

平成28年度医療研究開発推進事業費補助金
(創薬等ライフサイエンス研究支援基盤事業) 補助事業成果報告書

I. 基本情報

事業名：創薬等ライフサイエンス研究支援基盤事業（創薬等支援技術基盤プラットフォーム事業）
Platform Project for Supporting Drug Discovery and Life Science Research
(Platform for Drug discovery, Informatics, and Structural life science)

補助事業課題名：（日本語）ヒット化合物の標的分子同定技術の高度化・共用による革新的創薬支援
（英語）Supporting the innovative drug discovery by developing and sharing
technologies for target identification of screening hit compounds

補助事業担当者 （日本語）東京医科歯科大学 生体材料工学研究所 教授 細谷孝充
所属 役職 氏名：（英語）Takamitsu Hosoya, Professor, Institute of Biomaterials and
Bioengineering, Tokyo Medical and Dental University

実施期間：平成 28 年 4 月 1 日 ～ 平成 29 年 3 月 31 日

II. 成果の概要（総括研究報告）

本補助事業の制御拠点合成領域の機関として参画し、化合物ライブラリーを用いたスクリーニング等から得られたヒット化合物の構造展開をはじめ、ライフサイエンス研究者が必要とする小分子に関する合成支援を行った。なかでも、標的タンパク質が未知のヒット化合物に関して、独自の合成基盤技術に基づいて標的同定用プローブを開発し、標的タンパク質の同定を支援するとともに、類縁体の合成による構造展開を行った。具体的には、本事業内での連携として、制御拠点内では、スクリーニング領域の京都大学院医 萩原教授、東京大学院薬 一條教授、東北大学院医（現 佐賀大学）辻田講師らが進める複数の研究テーマに対して、生物活性化合物の合成展開や標的の同定などを支援した。加えて、制御拠点合成領域の東京薬科大学 林教授に対して、標的の同定プローブ合成用のビルディングブロックを提供した。また、本事業内の拠点間連携として、解析拠点生産領域の理化学研究所 梅原ユニットリーダーに対して、共結晶作製において有用な基盤技術開発の支援にも取り組んだ。さらに、解析拠点生産領域の京都大学院医 小林拓也准教授への化合物合成支援も行った。また、東京医科歯科大学の清水教授、畑教授、仁科教授、内田教授、理化学研究所の渡辺センター長がそれぞれ進めている複数の研究テーマに対して、構

造展開・標的同定・イメージングに関する合成支援を行った。

標的同定支援に関する高度化研究としては、ヒット化合物が得られた際に迅速なプローブ化を可能にする基盤合成技術の開発に成功した。さらに、アジド化合物の標識に有用な機能性環状アルキンを簡便に合成するための手法として、銅塩を用いる環状アルキン類の保護法の開発に成功した。また、医薬品開発に関連する基礎研究支援のための高度化として、新たな疎水性ファーマコフォアについての研究を進めるとともに代謝安定性の向上を目指したジペプチドイソスターの合成研究を進展させることができた。加えて、化合物ライブラリーの効率的な拡充を念頭に、ベンザインなどの中間体を利用し、多様性に富んだ **drug-like** な化合物の効率的な合成に役立つ多彩な手法の開発にも成功した。また、合成した化合物群の一部を拠点機関の化合物ライブラリーへ供出するとともに、それらのバックアップおよび周辺類縁体を本学内のライブラリーに登録・管理することで、さらに多くの研究者に広く利用してもらうことを念頭にライブラリーの充実を図った。

We supported several life-science researchers by syntheses of small compounds, including screening-hit-compounds discovered using a chemical library. In particular, we supported to identify unknown target proteins of the hit compounds and also synthesized analogues of the hit compounds. As the cooperation under the control of the platform project for drug discovery, informatics, and structural life science, we supported Prof. Hagiwara at Graduate School of Medicine, Kyoto Univ., Prof. Ichijo at Graduate School of Pharmaceutical Sciences, the Univ. of Tokyo, and Lecturer Tsujita at Graduate School of Medicine, Tohoku Univ. (present address: Saga Univ.), who belong to the screening region, through the syntheses of small compounds and probes for target identification. We also provided a building block for the synthesis of a probe for target identification to Prof. Hayashi at Tokyo Pharmaceutical Univ. As the cooperation with the analysis platform, we supported Dr. Umehara, unit leader at RIKEN, by the development of a method for preparing a cocrystal between a target protein and a small molecule. We also synthetically supported Assoc. Prof. Kobayashi at Graduate School of Medicine, Kyoto Univ., who also belongs to the analysis platform. We supported Prof. Shimizu, Prof. Hata, Prof. Nishina, and Prof. Uchida at Tokyo Med. and Dent. Univ., and Prof. Watanabe at RIKEN CLST through the synthesis of bioactive compounds, probes for target identification, and imaging probes.

As an advancement research for the target protein identification technology, we developed a basic synthetic method that enabled efficient preparation of a probe for target identification when a screening-hit-compound is identified. We also developed a transient protection method of cycloalkynes using a copper salt that enabled facile preparation of functional cycloalkynes useful in labeling of an azido-incorporated biomolecules. To advance basic researches useful for drug discovery, we also performed studies on new hydrophobic pharmacophores and dipeptide isosters that would be useful to improve the metabolic stability of the drug candidates. A wide variety of synthetic methods, including that via benzyne intermediates, were developed to expand the chemical library efficiently. A part of the synthesized compounds was registered to the chemical library of the hub facility and also to the chemical library at Tokyo Med. and Dent. Univ., to which backup and related compounds were also registered.

III. 成果の外部への発表

(1) 学会誌・雑誌等における論文一覧 (国内誌 0 件、国際誌 90 件)

