

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	高山 亜紀	Aki Kohyama

◆ 原著

- 1) Sugimoto K, Kobayashi A, Kohyama A, Sakai H, Matsuya Y. Divinylcarbinol Desymmetrization Strategy: A Concise and Reliable Approach to Chiral Hydroxylated Fatty Acid Derivatives. *J Org Chem*. 2021 Feb 10; 86(5): 3970-80. doi: 10.1021/acs.joc.0c02821.
- 2) Abdellatef AA, Zhou Y, Yamada A, Elmekawy SA, Kohyama A, Yokoyama S, Meselhy MR, Matsuya Y, Sakurai H, Hayakawa Y. Synthetic E-guggulsterone derivative GSD-1 inhibits NF- κ B signaling and suppresses the metastatic potential of breast cancer cells. *Biomed Pharmacother*. 2021 May 11; 140: 111737. doi: 10.1016/j.biopha.2021.111737.
- 3) Sugimoto K, Kosuge S, Sugita T, Miura Y, Tsuge K, Matsuya Y. Au(I) Catalyzed Synthesis of Densely Substituted Pyrazolines and Dihydropyridines via Sequential Aza-Enyne Metathesis/6p-Electrocyclization. *Org Lett*. 2021 May 12; 23(10): 3981-5. doi: 10.1021/acs.orglett.1c01171.
- 4) Fujii T, Sugimoto K, Noda T, Shimizu T, Matsuya Y, Sakai H. Inhibition of gastric H⁺,K⁺-ATPase by new dihydropyrazole derivative KYY-008. *Biochem Biophys Res Commun*. 2021 Jun 16; 567(27): 177-82. doi: 10.1016/j.bbrc.2021.06.056.
- 5) Kohyama A, Kim MJ, Yokoyama R, Sun S, Omar AM, Phan ND, Meselhy MR, Tsuge K, Awale S, Matsuya Y. Structure-Activity Relationship and Mechanistic Study on Guggulsterone derivatives; Discovery of New Anti-pancreatic Cancer Candidate. *Bioorg Med Chem*. 2021 Dec 7; 54(15): 116563. doi: 10.1016/j.bmc.2021.116563.

◆ 学会報告

- 1) Kohyama A. Synthesis of Guggulsterone Analogues and Their Biological Activities. 6th Toyama-Basel Joint Symposium 2021; 2021 Sep 15-17; 富山 (オンライン). (Invited lecture)
- 2) Sugimoto K, Hada R, Oshiro M, Matsuya Y. Development of organocatalyzed asymmetric Nazarov cyclization by chiral 2,2'-biphenols and B(OH)₃. PACIFICHEM 2021; 2021 Dec 16-21; Hawaii (オンライン).
- 3) Kosuge S*, Sugita T, Miura Y, Tsuge K, Sugimoto K, Matsuya Y. Novel synthetic approach to N-heterocycles based on gold-catalyzed aza-enyne metathesis between imines and acetylenes. PACIFICHEM 2021; 2021 Dec 16-21; Hawaii (オンライン).
- 4) Takano A*, Koresawa E, Tsuge K, Kohyama A, Matsuya Y. Development of ligation reaction triggered by in situ generation of highly reactive dienes. PACIFICHEM 2021; 2021 Dec 16-21; Hawaii (オンライン).
- 5) 小菅周斗*, 杉本健士, 柘植清志, 松谷裕二. カチオン性金触媒を用いた多置換ピリジン構築法の開発. 日本薬学会第141年会; 2021 Mar 26-29; 広島 (オンライン).
- 6) 羽田竜平**, 大城美祐, 杉本健士, 松谷裕二. ホウ酸一軸不斉2,2'-ビフェノール触媒系による不斉ナザロフ環化反応の開拓. 日本薬学会第141年会; 2021 Mar 26-29; 広島 (オンライン).
- 7) 志内玲彩**, 高山亜紀, 横山 玲, 周 越, 櫻井宏明, 松谷裕二. NF κ B阻害剤開発に向けた α -メチレンシクロペンタノン類の合成. 日本薬学会第141年会; 2021 Mar 26-29; 広島 (オンライン).
- 8) 高山亜紀, 横山 玲, Suresh Awale, 松谷裕二. 低栄養すい臓がん選択的な抗腫瘍活性ステロイドアナログの構造活性相関研究. 創薬懇話会2021 in 京都; 2021 Jun 24-25; 京都 (オンライン).
- 9) 小菅周斗*, 杉本健士, 柘植清志, 松谷裕二. カチオン性金触媒による連続反応を利用した多置換ピリジンのワンポット構築法の開発. 2021年度有機合成化学北陸セミナー; 2021 Sep 29; 富山 (オンライン).
- 10) 杉本健士, 羽田竜平, 吉田良雅, 和田優聖, 松谷裕二. ホウ酸-ビフェノール触媒系の適用範囲の拡大. 2021年度有機合成化学北陸セミナー; 2021 Sep 29; 富山 (オンライン).
- 11) 小菅周斗*, 杉本健士, 柘植清志, 松谷裕二. 金触媒によるアザエニンメタセシスを利用したワンポット多置換ピリジン構築法の開発. 第47回反応と合成の進歩シンポジウム; 2021 Oct 2-5; 札幌 (オンライン).
- 12) 高野晃成*, 高山亜紀, 是澤恵莉, 松谷裕二. 高反応性ジエンを経由する含水下での2分子連結反応の改良. 第

47回反応と合成の進歩シンポジウム；2021 Oct 2-5；札幌（オンライン）。

- 13) 佐藤叶二郎**, 村田賢信, 高山亜紀, 東田千尋, 松谷裕二. 脳神経保護作用を有するDenosomin-Vitamin D3ハイブリッドの設計と合成. 第47回反応と合成の進歩シンポジウム；2021 Oct 2-5；札幌（オンライン）。
- 14) 小菅周斗*, 杉田崇恵, 三浦優佳, 柘植清志, 杉本健士, 松谷裕二. 金錯体によるオートタンデム触媒作用を利用した含窒素複素環構築法. 第50回複素環化学討論会；2021 Oct 7-9；静岡（オンライン）。
- 15) 高山亜紀, 志内玲彩, 横山 玲, 周 越, 櫻井宏明, 松谷裕二. α -メチレンシクロペンタノン誘導体の合成とNF κ B阻害活性評価. 日本薬学会北陸支部第133回例会；2021 Nov 14；金沢（オンライン）。