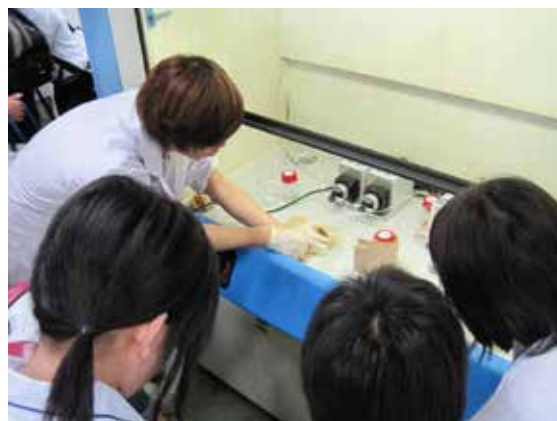
東北大学オープンキャンパスで展示

オープンキャンパス期間中，東北大学北青葉山キャンパス薬学部実習室において，主に高校生（薬学部へ延べ 2,000 人来場）を対象としてマイクロフローリアクターを用いたデモンストレーションを行った。

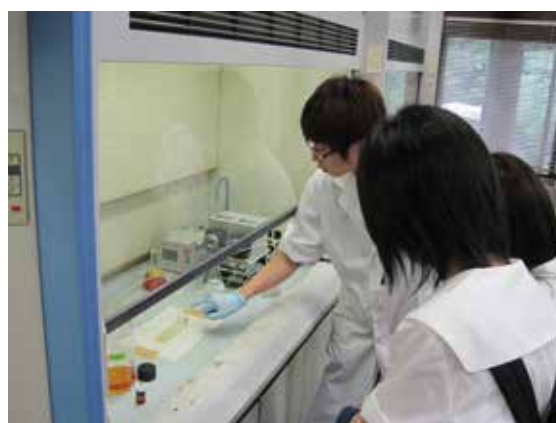
（平成 23 年 7 月 27 日～28 日）



（平成 24 年 7 月 30 日～31 日）



（平成 25 年 7 月 30 日～31 日）



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：分子科学研究所，魚住泰広教授（A01 班，公募班員）
派遣人員（派遣）：土井隆行（教授），稲本浄文（助教），長谷川千沙（修士 2 年）
派遣期間（派遣）：2010.9.6～7, 2011.2.7～9
共同研究内容：触媒を用いないクロスカップリング反応の開発
共同研究成果：論文発表 *Chem. Commun.* **2012**, 48(23), 2912-2914
- (2) 共同研究先：東京工業大学理工学研究科，布施新一郎助教（A01 班，公募班員）
共同研究内容：自動合成機を活用したスピルコスタチン B の全合成
共同研究成果：論文発表 *Org. Biomol. Chem.* **2011**, 9(10), 3825-3833
- (3) 共同研究先：九州大学先導物質化学研究所，友岡克彦教授（A01 班，公募班員）
派遣人員（派遣）：土井隆行（教授），吉田将人（助教），大澤宏祐（博士 1 年）
派遣期間（派遣）：2011.12.12～14
共同研究内容：X 線回折装置を用いたフラボン化合物の構造解析

1 2 . その他特記事項

- (1) 技術提供
依頼元：東北大学理学研究科，林雄二郎教授
内容：フローリアクターを活用した合成反応を行う際における装置の設定方法，および条件検討の方法を指導