1. Narumi T, Kobayakawa T, Aikawa H, Seike S, Tamamura H. Stereoselective formation of trisubstituted (Z)-chloroalkenes adjacent to a tertiary carbon stereogenic center by organocuprate-mediated reduction/alkylation. *Org. Lett.*, 2012, 14(17), 4490–4493.
2. Hirano T, Kubo H, Shiraishi T, Hiromoto K, Fujiwara T, Kagechika H. Fluorescent properties of coumarins with dual functions constructed by two sequential reactions. *Tetrahedron Lett.*, 2012, 53(44), 5916–5919.
3. Persaud SD, Lin YW, Wu CY, Kagechika H, Wei LN. Cellular retinoic acid binding protein I mediates rapid non-canonical activation of ERK1/2 by all-trans retinoic acid. *Cell Signal*, 2013, 25(1), 19–25.
4. Narumi T, Aikawa H, Tanaka T, Hashimoto C, Ohashi N, Nomura W, Kobayakawa T, Takano H, Hirota Y, Murakami T, Yamamoto N, Tamamura H. Low-molecular-weight CXCR4 ligands with variable spacers. *ChemMedChem*, 2013, 8(1), 118–124.
5. Ohta K, Kawachi E, Shudo K, Kagechika H. Structure-activity relationship study on benzoic acid part of diphenylamine-based retinoids. *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, 2013, 23(1), 81–84.
6. Fujii S, Miyajima Y, Masuno H, Kagechika H. Increased hydrophobicity and estrogenic activity of simple phenols with silicon and germanium-containing substituents. *J. Med. Chem.*, 2013, 56(1), 160–166.
7. Matsumura M, Tanatani A, Azumaya I, Masu H, Hashizume D, Kagechika H, Muranaka A, Uchiyama M. Unusual conformational preference of an aromatic secondary urea: solvent-dependent open-closed conformational switching of *N,N'*-bis(porphyrinyl)urea. *Chem. Commun.*, 2013, 49, 2290–2292.
8. Niwa H, Handa N, Tomabeche Y, Honda K, Toyama M, Ohsawa N, Shirouzu M, Kagechika H, Hirano T, Umehara T, Yokoyama S. Structures of histone methyltransferase SET7/9 in complexes with adenosylmethionine derivatives. *Acta Crystallogr. D. Biol. Crystallogr.*, 2013, 69(Pt 4), 595–602.
9. Yoshida S, Hosoya T. Synthesis of Diverse Aromatic Oxophosphorus Compounds by the Michaelis–Arbuzov-type Reaction of Arynes. *Chem. Lett.*, 2013, 42(6), 583–585.
10. Sumida Y, Kato T, Hosoya T. Generation of Arynes via Ate Complexes of Arylboronic Esters with an *ortho*-Leaving Group. *Org. Lett.*, 2013, 15(11), 2806–2809.
11. Inouye S, Sato J-i, Sahara-Miura Y, Yoshida S, Kurakata H, Hosoya T. C6-Deoxy coelenterazine analogues as an efficient substrate for glow luminescence reaction of nanoKAZ: the mutated catalytic 19 kDa component of *Oplophorus* luciferase. *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, 2013, 437(1), 23–28.
12. Kanazawa J, Takita R, Jankowiak A, Fujii S, Kagechika H, Hashizume D, Shudo K, Kaszyński P, Uchiyama M. Copper-mediated C-C cross-coupling reaction of monocarba-*closo*-dodecaborate anion for construction of functional molecules. *Angew. Chem. Int. Ed.*, 2013, 52(31), 8017–8021.
13. Mori T, Kikuchi E, Watanabe Y, Fujii S, Ishigami-Yuasa M, Kagechika H, Sohara E, Rai T, Sasaki S, Uchida S. Chemical library screening for WNK signalling inhibitors using fluorescence correlation spectroscopy. *Biochem. J.*, 2013, 455(3), 339–345.
14. Yamada A, Fujii S, Mori S, Kagechika H. Design and synthesis of 4-(4-benzoylamino-phenoxy)phenol derivatives as androgen receptor antagonists. *ACS Med. Chem. Lett.*, 2013, 4(10), 937–941.

15. Narumi T, Arai H, Yoshimura K, Harada S, Hirota Y, Ohashi N, Hashimoto C, Nomura W, Matsushita S, Tamamura H. CD4 mimics as HIV entry inhibitors: lead optimization studies of the aromatic substituents. *Bioorg. Med. Chem.*, 2013, 21(9), 2518-2526.
16. Nomura W, Hashimoto C, Suzuki T, Ohashi N, Fujino M, Murakami T, Yamamoto N, Tamamura H. Multimerized CHR-derived peptides as HIV-1 fusion inhibitors. *Bioorg. Med. Chem.*, 2013, 21(15), 4452-4458.
17. Ohashi N, Nomura W, Narumi T, Tamamura H. Peptide-based ligand screening and functional analysis of protein kinase C. *Biopolymers*, 2013, 100(6), 613-620.
18. Nomura W, Aikawa H, Ohashi N, Urano E, Métifiot M, Fujino M, Maddali K, Ozaki T, Nozue A, Narumi T, Hashimoto C, Tanaka T, Pommier Y, Yamamoto N, Komano JA, Murakami T, Tamamura H. Cell-permeable stapled peptides based on HIV-1 integrase inhibitors derived from HIV-1 gene products. *ACS Chem. Biol.*, 2013, 8(10), 2235-2244.
19. Otsuki H, Hishiki T, Miura T, Hashimoto C, Narumi T, Tamamura H, Yoshimura K, Matsushita S, Igarashi T. Generation of a replication-competent simian-human immunodeficiency virus, the neutralization sensitivity of which can be enhanced in the presence of a small-molecule CD4 mimic. *J. Gen. Virol.*, 2013, 94(Pt 12), 2710-2716.
20. Hashimoto C, Nomura W, Narumi T, Fujino M, Tsutsumi H, Haseyama M, Yamamoto N, Murakami T, Tamamura H. Anti-HIV-1 Peptide Derivatives Based on the HIV-1 Co-receptor CXCR4. *ChemMedChem*, 2013, 8(10), 1668-1672.
21. Hashimoto C, Nomura W, Narumi T, Fujino M, Nakahara T, Yamamoto N, Murakami T, Tamamura H. CXCR4-derived synthetic peptides inducing anti-HIV-1 antibodies. *Bioorg. Med. Chem.*, 2013, 21(22), 6878-6885.
22. Hashimoto C, Narumi T, Otsuki H, Hirota Y, Arai H, Yoshimura K, Harada S, Ohashi N, Nomura W, Miura T, Igarashi T, Matsushita S, Tamamura H. A CD4 mimic as an HIV entry inhibitor: Pharmacokinetics. *Bioorg. Med. Chem.*, 2013, 21(24), 7884-7889.
23. Inouye S, Sato J-i, Sahara-Miura Y, Yoshida S, Hosoya T. Luminescence enhancement of the catalytic 19 kDa protein (KAZ) of *Oplophorus* luciferase by three amino acid substitutions. *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, 2014, 445(1), 157-162.
24. Yoshida S, Uchida K, Hosoya T. Generation of Arynes Triggered by Sulfoxide-Metal Exchange Reaction of *ortho*-Sulfinylaryl Triflates. *Chem. Lett.*, 2014, 43(1), 116-118.
25. Fujii S, Kano A, Songkram C, Masuno H, Taoda Y, Kawachi E, Hirano T, Tanatani A, Kagechika H. Synthesis and structure-activity relationship of *p*-carborane-based non-secosteroidal vitamin D analogs, *Bioorg. Med. Chem.*, 2014, 22(4), 1227-1235.
26. Yang ZY, Nakagawa K, Sarkar A, Maruyama J, Iwasa H, Bao YJ, Ishigami-Yuasa M, Ito S, Kagechika H, Hata S, Nishina H, Abe S, Kitagawa M, Hata Y. Screening with a Novel Cell-Based Assay for TAZ Activators Identifies a Compound That Enhances Myogenesis in C2C12 Cells and Facilitates Muscle Repair in a Muscle Injury Model. *Mol. Cell. Biol.*, 2014, 34(9), 1607-1621.
27. Yoshida S, Misawa Y, Hosoya T. Formal C-H-Azidation Based Shortcut to Diazido Building Blocks for the Versatile Preparation of Photoaffinity Labeling Probes. *Eur. J. Org. Chem.*, 2014, 2014(19), 3991-3995.

