

令和 3 年 6 月 10 日現在

機関番号：14301

研究種目：基盤研究(B) (一般)

研究期間：2017～2020

課題番号：17H03971

研究課題名(和文)多環式骨格構築反応を基軸とする生物活性インドールアルカロイドの全合成と創薬展開

研究課題名(英文) Synthetic and medicinal studies on bioactive indole alkaloids based on direct construction of polycyclic ring systems

研究代表者

大野 浩章 (Hiroaki, Ohno)

京都大学・薬学研究科・教授

研究者番号：30322192

交付決定額(研究期間全体)：(直接経費) 14,000,000円

研究成果の概要(和文)：本研究は、複素環骨格一挙構築法の開発と生物活性インドールアルカロイドの全合成研究を通じて、複雑な骨格を有する天然物型化合物をリードとする創薬研究の基盤を築くことを目的とする。我々は本研究において、アジドアルキンの金触媒連続環化反応による[4+2]型カルバゾールの合成法、アルキニルインドールの金触媒連続環化反応によるアクアミリンアルカロイド骨格の構築法、アレンインの金触媒連続環化反応によるアセナフテン合成法を開発した。これらの反応を用いて、ディクチオデンドリン類の全合成、アスピドフィリンA骨格の構築、麦角アルカロイド型縮環インドール骨格構築に成功し、有望な生物活性化合物を取得した。

研究成果の学術的意義や社会的意義

これまでの創薬研究に用いられてきた化合物ライブラリーの構築は、アミド結合やクロスカップリング等のsp²炭素を利用した結合形成反応に頼ることが多かったため、化合物空間が平面的な低分子に偏りやすかった。そのようなライブラリーから有望なヒット化合物を見出すことが益々困難となっている現状から、比較的複雑な基本骨格を有する天然物型化合物の重要性が再認識されている。一方で、複雑な構造を有する天然物は基本骨格の構築に多段階を要するため、これが創薬展開の大きな障壁となっている。本研究は、天然物創薬研究におけるこれらの課題の解決を図るものとして、学術的および社会的に重要であると考えている。

研究成果の概要(英文)：This is a basic study for natural-product-based drug discovery, conducting the direct construction of heterocyclic compounds and synthesis of biologically-active indole alkaloids. We have developed the gold-catalyzed cascade cyclization reactions for the synthesis of fused carbazoles using azido-alkynes, direct construction of the akuammiline alkaloid scaffold using alkynyl indoles, and the synthesis of acenaphthenes using allenynes. Furthermore, we succeeded in total synthesis of dictyodendrins, construction of the fused indole scaffolds found in aspidophylline A and ergot alkaloids, and obtained promising biologically active compounds.

研究分野：有機合成化学、医薬品化学

キーワード：天然物合成 連続反応 アルカロイド 金触媒 創薬 多環式芳香族化合物

様式 C-19、F-19-1、Z-19 (共通)

1. 研究開始当初の背景

コンビナトリアルケミストリーとハイスループットスクリーニングの発展により、多数の化合物を一挙に合成しアッセイすることが可能になった。一方で、アッセイに供する化合物の合成は、アミド結合やクロスカップリング等の sp^2 炭素を利用した結合形成反応に頼ることが多いため、化合物ライブラリーは平面構造を有する低分子の網羅的集合体となりやすい。そのようなライブラリーから有望なヒット化合物を見出すことが益々困難となっているため、複雑な基本骨格を有する天然物型化合物の重要性が再認識されている。天然物は古くから創薬研究の重要な役割を担ってきたが、複雑な構造を有する天然物の創薬展開には大きな制約がある。これは、基本骨格の構築に多段階を要するため、多くの場合において関連天然物を出発原料とする半合成によって合成展開が実施されることに起因する。半合成は基本骨格の構造が出発物質に規定されるため、基本骨格の変換や構造修飾が困難である。このような背景から、複雑な天然物骨格を簡便に構築する方法論の開発が強く望まれている。

2. 研究の目的

天然物型ドラッグライク化合物の基本骨格を一挙に構築することが可能となれば、有用な創薬リードを創出する行う上で極めて有用な方法論となりうる。一方で、環境調和型・省資源型の合成化学が求められる現代においては、廃棄物の少ない反応系を構築することが強く求められる。そこで我々は、複素環骨格一挙構築法の開発と生物活性インドールアルカロイドの全合成研究を通じて、複雑な骨格を有する天然物型ドラッグライク化合物をリードとする創薬研究の基盤を築くことを目的として、本研究に着手した。

