

# 薬品製造学研究室

## Synthetic and Medicinal Chemistry

教授	松谷 裕二	Yuji Matsuya
准教授	杉本 健士	Kenji Sugimoto
助教	湊 大志郎	Daishiro Minato

### ◆ 原 著

- 1) Minehira D, Takeda D, Miyawaki S, Kato A, Adachi I, Miyazaki A, Miyatake R, Umezaki M, Miura K, Kitahara Y, Sugimoto K, Matsuya Y, Toyooka N. Synthesis and Evaluations of GLP-1 Secretion and Anti-Diabetic Effect in KKAY Mice of New Tricyclic Compounds. *Heterocycles*. 2015 Jan; 90(1): 372-404.
- 2) Yin S\*, Taneda H, Li B, Zhou D, Minato D, Sugimoto K, Matsuya Y. Preparation of (2R,4S)/(2S,4S)-4-Hydroxypipicolinic Acid Derivatives from L-(-)-Malic Acid. *Heterocycles*. 2015 Jan; 90(2): 928-38.
- 3) Sugimoto K, Miyakawa Y, Tokuyama H. Total synthesis of (-)-rhazinilam using 1,3-dipolar cycloaddition of optically active münchnone intermediate. *Tetrahedron*. 2015 Jun 3; 71(22): 3619-24.
- 4) Sugimoto K, Yamamoto N, Tominaga D, Matsuya Y. Three-Component Domino Process for Pyrrolizine Skeleton via [3+2]-Cycloaddition-Enamine Cyclization Triggered by Gold Catalyst. *Org Lett*. 2015 Mar 6; 17(5): 1320-3.
- 5) Sugimoto K, Yajima H, Hayashi Y, Minato D, Terasaki S, Tohda C, Matsuya Y. Synthesis of Denosomin-Vitamin D<sub>3</sub> Hybrids and Evaluation of their Anti-Alzheimer's Disease Activities. *Org Lett*. 2015 Dec 4; 17(23): 5910-3.
- 6) Takada A, Fujiwara H, Sugimoto K, Ueda H, Tokuyama H. Total synthesis of (-)-isoschizogamine. *Chemistry*. 2015 Nov 9; 21(46): 16400-3.

### ◆ 学会報告

- 1) Sugimoto K, Yajima H, Tohda C, Matsuya Y. Design, synthesis, and biological evaluation of promising anti-Alzheimer's compounds having dihydropyrone unit as a key component. The XVI International Conference on Heterocycles in Bioorganic Chemistry; 2015 Jun 8-11; Metz.
- 2) Sugimoto K, Amano H, Matsuya Y. NHC-catalyzed transformation of  $\beta$ -silylated enones to silyl dienol ethers via silyl migration. The 39<sup>th</sup> Naito Conference, The chemistry of organocatalysts; 2015 Jul 6-9; Sapporo.
- 3) Oguma Y\*, Yamagishi T, Yamamoto N, Shinoda S, Sugimoto K, Minato D, Matsuya Y. Synthetic Studies toward (+)-CJ-12,950 for the Stereochemical Assignment. The 3rd International Symposium on Process Chemistry; 2015 Jul 13-15; Kyoto.
- 4) Oguma Y\*, Yamagishi T, Yamamoto N, Shinoda S, Sugimoto K, Toyooka N, Minato D, Matsuya Y. Synthetic studies toward (+)-CJ-12,950 for the stereochemical assignment and structure activity relationship studies. 2015 International Congress of Pacific Basin Societies; 2015 Dec 15-20; Honolulu.
- 5) Sugimoto K, Yamamoto N, Tominaga D, Matsuya Y. Three-component domino process for the pyrrolizine skeleton via [3+2]-cycloaddition of azomethine ylide and enamine cyclization triggered by a gold catalyst. 2015 International Congress of Pacific Basin Societies; 2015 Dec 15-20; Honolulu.
- 6) Amano H\*, Sugimoto K, Matsuya Y. Novel NHC-catalyzed synthesis of silyl dienol ethers via 1,4-Brook rearrangement. 2015 International Congress of Pacific Basin Societies; 2015 Dec 15-20; Honolulu.
- 7) Ueda H, Takada A, Fujiwara H, Sugimoto K, Tokuyama H. Total synthesis of (+)-isoschizogamine. 2015 International Congress of Pacific Basin Societies; 2015 Dec 15-20; Honolulu.
- 8) 尹 樹強\*, 湊大志郎, 杉本健士, 松谷裕二. 抗腫瘍ステロイドアンドラスチン類の全合成研究. 日本薬学会第 135 年会 ; 2015 Mar 25-28 ; 神戸.
- 9) 水野翔太\*, 杉本健士, 松谷裕二. 金触媒を用いた三重結合及びエナミドの活性化を経る連続環化反応の開発. 日本薬学会第 135 年会 ; 2015 Mar 25-28 ; 神戸.
- 10) 和田健太郎\*, 湊大志郎, 杉本健士, 松谷裕二. 1,2-Brook 転位による無塩型イリド形成を利用した立体選択的シリルエノールエーテル合成. 日本薬学会第 135 年会 ; 2015 Mar 25-28 ; 神戸.
- 11) 小熊義史\*, 山岸 匠, 篠田 翔, 山本のぞみ, 杉本健士, 湊大志郎, 豊岡尚樹, 松谷裕二. 立体構造解明を目指した CJ-12,950 の不斉全合成研究. 日本薬学会第 135 年会 ; 2015 Mar 25-28 ; 神戸.