28. Sumida Y, Harada R, Kato–Sumida T, Johmoto K, Uekusa H, Hosoya T. Boron-Selective Biaryl Coupling Approach to Versatile Dibenzoxaborins and Application to Concise Synthesis of Defucogilvocarcin M. *Org. Lett.*, 2014, 16(23), 6240–6243.
29. Yoshida S, Uchida K, Igawa K, Tomooka K, Hosoya T. An efficient generation method and remarkable reactivities of 3-triflyloxybenzyne. *Chem. Commun.*, 2014, 50, 15059–15062.
30. Yoshida S, Hatakeyama Y, Johmoto K, Uekusa H, Hosoya T. Transient Protection of Strained Alkynes from Click Reaction via Complexation with Copper. *J. Am. Chem. Soc.*, 2014, 136(39), 13590–13593.
31. Yoshida S, Nonaka T, Morita T, Hosoya T. Modular synthesis of bis- and tris-1,2,3-triazoles by permutable sequential azide–aryne and azide–alkyne cycloadditions. *Org. Biomol. Chem.*, 2014, 12, 7489–7493.
32. Yamamoto M, Onogi H, Kii I, Yoshida S, Iida K, Sakai H, Abe M, Tsubota T, Ito N, Hosoya T, Hagiwara M. CDK9 inhibitor FIT-039 prevents replication of multiple DNA viruses. *J. Clin. Invest.*, 2014, 124(8), 3479–3488.
33. Inouye S, Sato J-i, Sahara–Miura Y, Hosoya T, Suzuki T. Unconventional secretion of the mutated 19 kDa protein of *Oplophorus* luciferase (nanoKAZ) in mammalian cells. *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, 2014, 450(4), 1313–1319.
34. Takahashi K, Hosoya T, Onoe K, Doi H, Nagata H, Hiramatsu T, Li X-L, Watanabe Yu, Wada Y, Takashima T, Suzuki M, Onoe H, Watanabe Y. [¹¹C]Cetrozole: an Improved C-[¹¹C]Methylated PET Probe for Aromatase Imaging in the Brain. *J. Nucl. Med.*, 2014, 55(5), 852–857.
35. Fujii S, Nakano E, Yanagida N, Mori S, Masuno H, Kagechika H. Development of p-carborane-based nonsteroidal progesterone receptor antagonists. *Bioorg. Med. Chem.*, 2014, 22(19), 5329–5337.
36. Fujii S, Sekine R, Kano A, Masuno H, Songkram C, Kawachi E, Hirano T, Tanatani A, Kagechika H. Structural development of p-carborane-based potent non-secosteroidal vitamin D analogs. *Bioorg. Med. Chem.*, 2014, 22(21), 5891–5901.
37. Shiraishi T, Saito T, Kagechika H, Hirano T. Development of a novel fluorescent sensor to detect a specific range of pH. *Tetrahedron Lett.*, 2014, 55(50), 6784–6786.
38. Mori S, Takagaki R, Fujii S, Matsumura M, Tanatani, A, Kagechika H. Lipase-catalyzed asymmetric acylation of boron cluster-containing secondary alcohols. *Tetrahedron Asymm.*, 2014, 25(23), 1505–1512.
39. Fujii S, Kobayashi T, Nakatsu A, Miyazawa H, Kagechika H. Synthesis and Structure–Activity Relationship Study of Triazine-Based Inhibitors of the DNA Binding of NF-κB. *Chem. Pharm. Bull.*, 2014, 62(7), 700–708.
40. Fujii S, Yamada A, Nakano E, Takeuchi Y, Mori S, Masuno H, Kagechika H. Design and synthesis of nonsteroidal progesterone receptor antagonists based on C,C'-diphenylcarborane scaffold as a hydrophobic pharmacophore. *Eur. J. Med. Chem.*, 2014, 84, 264–277.
41. Fujii S, Kano A, Masuno H, Songkram C, Kawachi E, Hirano T, Tanatani A, Kagechika H. Design and synthesis of tetraol derivatives of 1,12-dicarba-closo-dodecaborane as non-secosteroidal vitamin D analogs. *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, 2014, 24(18), 4515–4519.
42. Mori S, Takeuchi, Y, Tanatani A, Kagechika H, Fujii S. Development of 1,3-diphenyladamantane derivatives as nonsteroidal progesterone receptor antagonists. *Bioorg. Med. Chem.*, 2015, 23(4), 803–809.
43. Yoshida S, Uchida K, Hosoya T. Generation of Arynes Using Trimethylsilylmethyl Grignard Reagent for Activation of *ortho*-Iodoaryl or *ortho*-Sulfinylaryl Triflates. *Chem. Lett.*, 2015, 44(5), 691–693.

44. Yoshida M, Kataoka N, Miyauchi K, Ohe K, Iida K, Yoshida S, Nojima T, Okuno Y, Onogi H, Usui T, Takeuchi A, Hosoya T, Suzuki T, Hagiwara M. Rectifier of aberrant mRNA splicing recovers tRNA modification in familial dysautonomia. *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 2015, 112(9), 2764–2769.
45. Fujii S, Shimizu A, Takeda N, Oguchi K, Katsurai T, Shirakawa H, Komai M, Kagechika H. Systematic synthesis and anti-inflammatory activity of ω -carboxylated menaquinone derivatives - Investigations on identified and putative vitamin K₂ metabolites. *Bioorg. Med. Chem.*, 2015, 23(10), 2344-2352.
46. Yoshida S, Karaki F, Uchida K, Hosoya T. Generation of cycloheptynes and cyclooctynes via a sulfoxide–magnesium exchange reaction of readily synthesized 2-sulfinylcycloalkenyl triflates. *Chem. Commun.*, 2015, 51(42), 8745-8748.
47. Kobayakawa T, Narumi T, Tamamura H. Remote Stereinduction in the Organocuprate-Mediated Allylic Alkylation of Allylic *gem*-Dichlorides: Highly Diastereoselective Synthesis of (Z)-Chloroalkene Dipeptide Isosteres. *Org. Lett.*, 2015, 17(10), 2302-2305.
48. Morooka S, Hoshina M, Kii I, Okabe T, Kojima H, Inoue N, Okuno Y, Denawa M, Yoshida S, Fukuhara J, Ninomiya K, Ikura T, Furuya T, Nagano T, Noda K, Ishida S, Hosoya T, Ito N, Yoshimura N, Hagiwara M. Identification of a Dual Inhibitor of SRPK1 and CK2 that Attenuates Pathological Angiogenesis of Macular Degeneration in Mice. *Mol. Pharmacol.*, 2015, 88(2), 316-325.
49. Yoshida S, Hazama Y, Sumida Y, Yano T, Hosoya T. An Alternative Method for Generating Arynes from *ortho*-Silylaryl Triflates: Activation by Cesium Carbonate in the Presence of a Crown Ether. *Molecules*, 2015, 20(6), 10131-10140.
50. Masaki S, Kii I, Sumida Y, Kato-Sumida T, Ogawa Y, Ito N, Nakamura M, Sonamoto R, Kataoka N, Hosoya T, Hagiwara M. Design and synthesis of a potent inhibitor of class 1 DYRK kinases as a suppressor of adipogenesis. *Bioorg. Med. Chem.*, 2015, 23(15), 4434-4441.
51. Nomura W, Ohashi N, Mori A, Tamamura H. An In-cell Fluorogenic Tag-probe System for Protein Dynamics Imaging Enabled by Cell-Penetrating Peptides. *Bioconjugate Chem.*, 2015, 26(6), 1080-1085.
52. Yoshida S, Shimomori K, Nonaka T, Hosoya T. Facile Synthesis of Diverse Multisubstituted *ortho*-Silylaryl Triflates via C–H Borylation. *Chem. Lett.*, 2015, 44(10), 1324-1326.
53. Hosoya T, Iimori R, Yoshida S, Sumida Y, Sahara-Miura Y, Sato J-i, Inouye S. Concise Synthesis of *v*-Coelenterazines. *Org. Lett.*, 2015, 17(15), 3888-3891.
54. Mizuguchi T, Ohashi N, Nomura W, Komoriya M, Hashimoto C, Yamamoto N, Murakami T, Tamamura H. Anti-HIV Screening for Cell-Penetrating Peptides Using Chloroquine and Identification of Anti-HIV Peptides Derived from Matrix Proteins. *Bioorg. Med. Chem.*, 2015, 23(15), 4423-4427.
55. Sonamoto R, Kii I, Koike Y, Sumida Y, Kato-Sumida T, Okuno Y, Hosoya T, Hagiwara M. Identification of a DYRK1A Inhibitor that Induces Degradation of the Target Kinase using Co-chaperone CDC37 fused with Luciferase nanoKAZ. *Sci. Rep.*, 2015, 5, 12728.
56. Shiraishi T, Kagechika H, Hirano T. 6-Arylcoumarins: versatile scaffolds for fluorescent sensors. *New J. Chem.*, 2015, 39(11), 8389-8396.
57. Okamoto M, Hidaka A, Toyama M, Hosoya T, Yamamoto M, Hagiwara M, Baba M. Selective inhibition of HIV-1 replication by the CDK9 inhibitor FIT-039. *Antivir. Res.*, 2015, 123, 1-4.