3. 研究の方法

(1) [4+2] 型カルバゾール合成法の開発とディクチオデンドリン類の合成研究

ディクチオデンドリン類はテロメラーゼ阻害活性を示すことから、新規抗癌剤のリード化合物として近年注目されている。研究開始当時において、ディクチオデンドリンの全合成はすでに数例の報告があったが、創薬展開は行われていなかった。これは、基本骨格のピロロカルバゾール構造が多様性指向型合成の障壁となっているためである。我々は、独自に開発した [4+2] 型インドール合成が 4,7-ジアリールインドール構造の構築に威力を発揮する特性を利用して、収束的で挑戦的なディクチオデンドリン骨格構築法を立案し、骨格構築反応の検討と全合成研究に着手した。さらに、合成した天然物誘導体を用いた生物活性評価も実施した。

(2) 縮環インドレニン形成反応を用いたアクアミリンアルカロイドの合成研究

アクアミリンアルカロイドは、高度に縮環したかご状構造と幅広い生物活性を有することから、多くの合成化学者の関心を集めている。中でもストリクタミンは国内外で精力的に合成研究が行われてきたが、2016 年まで全合成は報告されていなかった。我々は以前より、テトラヒドロカルボリン誘導体に対し金触媒を作用させることで、ストリクタミンの四環性縮環インドレニン骨格を構築する独自の合成戦略を検討してきた。本研究では、この合成戦略を連続環化反応に展開し、アスピドフィリン A 骨格の構築を検討した。ストリクタミン合成の不斉化についても検討を加えた。

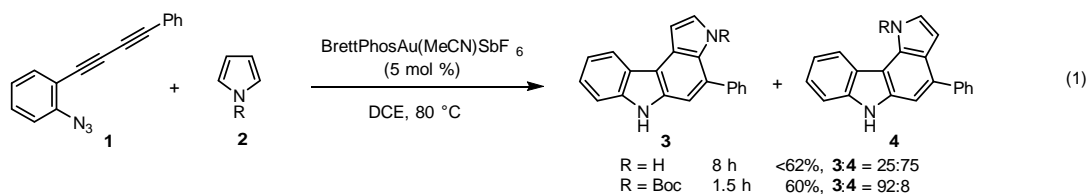
(3) アレンインの連続環化反応と麦角アルカロイド型縮環インドール骨格の構築

オルトフェニレンをテザーとするアレンインの金触媒反応を検討し、麦角アルカロイド型縮環インドール骨格構築への展開を行った。

4. 研究成果

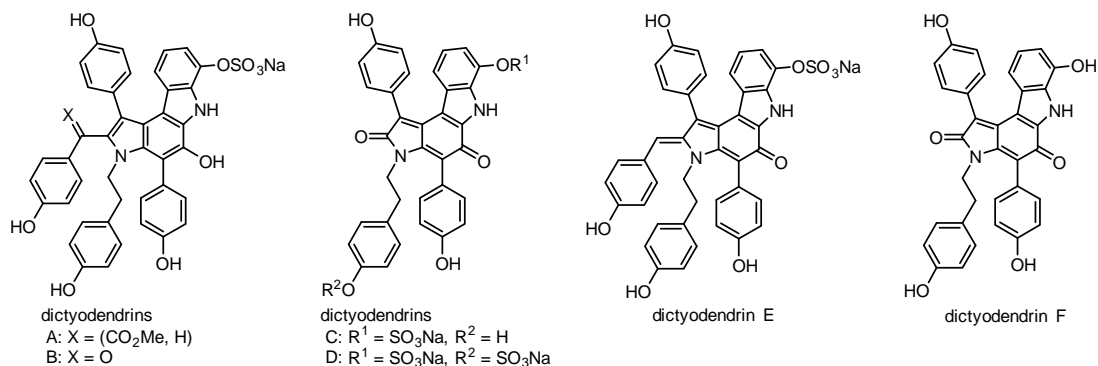
(1) [4+2] 型カルバゾール合成法の開発とディクチオデンドリン類の合成研究

