

新学術領域研究「化学コミュニケーションのフロンティア (FY2017-2021)」

成果発表リスト A02 (公募研究, Recruited Groups) FY2018~2019

1. 市川聡 (北海道大学大学院薬学研究院・教授)

Satoshi, Ichikawa (Professor, Hokkaido University)

【原著論文, original journal】

- 1) Yamamoto, K., Sato, T., Hikiji, Y., Katsuyama, A., Matsumaru, T., Yakushiji, F., Yokota, S., *Ichikawa, S. Synthesis and biological evaluation of MraY selective analogue of tunicamycins. *Nucleosides, Nucleotides & Nucleic Acids* 39, 349-364, 2020. doi: 10.1080/15257770.2019.1649696
- 2) Mashalidis, E.H., Kaeser, B., Terasawa, Y., Katsuyama, A., Kwon, D.-Y., Lee, K., Hong, J., Ichikawa, S., *Lee, S.-Y. Chemical logic of MraY inhibition by antibacterial nucleoside natural products. *Nat. Commun.* 10, 2917, 2019.
- 3) Yamamoto, K., Katsuyama, A., *Ichikawa, S. Structural requirement of tunicamycin V for MraY inhibition. *Bioorg. Med. Chem.* 27, 1714-1719, 2019.
- 4) Yoo, J., Mashalidis, E.H., Kuk, A.C. Y., Yamamoto, K., Kaeser, B., Ichikawa, S., *Lee, S.-Y. GlcNAc-1-P-transferase-tunicamycin complex structure reveals basis for inhibition of N-glycosylation. *Nat. Struct. Mol. Biol.* 25, 217-224, 2018.
- 5) Yamamoto, K., Yakushiji, F., Matsumaru, T., *Ichikawa, S. Total Synthesis of Tunicamycin V. *Org. Lett.* 20, 256-259, 2018.

【解説・総説, review】

- 1) Yamamoto, K., *Ichikawa, S. Tunicamycin: Chemical synthesis and biosynthesis. *J. Antibiot.* 2019, 72, 924-933.

【著書】

【招待講演・基調講演】

国際：

- 1) Ichikawa, S. Medicinal chemistry based on covalent proteasome inhibitory natural products. GDCh Frontiers in Medicinal Chemistry, Würzburg, Germany, March, 2019.
- 2) Ichikawa, S. Nucleoside natural products inhibiting bacterial cell wall biosynthesis -chemistry and biology-. 6th Seoul National University Joint Symposium, Seoul, Korea, February, 2019.

国内：

- 1) 市川聡. 天然有機化合物を起点としたアカデミア創薬を目指して、第 58 回日本薬学会東北支部大会, 仙台, 10 月, 2019. (招待講演)
- 2) 市川聡. 多成分反応を基軸とする天然物創薬化学, 第 13 回バイオ関連化学シンポジウムフォーカスセッション, 仙台, 6 月, 2019. (招待講演)
- 3) 市川聡. 「シンポジウム・分子のレジデンスを考える～分子と収容場の相互作用を機能へ」, レジデンスを意識した天然物創薬. 日本薬学会第 139 回年会. 千葉, 3 月, 2019.

【特許等の出願状況】

【報道記事】

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

- 1) 札幌開成中等教育学校（札幌, 2019年8月31日）に、中学生（9名）に対して「先端科学特論（薬とは？）」を行い関連領域の紹介を行った。
- 2) 札幌開成高校アクティブラーニング型学問探求セミナー（札幌, 2018年11月14日）に、高生（約30名）に対して「薬物分子設計」を行い関連領域の紹介を行った。

2. 酒井隆一（北海道大学大学院水産科学研究院・教授）

SAKAI, Ryuichi (Professor, Hokkaido University)

【原著論文, original journal】

- 1) *Sakai, R., Tanano, K., Ono, T., Kitano, M., *et al.* Soritesidine, a Novel Proteinous Toxin from the Okinawan Marine Sponge Spongosorites sp. *Marine Drugs* 2019,17:216. doi: 10.3390/md17040216.

【解説・総説, review】

【著書】

【招待講演・基調講演】

国内：

- 1) 酒井隆一. 細胞のバリアを攻略する海洋天然物の探索. 日本化学会第100春季年会, 千葉, 3月, 2020.
- 2) 酒井隆一. 「細胞表面の「生命装置」に作用する水溶性海洋天然物の探索(低分子編)」. 第22回天然薬物の開発と応用シンポジウム, 熊本, 10月, 2018.