58. Nomura W, Koseki T, Ohashi N, Mizuguchi T, Tamamura H. Trivalent Lignds for CXCR4 Bearing Polyproline Linkers Show Specific Recognition for Cells with Increased CXCR4 Expression. *Org. Biomol. Chem.*, 2015, 13(32), 8734-8739.
59. Inoue K, Urushibara K, Kanai M, Yura K, Fujii S, Ishigami-Yuasa M, Hashimoto Y, Mori S, Kawachi E, Matsumura M, Hirano T, Kagechika H, Tanatani A. Design and synthesis of 4-benzyl-1-(2*H*)-phthalazinone derivatives as novel androgen receptor antagonists. *Eur. J. Med. Chem.*, 2015, 102, 310-319.
60. Yoshida S, Sugimura Y, Hazama Y, Nishiyama Y, Yano T, Shimizu S, Hosoya T. A mild and facile synthesis of aryl and alkenyl sulfides via copper-catalyzed deborylthiolation of organoborons with thiosulfonates. *Chem. Commun.*, 2015, 51(93), 16613-16616.
61. Takano H, Narumi T, Nomura W, Furuta T, Tamamura H. Utilization of the Heavy Atom Effect for the Development of a Photosensitive 8-Azacoumarin-type Photolabile Protecting Group. *Org Lett.*, 2015, 17(21), 5372-5375.
62. Nomura W, Aikawa H, Taketomi S, Tanabe M, Mizuguchi T, Tamamura H. Exploration of Labeling by Near Infrared Dyes on the Polyproline Linker for Bivalent-Type CXCR4 Ligands. *Bioorg. Med. Chem.*, 2015, 23(21), 6967-6973.
63. Yoshida S, Yano T, Misawa Y, Sugimura Y, Igawa K, Shimizu S, Tomooka K, Hosoya T. Direct Thioamination of Arynes via Reaction with Sulfilimines and Migratory *N*-Arylation. *J. Am. Chem. Soc.*, 2015, 137(44), 14071-14074.
64. Nomura W, Mizuguchi T, Tamamura H. Multimerized HIV-gp41-derived Peptides as Fusion Inhibitors and Vaccines. *Biopolymers*, 2015, 106(4), 622-628.
65. Mizuguchi T, Harada S, Miura T, Ohashi N, Narumi T, Mori H, Irahara Y, Yamada Y, Nomura W, Matsushita S, Yoshimura K, Tamamura H. A minimally cytotoxic CD4 mimic as an HIV entry inhibitor. *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, 2016, 26(2), 397-400.
66. Ohashi N, Harada S, Mizuguchi T, Irahara Y, Yamada Y, Kotani M, Nomura W, Matsushita S, Yoshimura K, Tamamura H. Small-Molecule CD4 Mimics Containing Mono-cyclohexyl Moieties as HIV Entry Inhibitors. *ChemMedChem*, 2016, 11(8), 940-946
67. Yoshida S, Shimomori K, Kim Y, Hosoya T. Single C–F Bond Cleavage of Trifluoromethylarenes with an *ortho*-Silyl Group. *Angew. Chem. Int. Ed.*, 2016, 55(35), 10406-10409.
68. Yoshida S, Nakamura Y, Uchida K, Hazama Y, Hosoya T. Aryne Relay Chemistry en Route to Aminoarenes: Synthesis of 3-Aminoaryne Precursors via Regioselective Silylation of 3-(Triflyloxy)arynes. *Org. Lett.*, 2016, 18(23), 6212-6215.
69. Yoshida S, Yano T, Nishiyama Y, Misawa Y, Kondo M, Matsushita T, Igawa K, Tomooka K, Hosoya T. Thiazolobenzyne: a versatile intermediate for multisubstituted benzothiazoles. *Chem. Commun.*, 2016, 52(75), 11199-11202.
70. Uchida K, Yoshida S, Hosoya T. Controlled Generation of 3-Triflyloxyarynes. *Synthesis*, 2016, 48(23), 4099-4109.
71. Yoshida S, Morita T, Hosoya T. Synthesis of Diverse Benzotriazoles from Aryne Precursors Bearing an Azido Group via Inter- and Intramolecular Cycloadditions. *Chem. Lett.*, 2016, 45(7), 726-728.