アジドジエン **1** とピロール **2** の分子間反応を用いたピロロカルバゾール合成反応を検討した結果、ピロール窒素上に Boc 基を導入することにより、目的の位置選択性で反応が進行することを見出した (式 1)。



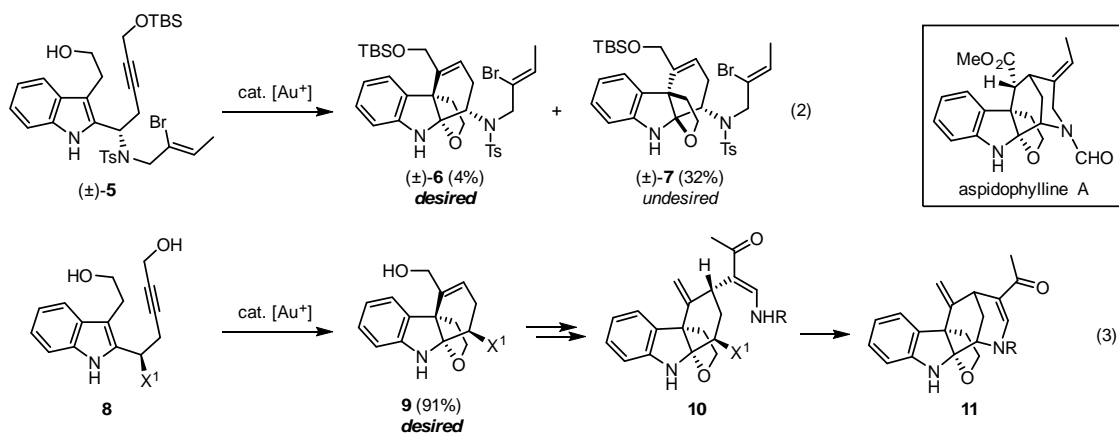
得られたピロロカルバゾールに対し順次置換基を導入し、ディクチオデンドリン A, B, C, D, E, および F の全合成または形式全合成を達成した。引き続き、得られたディクチオデンドリン誘導体の生物活性評価を行ったところ、簡略化した構造を有するディクチオデンドリン誘導体の

一部が天然物と同等以上の細胞増殖抑制活性を示すことを明らかにした。さらに、キナーゼプロファイリング試験の結果、ピロロカルバゾールがキナーゼテンプレートとして有望であることが明らかとなった。



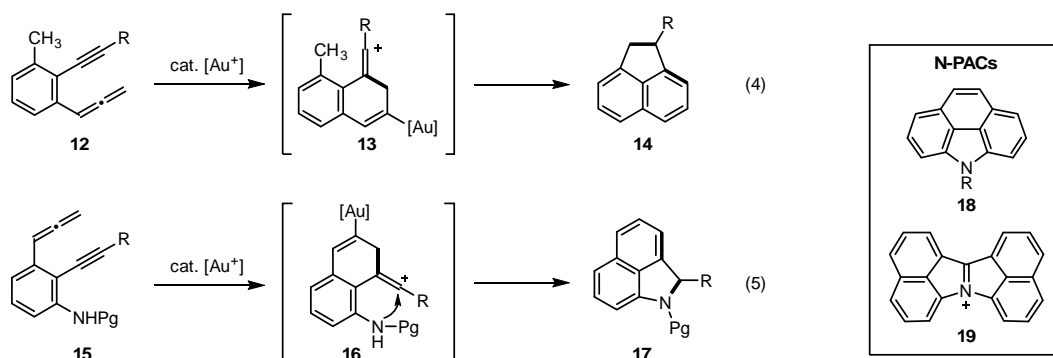
(2) 縮環インドレニン形成反応を用いたアクアミンアルカロイドの合成研究

本項目ではアスピドフィリン A の合成研究を行った。最初にアミノ基を有する環化前駆体 **5** を合成し、金触媒連続環化反応を検討したところ、目的と逆の立体選択性で反応が進行した(式 2)。そこで次に酸素官能基を有する環化前駆体 **8** の環化反応を行った結果、目的の立体化学を有する四環性インドリン **9** を選択的に得ることに成功した(式 3)。引き続き、得られた **9** に対して C4 ユニットの導入、クライゼン転位、および **10** の分子内環化反応によって、アスピドフィリン A の基本骨格を有する **11** を得ることができた。この他、ストリクタミンの不斉合成を検討し、キラルスルホキッドを不斉補助基とする合成戦略によって不斉形式全合成を達成した。