【特許等の出願状況】

【報道記事】

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

- 1) 第3回函館セミナーを北大函館キャンパスにて開催。約40名の大学生・大学院生を対象に講師として名古屋大学生命農学研究科教授 北将樹教授による「切れ味の良い分子を自然界に求めて」、パラオ在住の魚類研究者坂上治郎博士による「稚魚からシーラカンスまで：フィールド研究で追う魚たちのドラマ」の2題の講演を実施。
- 2) 函館スペシャルセミナー（2018年10月1日、函館、来場者40名）において磯部稔名古屋大学名誉教授、Roger Linington Simon Fraser 大学准教授を招いて講演会を行った。演題はそれぞれトビイカの生物発光の分子機構、Natural Products Discovery from Unusual Sources: Development and Application of Novel Isolation Methods.

3. 叶直樹 (星薬科大学医薬品化学研究所・教授)

KANOH, Naoki ((Professor, Hoshi University)

【原著論文, original journal】

- 1) Okamura, T., Fujiki, S., Iwabuchi, Y., *Kanoh, N. Gold(I)-catalyzed Nicholas reaction with aromatic molecules utilizing a bifunctional propargyl dicobalt hexacarbonyl complex. *Org. Biomol. Chem.* 17, 8522-8526, 2019. [Selected as a cover feature.]
- 2) Okamura, T., Egoshi, S., Dodo, K., Sodeoka, M., Iwabuchi, Y., *Kanoh, N. Highly chemoselective *gem*-difluoropropargylation of aliphatic alcohols. *Chem. Eur. J.* 25, 16002-16006, 2019.
- 3) Sasano, Y., Koyama, J., Yoshikawa, K., Kanoh, N., Kwon, E., *Iwabuchi, Y. Stereocontrolled construction of ABCD tetracyclic ring system with vicinal all-carbon quaternary centers of calyciphylline A type alkaloids. *Org. Lett.* 20, 3053-3056, 2018.

【解説・総説, review】

【著書】

【招待講演・基調講演】

国際：

- 1) Kanoh, N. Late-stage functionalization of small molecules using metal complexes. Julius-Maximilians-Universität Würzburg–Hoshi University Joint Mini Symposium. Tokyo, Feb. 2020. (招待講演)
- 2) Kanoh, N. Late-stage functionalization of small molecules using metal complexes and enzymes. 2nd Soft Matter Activation Research Center Symposium: New Stream of Chemical Biology. Chiba, Jul. 2019. (招待講演)
- 3) Kanoh, N. Chemistry, Biogenesis, and Biological Activity of Heronamides, Naturally Occurring Polyene Macrolactams. The 3rd International Symposium on Chemical Communication (Tohoku Forum for Creativity Thematic Programs), Sendai, Japan, Sept.10,2018.

国内：

- 1) 叶直樹. ポリエン系天然物を基盤とした人工多能性幹分子 (iPS 分子) の合成. 東北大学多元物質科学研究所 高分子・ハイブリッド材料研究センターミニシンポジウム～合成化学と電気化学～, 仙台, 12月, 2019. (招待講演)
- 2) 叶直樹. 抗真菌性ポリエンマクロラクタムの化学とケミカルコミュニケーション. 科学研究費新学術領域「化学コミュニケーションのフロンティア」第3回若手シンポジウム, 大阪, Jun. 2019. (依頼講演)

【特許等の出願状況】

- 1) 叶直樹, 藤木翔吾, 岡村俊孝, 岩渕好治, 錯体化合物、炭素炭素三重結合を有する化合物の製造方法、当該方法の中間体の製造方法及びこれらに用いるキット. 国立大学法人東北大学. 特開 2019-151586 (2019年10月25日). 国内.

【報道記事】

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

4. 有本博一 (東北大学大学院生命科学研究科・教授)

ARIMOTO, Hirokazu (Professor, Tohoku University)

【原著論文, original journal】

- 1) Takahashi, D., Moriyama, J., Nakamura, T., Miki E., Takahashi, E., Sato, A., Akaike, T., Itto-Nakama, K., *Arimoto, H. AUTACs: Cargo-Specific Degraders Using Selective Autophagy. *Molecular Cell* 76, 797-810.e10, 2019. [press release]

【解説・総説, review】

- 1) 高橋大輝, *有本博一. マクロオートファジーの化合物による制御-創薬をめざして. 医学のあゆみ 第5土曜特集 オートファジー - 分子機構・生物学的意義・疾患との関わり (企画 水島昇), 272, 958-963, 2020.
- 2) Takahashi, D., Arimoto, H. Targeting selective autophagy by AUTAC degraders. *Autophagy* 16,765-766, 2020.