72. Kii I, Sumida Y, Goto T, Sonamoto R, Okuno Y, Kato-Sumida T, Koike Y, Abe M, Nonaka Y, Ikura T, Ito N, Shibuya H, Hosoya T, Hagiwara M. Selective inhibition of the kinase DYRK1A by targeting its folding process. *Nat. Commun.*, 2016, 7, 11391.
73. Okamoto-Uchida Y, Yu R, Miyamura N, Arima N, Ishigami-Yuasa M, Kagechika H, Yoshida S, Hosoya T, Nawa M, Kasama T, Asaoka Y, Alois RW, Elling U, Penninger JM, Nishina S, Azuma N, Nishina H. The mevalonate pathway regulates primitive streak formation via protein farnesylation. *Sci. Rep.*, 2016, 6, 37697.
74. Hirano T, Noji Y, Shiraishi T, Ishigami-Yuasa M, Kagechika H. Development of an “OFF-ON-OFF” fluorescent pH sensor suitable for the study of intracellular pH. *Tetrahedron*, 2016, 72(32), 4925-4930.
75. Fujiwara T, Ohira K, Urushibara K, Ito A, Yoshida M, Kanai M, Tanatani A, Kagechika H, Hirano T. Steric structure–activity relationship of cyproheptadine derivatives as inhibitors of histone methyltransferase Set7/9. *Bioorg. Med. Chem.* 2016, 24(18), 4318-4323.
76. Yokoo H, Ohsaki A, Kagechika H, Hirano T. Structural development of canthin-5,6-dione moiety as a fluorescent dye and its application to novel fluorescent sensors. *Tetrahedron*, 2016, 72(39), 5872-5879.
77. Kinoshita M, Negishi M, Sakai H, Hirano T, Mori S, Fujii S, Kagechika H, Tanatani A. Development of 6-Arylcoumarins as Nonsteroidal Progesterone Antagonists. *Structure-activity Relationships and Fluorescence Properties*. *Bioorg. Med. Chem.*, 2016, 24(21), 5602-5610.
78. Yamada A, Kazui Y, Yoshioka H, Tanatani A, Mori S, Kagechika H, Fujii S. Development of *N*-(4-Phenoxyphenyl)benzenesulfonamide Derivatives as Novel Nonsteroidal Progesterone Receptor Antagonists. *ACS Med. Chem. Lett.*, 2016, 7(12), 1028-1033.
79. Hiramatsu K, Tamamura H. A Mild Method for the Direct Fluorination of Pyrroles by Using a Lipophilic Anionic Phase-Transfer Catalyst. *Eur. J. Org. Chem.*, 2016, 21, 3491-3494.
80. Toyama K, Mizuguchi T, Nomura W, Tamamura H. Functional Evaluation of Fluorescein-Labeled Derivatives of a Peptide Inhibitor of the EGF Receptor Dimerization. *Bioorg. Med. Chem.*, 2016, 24(16), 3406-3412.
81. Kobayakawa T, Tamamura H. Efficient Synthesis of Xaa-Gly Type (*Z*)-Chloroalkene Dipeptide Isosteres via Organocuprate Mediated Reduction. *Tetrahedron*, 2016, 72(32), 4968-4971.
82. Yoshida S, Nakajima H, Uchida K, Yano T, Kondo M, Matsushita T, Hosoya T. Reactions of Arynes with Sulfoximines: Formal Sulfinylation vs. *N*-Arylation. *Chem. Lett.*, 2017, 46(1), 77-80.
83. Morita T, Yoshida S, Kondo M, Matsushita T, Hosoya T. Facile Diversification of Simple Benzo[*b*]thiophenes via Thienobenzynes Intermediates. *Chem. Lett.*, 2017, 46(1), 81-84.
84. Morita T, Nishiyama Y, Yoshida S, Hosoya T. Facile Synthesis of Multisubstituted Benzo[*b*]furans via 2,3-Disubstituted 6,7-Furanbenzynes Generated from *ortho*-Iodoaryl Triflate-type Precursors. *Chem. Lett.*, 2017, 46(1), 118-121.
85. Yoshida S, Nagai A, Uchida K, Hosoya T. Enhancing the Synthetic Utility of 3-Haloaryne Intermediates by Their Efficient Generation from Readily Synthesizable *ortho*-Iodoaryl Triflate-type Precursors. *Chem. Lett.*, 2017, 46(5), 733-736.
86. Mizuguchi T, Ohashi N, Matsumoto D, Hashimoto C, Nomura W, Yamamoto N, Murakami T, Tamamura H. Development of Anti-HIV Peptides Based on a Viral Capsid Protein. *Biopolymers: Peptide Science*, 2017, 108(1), e22920.
87. Tanaka T, Aoki T, Nomura W, Tamamura H. Bivalent 14-mer Peptide Ligands of CXCR4 with Polyproline Linkers with Anti-Chemotactic Activity against Jurkat Cells. *J. Pept. Sci.*, 2017, doi: 10.1002/psc.2946.

88. Takano H, Narumi T, Nomura W, Tamamura H. Microwave-Assisted Synthesis of Azacoumarin Fluorophores and the Fluorescence Characterization. J. Org. Chem., 2017, 82(5), 2739-2744.
89. Uchida K, Yoshida S, Hosoya T. Three-Component coupling of Triflyloxy-Substituted Benzocyclobutenones, Organolithium Reagents, and Arynophiles Promoted by Generation of Aryne via Carbon-Carbon Bond Cleavage. Org. Lett., 2017, 19(5), 1184-1187.
90. Meguro T, Yoshida S, Hosoya T. Aromatic Azido-selective Reduction via the Staudinger Reaction Using Tri-*n*-butylphosphonium Tetrafluoroborate with Triethylamine. Chem. Lett., 2017, 46(4), 473-476.

(2) 学会・シンポジウム等における口頭・ポスター発表

1. 吉田 優, 三澤善大, 細谷孝充. 形式的な芳香族 C-H アジド化反応を鍵とするジアジドビルディングブロックの高効率合成. 第 65 回有機合成化学協会関東支部シンポジウム (新潟シンポジウム), 新潟, 2013 年 5 月, 口頭, 国内.
2. 吉田 優, 菅野貴美幸, 喜井 勲, 松下武司, 萩原正敏, 細谷孝充. 異種アジド選択的トリプルクリック反応による機能性分子集積. 日本ケミカルバイオロジー学会第 8 回年会, 東京, 2013 年 6 月, ポスター, 国内.
3. Kato T, Sumida Y, Hosoya T. Generation of Arynes via Ate Complexes of Arylboronic Esters with an *ortho*-Leaving Group. The First Asian Conference for "MONODUKURI" Strategy by Synthetic Organic Chemistry (ACMS), Okinawa, Japan, July 2013, ポスター, 国内.
4. 隅田有人, 原田 龍, 加藤ともえ, 細谷孝充. 銅触媒を用いたジベンゾオキサボリンの酸化的環化反応によるジベンゾフランの合成. 第 60 回有機金属化学討論会, 東京, 2013 年 9 月, ポスター, 国内.
5. Hosoya T, Sumida Y, Kato T. Generation of Arynes via Ate Complexes of Arylboronic Esters with an *ortho*-Leaving Group. 10th International Symposium on Carbanion Chemistry (ISCC-10), Kyoto, Japan, Sep. 2013, 口頭, 国内.
6. Yoshida S, Uchida K, Hosoya T. Generation of Arynes Triggered by Sulfoxide-Metal Exchange Reaction of *ortho*-Sulfinylaryl Triflates. 10th International Symposium on Carbanion Chemistry (ISCC-10), Kyoto, Japan, Sep. 2013, ポスター, 国内.
7. 隅田有人, 原田 龍, 加藤ともえ, 細谷孝充. ホウ素の特性を利用したベンザイン発生法とジベンゾオキサボリンの合成法の開発と応用. 第 39 回反応と合成の進歩シンポジウム, 福岡, 2013 年 11 月, ポスター, 国内.
8. 吉田 優, 野中貴子, 森田隆太, 細谷孝充. アルキンとアラインに対するアジドの連続環化付加反応によるビス-1,2,3-トリアゾールの合成. 第 104 回有機合成シンポジウム, 東京, 2013 年 11 月, 口頭, 国内.
9. 原田 龍, 隅田有人, 細谷孝充. Dibenzoxaborin 類の簡便合成法の開発と defucogilvocarcin M 合成への応用. 第 66 回有機合成化学協会関東支部シンポジウム (東工大シンポジウム), 東京, 2013 年 11 月, 口頭, 国内.
10. 下森 顕, 吉田 優, 野中貴子, 細谷孝充. C-H ホウ素化反応を利用する多置換 α -シリルアリールトリフラートの簡便合成. 日本化学会第 94 春季年会, 名古屋, 2014 年 3 月, 口頭, 国内.