(3) アレニンの連続環化反応と麦角アルカロイド型縮環インドール骨格の構築

アルキンのオルト位にメチル基を有するアレニン **12** に金触媒を作用させると、興味深いアセナフテン形成反応が進行することを見出した。引き続き、アレニンの環化反応によって生じるビニルカチオンを窒素置換基でトラップすることで、麦角アルカロイド等に存在する三環性インドール骨格を構築することを考えた。オルト位にアミノ基を有するアレニン **15** に対して金触媒を作用させると、炭素-炭素結合形成反応に引き続いて炭素-窒素結合形成反応が進行し、ナフタレン縮環型ピロール誘導体 **17** が得られることを見出した。さらに、アルキン末端にアリールハライド部位やアシル基を有する基質を用いた金触媒連続環化反応により、含窒素多環式芳香族化合物 (N-PAC) **18** および **19** を合成することに成功した。得られた N-PAC の一部は興味深い会合特性を示した。



5. 主な発表論文等

〔雑誌論文〕 計15件（うち査読付論文 0件 / うち国際共著 0件 / うちオープンアクセス 0件）

1. 著者名 Ohno Hiroaki, Inuki Shinsuke	4. 巻 19
2. 論文標題 Nonbiomimetic total synthesis of indole alkaloids using alkyne-based strategies	5. 発行年 2021年
3. 雑誌名 Organic & Biomolecular Chemistry	6. 最初と最後の頁 3551 ~ 3568
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1039/D00B02577A	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -
1. 著者名 Takeuchi Haruka, Inuki Shinsuke, Nakagawa Kohei, Kawabe Takaaki, Ichimura Atsuhiko, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 59
2. 論文標題 Total Synthesis of Zephyrcarinatines via Photocatalytic Reductive Radical ipso Cyclization	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 Angewandte Chemie International Edition	6. 最初と最後の頁 21210 ~ 21215
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/anie.202009399	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -
1. 著者名 Matsuoka Takuro, Inuki Shinsuke, Miyagawa Takashi, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 85
2. 論文標題 Total Synthesis of (+)-Polyoxamic Acid via Visible-Light-Mediated Photocatalytic α -Scission and 1,5-Hydrogen Atom Transfer of Glucose Derivative	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 The Journal of Organic Chemistry	6. 最初と最後の頁 8271 ~ 8278
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.joc.0c00910	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -
1. 著者名 Matsuoka Junpei, Inuki Shinsuke, Matsuda Yuka, Miyamoto Yoichi, Otani Mayumi, Oka Masahiro, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 26
2. 論文標題 Total Synthesis of Dictyodendrins A-F by the Gold Catalyzed Cascade Cyclization of Conjugated Diyne with Pyrrole	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 Chemistry-A European Journal	6. 最初と最後の頁 11150 ~ 11157
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/chem.202001950	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Yamaguchi Ayuta, Inuki Shinsuke, Tokimizu Yusuke, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 85
2. 論文標題 Gold(I)-Catalyzed Cascade Cyclization of Anilines with Dienes: Controllable Formation of Eight-Membered Ring-Fused Indoles and Propellane-Type Indolines	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 The Journal of Organic Chemistry	6. 最初と最後の頁 2543 ~ 2559
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.joc.9b03256	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Matsuoka Junpei, Kumagai Hiroshi, Inuki Shinsuke, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 84
2. 論文標題 Construction of the Pyrrolo[2,3-d]carbazole Core of Spiroindoline Alkaloids by Gold-Catalyzed Cascade Cyclization of Ynamide	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 The Journal of Organic Chemistry	6. 最初と最後の頁 9358 ~ 9363
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.joc.9b01149	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Miyagawa Takashi, Inuki Shinsuke, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 21
2. 論文標題 Construction of Quaternary Carbon Stereocenter of β -Tertiary Amine through Remote C-H Functionalization of Tris Derivatives: Enantioselective Total Synthesis of Myriocin	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 Organic Letters	6. 最初と最後の頁 5485 ~ 5490
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.orglett.9b01778	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Ikeuchi Takaya, Inuki Shinsuke, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 58