- 12) 富永大介\*, 山本のぞみ, 杉本健士, 松谷裕二. 金触媒を用いた三成分連結型ピロリジジン合成法の開発とその応用. 日本薬学会第 135 年会 ; 2015 Mar 25-28 ; 神戸.
- 13) 山口南実, 亀谷 紘, 杉本健士, 植田浩史, 徳山英利. 金触媒を用いた新規多置換ピロール合成法の開発. 日本薬学会第 135 年会 ; 2015 Mar 25-28 ; 神戸.
- 14) 植田浩史, 野中汐里, 杉本健士, 徳山英利. 金触媒を用いた多置換キノリジジン合成法の開発とその応用. 日本薬学会第 135 年会 ; 2015 Mar 25-28 ; 神戸.
- 15) 天野央己\*, 杉本健士, 松谷裕二. NHC 型触媒とシリル転位による新規シリルジェノールエーテル合成法の開発. 8 回有機触媒シンポジウム兼「有機分子触媒による未来型分子変換」第 5 回シンポジウム ; 2015 May 10-11 ; 那覇.
- 16) 杉本健士, 山本のぞみ, 富永大介, 松谷裕二. 金触媒を用いた三成分連結型ピロリチジン合成法の開発. 第 13 回次世代を担う有機化学シンポジウム ; 2015 May 22-23 ; 草津.
- 17) 尹 樹強\*, 高井健司, 湊大志郎, 大津英揮, 柘植清志, 杉本健士, 松谷裕二. 分子内 Diels-Alder 反応を利用した連続第四級不斉中心を有する cis-ヒドリンダンの立体選択的合成法の開発. 平成 27 年度有機合成化学北陸セミナー ; 2015 Oct 2-3 ; 富山.
- 18) 小熊義史\*, 山岸 匠, 山本のぞみ, 杉本健士, 湊大志郎, 松谷裕二. 構造解明を目指した CJ-12,950 の収束的合成経路の開発. 平成 27 年度有機合成化学北陸セミナー ; 2015 Oct 2-3 ; 富山.
- 19) 天野央己\*, 杉本健士, 松谷裕二. NHC 触媒を用いた  $\beta$ -シリルエノンの Brook 転位反応によるシリルジェノールエーテル構築法の開発. 平成 27 年度有機合成化学北陸セミナー ; 2015 Oct 2-3 ; 富山.
- 20) 富永大介\*, 山本のぞみ, 杉本健士, 松谷裕二. カチオン性金触媒を用いたアゾメチンイリドの[3+2]-環化付加反応の開発とその応用. 平成 27 年度有機合成化学北陸セミナー ; 2015 Oct 2-3 ; 富山.
- 21) 杉本健士, 水野翔太, 田邊康介, 松谷裕二. 金触媒を用いたアリルシリル基を有するインアミドの連続環化反応の開発. 平成 27 年度有機合成化学北陸セミナー ; 2015 Oct 2-3 ; 富山.
- 22) 和田健太郎\*, 湊大志郎, 杉本健士, 松谷裕二. 1,2-Brook 転位を経る無塩型イリド形成を基盤としたシリルエノールエーテルの立体選択的合成. 平成 27 年度有機合成化学北陸セミナー ; 2015 Oct 2-3 ; 富山.
- 23) 富永大介\*, 山本のぞみ, 杉本健士, 松谷裕二. 金触媒を用いたピロリジジン類のワンポット合成法の開発とその応用. 第 45 回複素環化学討論会 ; 2015 Oct 19-21 ; 東京.
- 24) 杉本健士, 水野翔太, 田邊康介, 松谷裕二. 金触媒によるアルキニルアミドの環化異性化と細見-櫻井反応を経るキノリジジン骨格構築法の開発. 第 45 回複素環化学討論会 ; 2015 Oct 19-21 ; 東京.
- 25) 尹 樹強\*, 高井健司, 湊大志郎, 杉本健士, 松谷裕二. Toward a Pharmacophore Identification of Anti-cancer Natural Product Andrastins : Synthesis of BCD Ring. 第 41 回反応と合成の進歩シンポジウム ; 2015 Oct 26-27 ; 大阪.
- 26) 湊大志郎, 和田健太郎, 杉本健士, 松谷裕二. 1,2-Brook 転位/Wittig 反応による立体選択的シリルエノールエーテル合成研究. 第 41 回反応と合成の進歩シンポジウム ; 2015 Oct 26-27 ; 大阪.
- 27) 杉本健士, 水野翔太, 田邊康介, 松谷裕二. 金触媒による分子内ヒドロアミノ化と細見-櫻井反応を用いたワンポットキノリジジン骨格構築法の開発. 日本薬学会北陸支部第 127 回例会 ; 2015 Nov 15 ; 富山.

#### ◆ その他

- 1) 松谷裕二. ドミノ型反応の活用による新規医薬シーズ化合物の合成. フォーラム富山「創薬」第 41 回研究会 ; 2015 May 28 ; 富山.
- 2) 杉本健士. 「創薬化学」～いかに簡単に標的分子を化学合成するか～. イブニング技術交流サロン ; 2015 Dec 4 ; 富山.