【著書】

- 1) 有本博一, 一刀かおり. バンコマイシン耐性菌克服のための化学的アプローチ. 生命機能に迫る分子化学: 生命分子を真似る、飾る、超える (日本化学会編) pp101-109, 2018
- 2) 有本博一. 天然物は小さすぎる? -薬づくりを一変させる新技術のはなし、天然物の化学 II (科学のとびら 64): 自然からの贈り物 (上村大輔編)、pp. 65-70, 2018.

【招待講演・基調講演】

国際:

- 1) Arimoto, H. Autophagy-based targeted degradation. Targeted Protein Degradation Forum in Japan, Fujisawa, Aug. 2019. (招待講演)
- 2) Arimoto, H. Protein S-guanylation as a standalone tag for selective autophagy. 中国医学院薬物研究所, 北京, Apr. 2019. (招待講演)
- 3) Arimoto, H. Protein S-guanylation is a standalone tag for selective autophagy, The 4th International Symposium on Middle Molecular Strategy, Sendai, November 2018. (Invited lecture)

国内:

- 1) 有本博一. オートファジーに基づく標的選択的分解技術: AUTAC. 日本化学会第100春季年会, 野田, 3月, 2020. (招待講演)
- 2) 有本博一. 選択的オートファジーを自在に制御できる分子 AUTAC の発明と応用可能性. JBA バイオエンジニアリング研究会公開講演会, 早稲田大学, 1月, 2020. (招待講演)
- 3) 有本博一. 選択的オートファジーを利用する創薬手法 千葉県がんセンター研究所 集談会, 千葉, 9月, 2019. (招待講演)
- 4) 有本博一. オートファジーに基づく創薬の可能性. 日本薬学会薬化学部会 創薬懇話会 2019 in 秋保, 仙台, 6月, 2020. (招待講演)
- 5) 有本博一. 「選択的オートファジー分解を可能にする低分子化合物」日本ケミカルバイオロジー学会第13回年会, 東京, 6月, 2018.
- 6) 有本博一. 「選択的オートファジー分解を可能にする低分子化合物」日本農芸化学会東北支部シンポジウム, 秋田, 6月, 2018.

【特許等の出願状況】

- 1) 有本博一、一刀かおり、高橋大輝、森山純. 傷害を受けたミトコンドリアのオートファジー機構による分解剤. 国立大学法人東北大学. PCT/JP2018/25941 (2018.7.9). 国外

【報道記事】

- 1) オートファジーの化学的誘起で有害物質除去を行う新戦略「AUTAC」、Chem-Station 第241回スポットライトリサーチ, 2020年1月6日 (web サイト掲載)
- 2) Strategy to help cells get rid of disease-related debris, Long Room, Nov. 29, 2019. (web ニュース)
- 3) The Molecule that can AUTAC Bad Proteins, Asia Research News, Nov. 28, 2019 (web ニュース)
- 4) New strategy could help cells get rid of disease-related debris, The Medical News, Nov. 27, 2019 (web ニュース)
- 5) Strategy to help cells get rid of disease-related debris, Phys.org, Nov. 27, 2019 (web ニュース)
- 6) Molecule that can AUTAC Bad Proteins, Minzilla, Nov. 28, 2019 (web ニュース)
- 7) 「東北大が開発！世界初の製薬手法」、チャージ！第2部, 2019年11月27日. 東日本放送(テレビ)
- 8) 「東北大、細胞内の有害物質取り除く新手法開発 がんやアルツハイマー治療に期待」、財経新聞, 2019年10月13日
- 9) 「東北大「世界初の製薬手法を開発」, Nスタみやぎ, 2019年10月10日. 東北放送 (テレビ)
- 10) 「「生命科学における分子化学のプレゼンス」化学と生命科学の融合深く」化学工業日報, 2019年3月12日