2. 論文標題 Gold(I) Catalyzed Cascade Cyclization Reactions of Allenynes for the Synthesis of Fused Cyclopropanes and Acenaphthenes	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 Angewandte Chemie International Edition	6. 最初と最後の頁 7792 ~ 7796
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/anie.201903384	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Kawada Yuiki, Ohmura Shunsuke, Kobayashi Misaki, Nojo Wataru, Kondo Masaki, Matsuda Yuka, Matsuoka Junpei, Inuki Shinsuke, Oishi Shinya, Wang Chao, Saito Tatsuo, Uchiyama Masanobu, Suzuki Takanori, Ohno Hiroaki	4. 巻 9
2. 論文標題 Direct synthesis of aryl-annulated [c]carbazoles by gold(I)-catalysed cascade reaction of azide-diyne and arenes	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Chemical Science	6. 最初と最後の頁 8416 ~ 8425
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1039/C8SC03525C	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Hamada Naoka, Yamaguchi Ayuta, Inuki Shinsuke, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 20
2. 論文標題 Gold(I)-Catalyzed Oxidative Cascade Cyclization of 1,4-Diyn-3-ones for the Construction of Tropone-Fused Furan Scaffolds	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Organic Letters	6. 最初と最後の頁 4401 ~ 4405
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.orglett.8b01524	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Inuki Shinsuke, Miyagawa Takashi, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 66
2. 論文標題 Introduction of a Polar Functional Group to the Lipid Tail of 4-epi-Jaspine B Affects Sphingosine Kinase Isoform Selectivity	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Chemical and Pharmaceutical Bulletin	6. 最初と最後の頁 866 ~ 872
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1248/cpb.c18-00366	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Miyagawa Takashi, Inuki Shinsuke, Honda Maho, Nakamura Shinya, Nakanishi Isao, Fujii Nobutaka, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 74
2. 論文標題 Synthesis of jaspine B regioisomers through palladium-catalyzed stereoselective tetrahydrofuran formation: Insight into the ligand recognition of sphingosine kinases	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Tetrahedron	6. 最初と最後の頁 1802 ~ 1809
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.tet.2018.02.042	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Hamada Naoka, Yoshida Yusuke, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 19
2. 論文標題 Gold-Catalyzed Cascade Reaction of Skipped Diynes for the Construction of a Cyclohepta[b]pyrrole Scaffold	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Organic Letters	6. 最初と最後の頁 3875 ~ 3878
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.orglett.7b01759	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Matsuoka Junpei, Matsuda Yuka, Kawada Yuiki, Oishi Shinya, Ohno Hiroaki	4. 巻 56
2. 論文標題 Total Synthesis of Dictyodendrins by the Gold-Catalyzed Cascade Cyclization of Conjugated Diynes with Pyrroles	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Angewandte Chemie International Edition	6. 最初と最後の頁 7444 ~ 7448
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/anie.201703279	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Ohno Hiroaki, Honda Maho, Hamada Naoka, Miyagaki Jun, Iwata Akira, Otsuki Kazuhiro, Maruyama Toru, Nakamura Shinya, Nakanishi Isao, Inuki Shinsuke, Fujii Nobutaka, Oishi Shinya	4. 巻 25
2. 論文標題 Identification of selective inhibitors of sphingosine kinases 1 and 2 through a structure-activity relationship study of 4-epi-jaspine B	5. 発行年 2017年
3. 雑誌名 Bioorganic & Medicinal Chemistry	6. 最初と最後の頁 3046 ~ 3052
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.bmc.2017.03.059	査読の有無 無
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

〔学会発表〕 計31件 (うち招待講演 9件 / うち国際学会 14件)