11. 吉田 優, 野中貴子, 森田隆太, 内田圭祐, 細谷孝充. 新しいアライン発生法にもとづくビストリアゾール類の簡便合成. 日本化学会第 94 春季年会, 名古屋, 2014 年 3 月, 口頭, 国内.
12. 高橋佳代, 細谷孝充, 高島忠之, 田中雅彰, 石井 聡, 中富康仁, 田沢周作, 高橋和弘, 土居久志, 和田康弘, 鈴木正昭, 尾上浩隆, 渡辺恭良. 脳内 aromatase とヒトの性格・気質との関連—PET 研究. 第 9 回日本分子イメージング学会総会・学術集会, 大阪, 2014 年 5 月, ポスター, 国内.
13. 吉田 優, 三澤善大, 細谷孝充. ジアジド化合物の光延反応を利用する効率的分子変換法の開発. 第 67 回有機合成化学協会関東支部シンポジウム (横浜シンポジウム), 横浜, 2014 年 5 月, 口頭, 国内.
14. 豊本雅晴, 喜井 勲, 栗原 崇, 木村 亮, 小野木博, 山本 誠, 吉田 優, 細谷孝充, 萩原正敏. 副作用を示さない新規疼痛治療薬候補化合物の発見. 日本ケミカルバイオロジ学会第 9 回年会, 大阪, 2014 年 6 月, 口頭, 国内.
15. 吉田 優, 畠山泰朋, 上本紘平, 植草秀裕, 細谷孝充. 高機能環状アルキン合成を指向した高歪みアルキン保護法の開発. 日本ケミカルバイオロジ学会第 9 回年会, 大阪, 2014 年 6 月, 口頭, 国内.
16. 細谷孝充, 下森 顕, 内田圭祐, 森田隆太, 野中貴子, 吉田 優. 多様性指向型合成のための官能性アライン前駆体の開発. 日本ケミカルバイオロジ学会第 9 回年会, 大阪, 2014 年 6 月, ポスター, 国内.
17. Yoshida S, Hatakeyama Y, Johmoto K, Uekusa H, Hosoya T. A Transient Protection of Strained Alkyne from Click Reaction by the Complexation with Copper. 26th International Conference on Organometallic Chemistry (ICOMC2014), Sapporo, Japan, Jul. 2014, ポスター, 国内.
18. 下森 顕, 吉田 優, 野中貴子, 細谷孝充. アライン前駆体の C-H ホウ素化を経由する多置換ヘテロ環合成法の開発. 第 44 回複素環化学討論会, 札幌, 2014 年 9 月, ポスター, 国内.
19. 細谷孝充, 田中淳子, 畠山泰朋, 松下武司, 上本紘平, 植草秀裕, 吉田 優. アジドと環状アルキンとの環化付加反応における反応性制御法の開発. 第 44 回複素環化学討論会, 札幌, 2014 年 9 月, 口頭, 国内.
20. 下森 顕, 吉田 優, 野中貴子, 細谷孝充. C-H ホウ素化を経由する多置換 σ -シリルアリアルトリフラート合成法の開発. 第 31 回有機合成化学セミナー, 福岡, 2014 年 9 月, ポスター, 国内.
21. Takahashi K, Hosoya T, Takashima T, Tanaka M, Ishii A, Nakatomi Y, Tazawa S, Takahashi K, Shiomi S, Wada Y, Watanabe Y. PET Imaging of aromatase expression in human brain and its associations with characters and traits. World Molecular Imaging Congress 2014 (WMIC 2014), Seoul, Korea, Sep. 2014, ポスター, 国外.
22. 椎崎 繁, 名黒 功, 吉田 優, 細谷孝充, 一條秀憲. 高浸透圧ストレス下形成される ASK3 顆粒構成因子の探索. 第 87 回日本生化学会大会, 京都, 2014 年 10 月, 口頭, 国内.
23. Morooka S, Okuno Y, Hosoya T, Hagiwara M, Yoshimura N. Development of new anti-VEGF drug by SRPK1 inhibitor screening. European Association for Vision and Eye Research (EVER 2014). Nice, France, Oct. 2014, ポスター, 国外.
24. 山本 誠, 小野木博, 酒井博幸, 吉田 優, 細谷孝充, 萩原正敏. 宿主リン酸化酵素を標的とした次世代抗ウイルス薬の開発. 第 62 回日本ウイルス学会学術集会, 横浜, 2014 年 11 月, 口頭, 国内.
25. 椎崎 繁, 名黒 功, 吉田 優, 細谷孝充, 一條秀憲. Exploration of the components of ASK3 granule formed under hypertonic stress. 第 37 回日本分子生物学会年会, 横浜, 2014 年 11 月, ポスター, 国内.