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

プレスリリース

- 1) 「The molecule that can AUTAC bad proteins」東北大学プレスリリース 2019年11月27日
- 2) 「オートファジーを選択的に制御できる AUTAC 分子の発明—細胞内の有害物質を取り除く創薬手法を開発—」日本医療研究開発機構プレスリリース 2019年11月11日
- 3) 「細胞内有害物質を取り除く創薬手法開発に成功 選択的オートファジーを自在に制御できる AUTAC 分子の発明」東北大学プレスリリース 2019年10月11日
<https://www.tohoku.ac.jp/japanese/2019/10/press20191011-01-autac.html>

5. 木越英夫 (筑波大学・副学長・理事)

KIGOSHI, Hideo (Vice President and Executive Director, University of Tsukuba)

【原著論文, original journal】

- 1) Zhang, M., Sunaba, T., Sun, Y., Sasaki, K., Isoda, H., *Kigoshi, H., *Kita, M. Anti-inflammatory marine cyclic peptide stylissatin A and its derivatives inhibit differentiation of murine preadipocytes. *Chem. Commun.* 55, 5471-5474, 2019.
- 2) Futaki, K., Takahashi, M., Tanabe, K., Fujieda, A., *Kigoshi, H., *Kita, M. Synthesis and Biological Activities of Aplyronine A Analogues toward the Development of Antitumor Protein-Protein Interaction Inducers between Actin and Tubulin: Conjugation of the C1-C9 Macrolactone Part and the C24-C34 Side Chain. *ACS Omega* 4, 8598-8613, 2019.
- 3) *Hayakawa, I., Nagatani, R., Ikeda, M., Yoo, D., Saito, K., Kigoshi, H., *Sakakura, A. Toward the Synthesis of Yuzurimine-Type Alkaloids: Stereoselective Construction of the Heterocyclic Portions of Deoxyyuzurimine and Macrodaphnine. *Org. Lett.* 21, 6337-6341, 2019.
- 4) *Ohyoshi, T., Akemoto, K., Taniguchi, A., Ishihara, T., *Kigoshi, H. Total synthesis of (-)-aplaminol by Buchwald-Hartwig cross-coupling of an aminal. *New J. Chem.* 43, 18442-18444, 2019.
- 5) *Ohyoshi, T.; Mitsugi, K.; Higuma, T.; Ichimura, F.; Yoshida, M.; *Kigoshi, H. Concise total syntheses of phelligradins A, C, and D, *RSC Advances* 9, 7321-7323, 2019.
- 6) Takano, A.; Zhao, Y.; Ohyoshi, T.; *Kigoshi, H. Synthetic Studies Toward Swinhoeisterol A, a Novel Steroid with an Unusual Carbon Skeleton, *Tetrahedron Lett.* 60 (8), 591-593, 2019.

- 7) *[Kita, M.](#); Watanabe, S.; Oka, H.; *[Kigoshi, H.](#) Synthesis of the Trisoxazole Macrolactone of Mycalolides via Template-Directed *E*-Selective Ring-Closing Metathesis, *Tetrahedron Lett.* 59 (41), 3664-3668, 2018.
- 8) Watanabe, R.; Hu, Y.; Iio, K.; Yoneda, K.; Hattori, A.; Arai, A.; *[Kigoshi, H.](#); *[Kita, M.](#) Specific Protein-Labeling and Ligand-Binding Position Analysis with Amidopyrene Probes as LDI MS Tags, *Org. Biomol. Chem.* 16 (42), 7883-7890, 2018.
- 9) *[Ohyoshi, T.](#); Takano, A.; Namiki, M.; Ogura, T.; Miyazaki, Y.; Ebihara, Y.; Takeno, K.; Hayakawa, I.; *[Kigoshi, H.](#) Development of a Novel Inducer of Protein-Protein Interactions Based on Aplyronine A, *Chem. Commun.* 54 (68), 9537-9540, 2018.

【解説・総説, review】

【著書】

- 1) *[Kita, M.](#), *[Kigoshi, H.](#) Discovery and use of natural products and derivatives as chemical probes. in *The Discovery and Utility of Chemical Probes in Target Discovery*, Ed. Brennan P. (The Royal Society of Chemistry), in press (2020).