1. 発表者名 松岡巧朗, 井貫晋輔, 宮川貴吏, 大石真也, 大野浩章
2. 発表標題 可視光レドックス触媒による 開裂・C(sp ³)-C(sp ³)1,5-HAT連続反応を利用した(+)-polyoxamic acidの全合成
3. 学会等名 第62回天然有機化合物討論会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 小松紘樹, 池内貴哉, 大石真也, 井貫晋輔, 大野浩章
2. 発表標題 金触媒を用いたアレンインの連続環化反応による含窒素複素環骨格の構築
3. 学会等名 第70回日本薬学会関西支部大会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 井貫晋輔, 竹内春佳, 中川航平, 川邊隆彰, 市村敦彦, 大石真也, 大野浩章
2. 発表標題 可視光レドックス触媒を用いたラジカルipso環化反応を鍵とするZephycarinatine CおよびDの全合成
3. 学会等名 反応と合成の進歩2020特別企画シンポジウム
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 大野浩章
2. 発表標題 生合成を模倣しない戦略によるインドールアルカロイドの全合成研究
3. 学会等名 日本薬学会第141年会 (招待講演)
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 橋本直季, 田口淳一, 大石真也, 井貫晋輔, 大野浩章
2. 発表標題 金触媒連続環化反応を基盤としたPicrinineの合成研究
3. 学会等名 日本薬学会第141年会
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 島恭平, 大石真也, 井貫晋輔, 大野浩章
2. 発表標題 金触媒を用いたアルキンのヒドロアリール化による縮環型インドレニン骨格の構築
3. 学会等名 日本薬学会第141年会
4. 発表年 2021年