26. 内田圭祐, 吉田 優, 細谷孝充. 穏和な Grignard 反応剤を用いたアライン発生法の開発. 第 68 回有機合成化学協会関東支部シンポジウム (新潟シンポジウム), 新潟, 2014 年 11 月, 口頭, 国内.
27. 畠山泰朋, 吉田 優, 上本紘平, 植草秀裕, 細谷孝充. 銅塩を用いる環状アルキンの保護・脱保護法の開発. 第 68 回有機合成化学協会関東支部シンポジウム (新潟シンポジウム), 新潟, 2014 年 11 月, 口頭, 国内.
28. 細谷孝充, 三澤善大, 吉田 優. 形式的な C-H アジド化反応によるジアジド化合物の簡便合成法の開発と異種アジド選択的な逐次分子連結への応用. 日本化学会第 95 春季年会, 船橋, 2015 年 3 月, 口頭, 国内.
29. 下森 顕, 細谷孝充, 吉田 優. C-F 結合活性化を鍵とするジフルオロメチレン化合物の新規合成法の開発. 第 69 回有機合成化学協会関東支部シンポジウム (横浜国大シンポジウム), 横浜, 2015 年 5 月, 口頭, 国内.
30. 永井 晶, 内田圭祐, 吉田 優, 細谷孝充. σ ヨードアリールトリフラートを用いる 3-ハロアラインの発生とその利用. 第 69 回有機合成化学協会関東支部シンポジウム (横浜国大シンポジウム), 横浜, 2015 年 5 月, 口頭, 国内.
31. 内田圭祐, 吉田 優, 井川和宣, 友岡克彦, 細谷孝充. 3-トリフルルオキシアラインの特性を利用した多様性指向型合成. 新規素材探索研究会第 14 回セミナー, 東京, 2015 年 6 月, ポスター, 国内.
32. 森田隆太, 吉田 優, 細谷孝充. 多置換ベンゾ[*b*]チオフェンの簡便合成を目指したチエノベンザインの発生法の開発. 新規素材探索研究会第 14 回セミナー, 東京, 2015 年 6 月, ポスター, 国内.
33. 吉田 優, 畠山泰朋, 唐木文霞, 上本紘平, 植草秀裕, 細谷孝充. 高機能性分子プローブ創製を目指した環状アルキン保護法の開発. 第 107 回有機合成シンポジウム, 東京, 2015 年 6 月, 口頭, 国内.
34. 吉田 優, 三澤善大, 森田隆太, 細谷孝充. 異種アジド選択的マルチクリック反応の開発. 日本ケミカルバイオロギー学会第 10 回年会, 仙台, 2015 年 6 月, ポスター, 国内.
35. 目黒友啓, 吉田 優, 細谷孝充. 多機能性分子プローブの創製を指向した、チオフェン-*S,S*-ジオキシドと環状アルキンとの環化付加反応に関する研究. 日本ケミカルバイオロギー学会第 10 回年会, 仙台, 2015 年 6 月, ポスター, 国内.
36. 細谷孝充, 吉田 優, 唐木文霞, 畠山泰朋, 上本紘平, 植草秀裕. 高歪みアルキン保護法を利用する高機能環状アルキンの合成. 日本ケミカルバイオロギー学会第 10 回年会, 仙台, 2015 年 6 月, ポスター, 国内.
37. 牧尾直明, 唐木文霞, 畠山泰朋, 上本紘平, 植草秀裕, 吉田 優, 細谷孝充. カチオン性銅塩との錯形成による様々な環状アルキンの保護に関する検討. 第 62 回有機金属化学討論会, 吹田, 2015 年 9 月, ポスター, 国内.
38. 大谷和弘, 三澤善大, 後藤沙由里, 吉田 優, 細谷孝充. アジド基を有する α -ジアゾアセトフェノンの合成と多成分連結への応用. 第 5 回 CSJ 化学フェスタ 2015, 東京, 2015 年 10 月, ポスター, 国内.
39. 下森 顕, Kim Youngchan, 細谷孝充, 吉田 優. シリリウム中間体を經由する炭素-フッ素結合の選択的変換法の開発. 第 108 回有機合成シンポジウム, 東京, 2015 年 11 月, 口頭, 国内.
40. 中村 悠, 吉田 優, 細谷孝充. シリルメチル Grignard 反応剤を用いた選択的ハロゲン-金属交換反応の開発. 第 108 回有機合成シンポジウム, 東京, 2015 年 11 月, ポスター, 国内.

41. Morita T, Yoshida S, Hosoya T. Synthesis of Diverse Multisubstituted Benzo[*b*]thiophenes Based on Transformations via Thienobenzynes Intermediates. The 13th International Kyoto Conference on New Aspects of Organic Chemistry (IKCOC-13), Kyoto, Nov. 2015, ポスター, 国内.
42. Meguro T, Yoshida S, Hosoya T. Cycloaddition of Thiophene *S,S*-Dioxide Derivatives with Strained Cycloalkynes. The 13th International Kyoto Conference on New Aspects of Organic Chemistry (IKCOC-13), Kyoto, Nov. 2015, ポスター, 国内.
43. Yoshida S, Shimomori K, Kim Y, Hosoya T. Selective C–F Bond Cleavage via a Silylium Intermediate. The 13th International Kyoto Conference on New Aspects of Organic Chemistry (IKCOC-13), Kyoto, Nov. 2015, ポスター, 国内.
44. Hosoya T, Hatakeyama Y, Karaki F, Johmoto K, Uekusa H, Yoshida S. Transient Protection of Strained Alkynes from Click Reaction via Complexation with Copper. The 13th International Kyoto Conference on New Aspects of Organic Chemistry (IKCOC-13), Kyoto, Nov. 2015, 口頭, 国内.
45. 内田圭祐, 吉田 優, 井川和宣, 友岡克彦, 細谷孝充. 3-トリフルルオキシアラインの効率的な発生の法の開発と多様な複素環化合物合成への応用. 第 45 回複素環化学討論会, 東京, 2015 年 11 月, 口頭, 国内.
46. 後藤沙由里, 吉田 優, 近藤正一, 松下武司, 細谷孝充. さまざまなアルケニルアジドの環状アルキンとのクリック反応性に関する検討. 第 45 回複素環化学討論会, 東京, 2015 年 11 月, ポスター, 国内.
47. 永井 晶, 内田圭祐, 吉田 優, 細谷孝充. ヨウ素-マグネシウム交換反応を経由する 3-ハロアラインの発生と複素環化合物合成への利用. 第 45 回複素環化学討論会, 東京, 2015 年 11 月, ポスター, 国内.
48. 目黒友啓, 吉田 優, 細谷孝充. チオフェン-*S,S*-ジオキシドの反応性を利用した分子連結法の開発. 第 70 回記念有機合成化学協会関東支部シンポジウム (新潟 (長岡) シンポジウム), 長岡, 2015 年 11 月, 口頭, 国内.
49. 西山義剛, 吉田 優, 細谷孝充. ホスホン酸チオエステルの逐次置換反応による有機リン化合物群の合成法の開発. 第 70 回記念有機合成化学協会関東支部シンポジウム (新潟 (長岡) シンポジウム), 長岡, 2015 年 11 月, 口頭, 国内.
50. 中島 華, 内田圭祐, 矢野貴久, 吉田 優, 細谷孝充. ベンザイン中間体を利用する *N*-アリールスルホキシイミンの簡便合成法の開発. 第 70 回記念有機合成化学協会関東支部シンポジウム (新潟 (長岡) シンポジウム), 長岡, 2015 年 11 月, 口頭, 国内.
51. 森田隆太, 吉田 優, 細谷孝充. チエノベンザインを利用した多置換ベンゾ[*b*]チオフェンの効率的合成法の開発. 第 70 回記念有機合成化学協会関東支部シンポジウム (新潟 (長岡) シンポジウム), 長岡, 2015 年 11 月, 口頭, 国内.
52. 椎崎 繁, 名黒 功, 吉田 優, 細谷孝充, 一條秀憲. 高浸透圧ストレスにより形成される ASK3 グラニүүл構成因子の探索. 第 38 回日本分子生物学会年会・第 88 回日本生化学会大会 合同大会, 神戸, 2015 年 12 月, ポスター, 国内.
53. Hosoya T, Yoshida S, Misawa Y. Formal C–H azidation-based shortcut to diazido building blocks for the versatile preparation of photoaffinity labeling probes of natural products and pharmaceuticals. PACIFICHEM 2015, Honolulu, Hawaii, USA, Dec. 2015, ポスター, 国外.