【招待講演・基調講演】

【特許等の出願状況】

- 1) 北将樹, [木越英夫](#). 質量分析用プローブ. 国立大学法人名古屋大学. 特願 2019-119846 (2019.6.27). 国内

【報道記事】

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

6. [花岡健二郎](#) (東京大学大学院薬学系研究科・准教授)

[HANAOKA, Kenjiro](#) (Associate Professor, The University of Tokyo)

【原著論文, original journal】

- 1) Okada, K., Mori, D., Makii, Y., Nakamoto, H., Murahashi, Y., Yano, F., Chang, S.H., Taniguchi, Y., Kobayashi, H., Semba, H., Takeda, N., Piao, W., [Hanaoka, K.](#), Nagano, T., Tanaka, S., *Saito, T. Hypoxia-inducible factor-1 alpha maintains mouse articular cartilage through suppression of NF-κB signaling. *Sci. Rep.* , 10, Article number: 5425, 2020. doi:10.1038/s41598-020-62463-4
- 2) Numasawa, K., *[Hanaoka, K.](#), Saito, N., Yamaguchi, Y., Ikeno, T., Echizen, H., Yasunaga, M., Komatsu, T., Ueno, T., Miura, M., Nagano, T., *Urano, Y. A fluorescent probe for rapid, high-contrast visualization of folate-receptor-expressing tumors in vivo. *Angew. Chem. Int. Ed.* in press. doi:10.1002/anie.201914826
[press release]
- 3) Takahashi, S., *[Hanaoka, K.](#), Okubo, Y., Echizen, H., Ikeno, T., Komatsu, T., Ueno, T., Hirose, K., Iino, M., Nagano, T., *Urano, Y. Rational design of a near-infrared fluorescence probe for Ca²⁺ based on phosphorus-substituted rhodamines utilizing photoinduced electron transfer. *Chem. Asian J.* 15, 524-530, 2020.
- 4) Ogihara, S., *Komatsu, T., Itoh, Y., Miyake, Y., Suzuki, T., Yanagi, K., Kimura, Y., Ueno, T., [Hanaoka, K.](#), Kojima, H., Okabe, T., Nagano, T., *Urano, Y. Metabolic pathway-oriented screening targeting S-adenosyl-L-methionine reveals the epigenetic remodeling activities of naturally occurring catechols. *J. Am. Chem. Soc.* 142, 21-26, 2020.