1. 発表者名 Junpei Matsuoka, Yuka Matsuda, Yuiki Kawada, Shinsuke Inuki, Shinya Oishi, Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Total synthesis of dictyodendrins by the gold-catalyzed cascade cyclization of conjugated diynes with pyrroles
3. 学会等名 The 11th Seoul-Kyoto-Osaka Joint Symposium on Pharmaceutical Sciences for Young Scientists (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Gold-Catalyzed Cascade Cyclization Reactions via C-H Bond Cleavage
3. 学会等名 The 47th Naito Conference (招待講演) (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Gold-Catalyzed C-C bond Formation and Its Application to Alkaloid Synthesis
3. 学会等名 Technische Universitat Wien Special Lecture (招待講演) (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 田口淳一, 奥村怜司, 大原礼子, 井貫晋輔, 大石真也, 大野浩章
2. 発表標題 金触媒を用いた分子内連続環化反応を基盤としたAspidophylline Aの全合成研究
3. 学会等名 第39回有機合成若手セミナー
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Ayuta Yamaguchi, Shinsuke Inuki, Yusuke Tokimizu, Shinya Oishi, Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Gold-Catalyzed Cascade Cyclization of Anilines with Diynes: Controllable Formation of Eight-Membered Ring Fused Indoles and Propellane-Type Indolines
3. 学会等名 27th International Society of Heterocyclic Chemistry Congress (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Junichi Taguchi, Reiji Okumura, Ayako Ohara, Shinsuke Inuki, Shinya Oishi and Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Synthetic Study of Aspidophylline A Based on Gold(I)-Catalyzed Cascade Cyclization
3. 学会等名 27th International Society of Heterocyclic Chemistry Congress (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Junpei Matsuoka, Yuka Matsuda, Yuiki Kawada, Shinsuke Inuki, Shinya Oishi, Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Total Synthesis of Dictyodendrins by the Gold-Catalyzed Cascade Cyclization of Conjugated Diynes with Pyrroles
3. 学会等名 27th International Society of Heterocyclic Chemistry Congress (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 松岡純平、松田優佳、川田惟樹、井貫晋輔、大石真也、大野浩章
2. 発表標題 Dicytodendrin 類の多様性志向型全合成
3. 学会等名 第61回天然有機化合物討論会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Gold-Catalyzed Cascade Cyclization for Fused Ring Construction
3. 学会等名 The 8th Japanese-Sino Symposium on Organic Chemistry for Young Scientists (招待講演) (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Ayuta Yamaguchi, Shinsuke Inuki, Yusuke Tokimizu, Shinya Oishi, Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Controllable Formation of Oxocine-Fused Indoles and Propellane-Type Indolines via Gold-Catalyzed Cascade Cyclization
3. 学会等名 The 8th Japanese-Sino Symposium on Organic Chemistry for Young Scientists (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Junichi Taguchi, Reiji Okumura, Ayako Ohara, Shinsuke Inuki, Shinya Oishi, Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Gold-Catalyzed Cascade Cyclization of Alkynyl Tryptophol Derivatives: Synthetic Strategy for Aspidophylline A
3. 学会等名 The 8th Japanese-Sino Symposium on Organic Chemistry for Young Scientists (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 松岡純平、松田優佳、川田惟樹、井貫晋輔、大石真也、大野浩章
2. 発表標題 Dicytodendrin 類の多様性志向型全合成
3. 学会等名 第69回日本薬学会関西支部総会・大会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 大野浩章
2. 発表標題 金触媒を用いた複素環骨格の構築とアルカロイドの全合成
3. 学会等名 第53回天然物化学談話会（招待講演）
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 池内貴哉、井貫晋輔、大石真也、大野浩章
2. 発表標題 Synthesis of Fused Cyclopropanes via Gold-Catalyzed Cascade Cyclization of Allenynes
3. 学会等名 JGP Chem & ChemEn International Workshop: Sustainability-Oriented Organic Synthesis (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 田口淳一、奥村怜司、大原礼子、井貫晋輔、大石真也、大野浩章
2. 発表標題 Synthetic Study of Akuammiline Alkaloids Based on Gold(I)-Catalyzed Cascade Cyclization
3. 学会等名 JGP Chem & ChemEn International Workshop: Sustainability-Oriented Organic Synthesis (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 大野浩章
2. 発表標題 天然物骨格一挙構築法の開発と応用
3. 学会等名 京大テックフォーラム (招待講演)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 松岡純平、松田優佳、川田惟樹、大石真也、大野浩章
2. 発表標題 Dictyodendrin類の多様性志向型全合成
3. 学会等名 「有機合成化学を起点とするものづくり戦略」 最終シンポジウム
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Gold-Catalyzed C-C bond Formation and Its Application to Alkaloid Synthesis
3. 学会等名 1st NCTU Conference on Advanced Organic Synthesis (招待講演) (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 田口淳一、奥村怜司、大原礼子、井貫晋輔、大石真也、大野浩章
2. 発表標題 金触媒連続環化反応を基盤としたAspidophylline Aの全合成研究
3. 学会等名 日本薬学会第139年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Direct Construction of Fused Nitrogen Heterocycles by Gold-Catalyzed Cascade Cyclizations
3. 学会等名 Nordic/Kyoto OMCOS 2017 (招待講演) (国際学会)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 大野浩章
2. 発表標題 金触媒によるアルカロイド型骨格の構築と全合成研究
3. 学会等名 第37回有機合成若手セミナー (招待講演)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 Junpei Matsuoka, Yuka Matsuda, Yuiki Kawada, Shinya Oishi, Hiroaki Ohno
2. 発表標題 Total Synthesis of Dictyodendrins by the Gold-Catalyzed Intermolecular Cascade Cyclization of Conjugated Diynes with Pyrroles
3. 学会等名 254th ACS National Meeting (国際学会)
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 奥村怜司、大原礼子、熊谷洋、大石真也、大野浩章
2. 発表標題 金触媒を用いた分子内連続環化反応を基盤としたAspidophylline Aの全合成研究
3. 学会等名 第59回天然有機化合物討論会
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 松岡純平, 松田優佳, 川田惟樹, 大石真也, 大野浩章
2. 発表標題 Dictyodendrin類の網羅的全合成と誘導体の活性評価
3. 学会等名 第43回反応と合成の進歩シンポジウム
4. 発表年 2017年

1. 発表者名 濱田直佳, 吉田勇介, 大石真也, 大野浩章
2. 発表標題 金触媒を用いたスキップジインの連続反応によるシクロヘプタ[b]ピロール骨格の構築
3. 学会等名 第43回反応と合成の進歩シンポジウム
4. 発表年 2017年

〔図書〕 計0件

〔産業財産権〕

〔その他〕

研究室ホームページ http://www.pharm.kyoto-u.ac.jp/seizo/
--

6. 研究組織

	氏名 (ローマ字氏名) (研究者番号)	所属研究機関・部局・職 (機関番号)	備考
研究分担者	井貴 晋輔 (Shinsuke Inuki) (70736272)	京都大学・薬学研究科・准教授 (14301)	

7. 科研費を使用して開催した国際研究集会

〔国際研究集会〕 計0件

8 . 本研究に関連して実施した国際共同研究の実施状況

共同研究相手国	相手方研究機関
---------	---------