54. Yoshida S, Hatakeyama Y, Johmoto K, Uekusa H, Hosoya T. Transient Protection of strained alkynes from click reaction via complexation with copper. PACIFICHEM 2015, Honolulu, Hawaii, USA, Dec. 2015, ポスター, 国外.
55. 西山義剛, 陌間由貴, 吉田 優, 細谷孝充. チオ基を脱離基としたリン原子上での逐次置換反応の開発. 日本化学会第 96 春季年会, 京田辺, 2016 年 3 月, 口頭, 国内.
56. 吉田 優, 三澤善大, 栗原ともこ, 森田隆太, 喜井 勲, 渡辺恭良, 細谷孝充. 新しいマルチアジド化合物をプラットフォーム分子として用いる機能性分子集積法の開発. 日本化学会第 96 春季年会, 京田辺, 2016 年 3 月, 口頭, 国内.
57. 大谷和弘, 後藤沙由里, 三澤善大, 吉田 優, 細谷孝充. アジド基を有する α -ジアゾアセトフェノンを用いる多様性指向型合成. 日本化学会第 96 春季年会, 京田辺, 2016 年 3 月, 口頭, 国内.
58. 中村 悠, 内田圭祐, 陌間由貴, 吉田 優, 細谷孝充. 3-トリフルルオキシアラインのアミノシリル化による 3-アミノアライン前駆体の簡便合成法の開発. 日本化学会第 96 春季年会, 京田辺, 2016 年 3 月, 口頭, 国内.
59. Nakamura Y, Uchida K, Hazama Y, Yoshida S, Hosoya T. Facile Synthesis of 3-Aminoaryne Precursors via Aminosilylation of 3-Triflyloxyarynes. The 12th International Symposium on Organic Reactions (ISOR-12), Kyoto, Japan, Apr. 2016, ポスター, 国内.
60. 豊田洋輔, 森本和志, 寿野良二, 関口雄介, 山下恵太郎, 平田邦夫, 安田賢司, 白石充典, 堀田韻虹, 浅田秀基, 中根崇智, 椎村祐樹, 中北智哉, 稲住知明, 告恭史郎, 梶原佑太, 清水朋子, 漆畑祐司, 吉田 優, 栗原ともこ, 細谷孝充, 木下正弘, 杉本幸彦, 野村紀通, 村田武士, 高山喜好, 山本雅貴, 成宮 周, 岩田 想, 小林拓也. 抗体を用いたプロスタグランジン受容体の X 線結晶構造解析. 第 13 回 GPCR 研究会, 東京, 2016 年 5 月, ポスター, 国内.
61. 中村 悠, 内田圭祐, 陌間由貴, 吉田 優, 細谷孝充. 3-トリフルルオキシアラインの反応性を利用した 3-アミノアライン前駆体の簡便合成法の開発. 第 70 回有機合成化学協会関東支部シンポジウム (東京農工大シンポジウム), 小金井, 2016 年 5 月, 口頭, 国内.
62. 西山義剛, 陌間由貴, 吉田 優, 細谷孝充. 多彩な有機リン化合物群の合成を指向したホスホン酸チオエステルの逐次置換反応の開発. 第 109 回有機合成シンポジウム 2016【春】, 東京, 2016 年 6 月, ポスター, 国内.
63. 吉田 優, 三澤善大, 栗原ともこ, 森田隆太, 喜井 勲, 渡辺恭良, 細谷孝充. 多機能性分子プローブ開発を指向したマルチアジド化合物を用いる機能性分子集積法の開発. 日本ケミカルバイオロジー学会第 11 回年会, 京都, 2016 年 6 月, 口頭, 国内.
64. 中村 悠, 内田圭祐, 陌間由貴, 吉田 優, 細谷孝充. 3-アミノアライン前駆体の簡便合成法の開発と 5-アミノクマリン類の合成への応用. 日本ケミカルバイオロジー学会第 11 回年会, 京都, 2016 年 6 月, ポスター, 国内.
65. Yoshida S, Uchida K, Nakamura Y, Nonaka T, Morita T, Nagai A, Igawa K, Tomooka K, Hosoya T. Trimethylsilylmethyl Grignard Reagent: a Mild Activator Triggering Efficient Generation of Arynes from Various *ortho*-Iodoaryl Triflates. 11th International Symposium on Carbanion Chemistry (ISCC-11), Rouen, France, Jul. 2016, 口頭, 国外.
66. Kim Youngchan, 下森 顕, 吉田 優, 細谷孝充. トリチルカチオンと求核剤を一体型にした新反応剤を用いるトリフルオロメチル基の選択的官能基化反応の開発. 第 33 回有機合成化学セミナー, ニセコ, 2016 年 9 月, ポスター, 国内.

67. 吉田 優, 畠山泰朋, 喜井 勲, 牧尾直明, 栗原ともこ, 伊藤晴海, 唐木文霞, 上本紘平, 植草秀裕, 井川和宣, 友岡克彦, 渡辺恭良, 細谷孝充. 銅—環状アルキン錯体を利用した分子連結法の開発. 第 63 回有機金属化学討論会, 東京, 2016 年 9 月, 口頭, 国内.
68. 目黒友啓, 吉田 優, 細谷孝充. 複数のアジド基を有するチオフェン-*S,S*-ジオキンドを用いた多成分集積法の開発. 第 46 回複素環化学討論会, 金沢, 2016 年 9 月, 口頭, 国内.
69. 藤井 咲, 西山義剛, 陌間由貴, 田中淳子, 吉田 優, 細谷孝充. ペプチド型トリアジドプラットフォーム分子の創製を目指した異種アジド選択的クリック反応に関する検討. 第 42 回反応と合成の進歩シンポジウム, 静岡, 2016 年 11 月, ポスター, 国内.
70. 中村 悠, 内田圭祐, 陌間由貴, 吉田 優, 細谷孝充. 3-アミノアライン: 前駆体の簡便合成法の開発と多彩な含窒素化合物の合成への展開. 第 110 回有機合成シンポジウム, 東京, 2016 年 11 月, 口頭およびポスター, 国内.
71. 大谷和弘, 後藤沙由里, 三澤善大, 吉田 優, 細谷孝充. アジド基を有する α -ジアゾアセトフェノールの反応性に基づく多成分連結法の開発. 第 6 回 CSJ 化学フェスタ 2016, 東京, 2016 年 11 月, ポスター, 国内.
72. 牧尾直明, 畠山泰朋, 井川和宣, 友岡克彦, 吉田 優, 細谷孝充. 環状アルキン—銅錯体を利用した機能性環状アルキン合成法の開発. 第 72 回有機合成化学協会関東支部シンポジウム (新潟シンポジウム), 新潟, 2016 年 11 月, 口頭, 国内.

(3) 「国民との科学・技術対話社会」に対する取り組み

該当なし

(4) 特許出願

公開を希望しない