- 5) Cheruthu, N.M., *Komatsu, T., Ueno, T., Hanaoka, K., *Urano, Y. Development of ratiometric carbohydrate sensor based on boron dipyrromethene (BODIPY) scaffold. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 29, 126684, 2019.
- 6) Ichihashi, Y., *Komatsu, T., Kyo, E., Matsuzaki, H., Hata, K., Watanabe, T., Ueno, T., Hanaoka, K., *Urano, Y. Separation-based enzymomics assay for the discovery of altered peptide-metabolizing enzymatic activities in biosamples. *Anal. Chem.* 91, 11497-11501, 2019.
- 7) Koide, Y., Kojima, R., Hanaoka, K., Numasawa, K., Komatsu, T., Nagano, T., Kobayashi, H., *Urano, Y. Design strategy for germanium-rhodamine based pH-activatable near-infrared fluorescence probes suitable for biological applications. *Commun. Chem.* 2, 94, 2019.
- 8) Ikeno, T., *Hanaoka, K., Iwaki, S., Myochin, T., Murayama, Y., Ohde, H., Komatsu, T., Ueno, T., Nagano, T., *Urano, Y. Design and synthesis of an activatable photoacoustic probe for hypochlorous acid. *Anal. Chem.* 91, 9086-9092, 2019.
- 9) Toriumi, N., Asano, N., Ikeno, T., Muranaka, A., *Hanaoka, K., Urano, Y., Uchiyama, M. Design of photostable, activatable near-infrared photoacoustic probes using tautomeric benzophthalocyanine as a platform. *Angew. Chem. Int. Ed.* 58, 7788-7791, 2019.
- 10) Ogasawara, A., Kamiya, M., Sakamoto, K., Kuriki, Y., Fujita, K., Komatsu, T., Ueno, T., Hanaoka, K., Onoyama, H., Abe, H., Tsuji, Y., Fujishiro, M., Koike, K., Fukayama, M., Seto, Y., *Urano, Y. A red fluorescence probe targeted to dipeptidylpeptidase-IV for highly sensitive detection of esophageal cancer. *Bioconjugate Chem.* 30, 1055-1060, 2019.
- 11) Takasugi, T., *Hanaoka, K., Sasaki, A., Ikeno, T., Komatsu, T., Ueno, T., Yamada, K., *Urano, Y. Development of a platform for activatable fluorescent substrates of glucose transporters (GLUTs). *Bioorg. Med. Chem.* 27, 2122-2126, 2019.
- 12) Ezerin, D., Takano, Y., Hanaoka, K., Urano, Y., *Dick, T.P. N-Acetyl cysteine functions as a fast-acting antioxidant by triggering intracellular H₂S and sulfane sulfur production. *Cell Chem. Biol.* 25, 447-459, 2018.
- 13) Taguchi, R., Terai, T., Ueno, T., Komatsu, T., Hanaoka, K., *Urano, Y. A protein-coupled fluorescent probe for organelle-specific imaging of Na⁺. *Sens. Act. B: Chem.* 265, 575-581, 2018.
- 14) Takahashi, S., Kagami, Y., *Hanaoka, K., Terai, T., Komatsu, T., Ueno, T., Uchiyama, M., Koyama-Honda, I., Mizushima, N., Taguchi, T., Arai, H., Nagano, T., *Urano, Y. Development of a series of practical fluorescent chemical tools to measure pH values in living samples. *J. Am. Chem. Soc.* 140, 5925-5933, 2018.
- 15) *Hanaoka, K., Kagami, Y., Piao, W., Myochin, T., Numasawa, K., Kuriki, Y., Ikeno, T., Ueno, T., Komatsu, T., Terai, T., Nagano, T., *Urano, Y. Synthesis of unsymmetrical Si-rhodamine fluorophores and application to a far-red to near-infrared fluorescence probe for hypoxia. *Chem. Commun.* 54, 6939-6942, 2018.
- 16) Ito, H., Kawamata, Y., Kamiya, M., Tsuda-Sakurai, K., Tanaka, S., Ueno, T., Komatsu, T., Hanaoka, K., Okabe, S., Miura, M., *Urano, Y. Red-shifted fluorogenic substrate for detecting LacZ-positive cells in living tissue with single-cell resolution. *Angew. Chem. Int. Ed.* 57, 15702-15706, 2018.
- 17) Kubo, H., Hanaoka, K., Kuriki, Y., Komatsu, T., Ueno, T., Kojima, R., Kamiya, M., Murayama, Y., Otsuji, E., *Urano, Y. Rapid detection of metastatic lymph nodes of colorectal cancer with a gamma-glutamyl transpeptidase-activatable fluorescence probe. *Sci. Rep.* 8, 17781, 2018.

【解説・総説, review】

- 1) *Hanaoka, K. Development of novel dark quenchers and their application to imaging probes. *YAKUGAKU ZASSHI* 139, 277-283, 2019.

【著書】

- 1) 花岡健二郎. 生きたままで生体内 pH を測定できる蛍光色素の開発. B&I バイオサイエンスとインダストリー, Vol.77, No.1, pp10-11, pp37-41, 2019.
- 2) 花岡健二郎. 生きた細胞や臓器の pH を測定する. 化学, November, Vol.73, pp23-28, 2018.
- 3) 越膳ほなみ, 花岡健二郎. 活性硫黄分子産生酵素に対する新規阻害剤の開発. 生化学, Vol.90, No.3, pp388-393, 2018.

【招待講演・基調講演】

国際：

- 1) Hanaoka, K. Development of a fluorescence probe for H₂S and its application to inhibitor screening for H₂S-producing enzymes. The Joint Symposium of “10th Korea-Japan Chemical Biology Symposium” and “30th Meeting for New Drug Discovery”. Kanazawa, Oct. 2019. (招待講演)
- 2) Hanaoka, K. Development of Far-Red to Near-Infrared Small-Molecule Fluorophores and their Application to Fluorescent Probes. The 6th International Symposium on Bioimaging & The 28th Annual Meeting of the Bioimaging Society. Saitama, Sep. 2019. (招待講演)
- 3) Hanaoka, K. Development of fluorescence probes for H₂S and sulfane sulfur and their application to the inhibitor screening. 1st International Conference on Persulfide and Sulfur Metabolism in Biology and Medicine. Sendai, Sep. 2019. (招待講演)
- 4) Hanaoka, K. Construction of a Library of Asymmetric Si-rhodamine Fluorophores and its Application to Ratiometric Fluorescence Probes for pH. 10th RSC-CSJ joint Symposium - Chemistry for Complex Biological Systems -. Sendai, Sep. 2019. (招待講演)
- 5) Hanaoka, K. Development of fluorescent probes for reactive sulfur species and their applications. 5th world congress on hydrogen sulfide in biology & medicine, Toronto, Canada, June, 2018.

国内：

- 1) 花岡健二郎. CYP3A 特異的蛍光プローブの開発と応用. AMED 研究費委託費 創薬基盤推進研究事業 革新的医薬品等開発のための次世代安全性評価法の開発・標準化と基盤データ取得 研究班 第1回 班会議, 東京, 10月, 2019. (招待講演)
- 2) 花岡健二郎. 新たな近赤外蛍光色素の創製と蛍光プローブの開発. 第26回医用近赤外線分光法研究会・第23回酸素ダイナミクス研究会 合同研究会, 東京, 9月, 2019. (招待講演)
- 3) 花岡健二郎. 生体内低酸素環境を可視化する蛍光プローブの開発. 日本薬学会 第139年会 一般シンポジウム S57 がん微小環境の理解とその克服に向けた薬学的アプローチ ～HIF-1 α の理解と制御に向けて～. 千葉, 3月, 2019.
- 4) 花岡健二郎. 分子レジデンスを制御した近赤外蛍光葉酸受容体検出蛍光プローブの開発. 日本化学会 第99春季年会 (2019) 分子のレジデンスを考えるー新しい機能分子設計の鍵としてー. 神戸, 3月, 2019.
- 5) 花岡健二郎. Development and application of fluorescence probes for detecting reactive sulfur species (RSS). 第92回日本薬理学会年会 107 「硫化水素をはじめとした生理活性イオウ研究の新展開」. 大阪, 3月, 2019.
- 6) 花岡健二郎. 生体内の低酸素・pHを可視化する蛍光プローブの開発. 第44回日本微小循環学会総会 シンポジウム1「微小環境をみる, はかる, 感知する」. 大宮, 2月, 2019. (招待講演)
- 7) 花岡健二郎. 新規蛍光団の創製を基盤とした蛍光プローブの開発. 新学術領域「化学コミュニケーションのフロンティア」第2回 若手シンポジウム. 東京, 1月, 2019.
- 8) 花岡健二郎. 新規蛍光団の創製を基盤とした蛍光プローブの開発. Chemical Probe (生命現象探索分子) 第一回合同合宿セミナー. 千葉, 10月, 2018.
- 9) 花岡健二郎. 活性イオウ分子を検出する蛍光プローブの開発と阻害剤探索への応用. 第91回日本生化学会大会 1S06p 「活性硫黄種の新展開ー硫化水素から過硫化物までー」. 京都, 9月, 2018.
- 10) 花岡健二郎. 活性イオウ分子を検出する蛍光プローブの開発と応用. 第71回日本酸化ストレス学会・第18回日本NO学会 合同学術集会 合同シンポジウム「活性イオウ分子の生体分析と機能・病態解明の新世代研究」. 京都, 5月, 2018.

【特許等の出願状況】

- 1) 花岡 健二郎, 浦野 泰照, 池野 喬之. 新規無蛍光性ローダミン類. 東京大学. PCT/JP2019/8396 (2019年3月5日). 国外.

【報道記事】

- 1) 「水素イオン濃度 光の色で測定」, 日本経済新聞, 2018. 5. 28.

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

7. 北将樹 (名古屋大学大学院生命農学研究科・教授)

KITA, Masaki (Professor, Nagoya University)

【原著論文, original journal】

- 1) Zhang, M., Sunaba, T., Sun, Y., Sasaki, K., Isoda, H., *Kigoshi, H., *Kita, M. Anti-inflammatory marine cyclic peptide stylissatin A and its derivatives inhibit differentiation of murine preadipocytes. *Chem. Commun.* 55, 5471-5474, 2019.
- 2) Futaki, K., Takahashi, M., Tanabe, K., Fujieda, A., *Kigoshi, H., *Kita, M. Synthesis and biological activities of aplyronine A analogs toward the development of antitumor PPI inducers between actin and tubulin: conjugation of the C1-C9 macrolactone part and the C24-C34 side-chain. *ACS Omega* 4, 8598-8613, 2019.
- 3) *Sato, J. J., Bradford, T., Armstrong, K., Donnellan, S., Echenique-Díaz, L. M., Begué-Quiala, G., Gámez-Díez, J., Yamaguchi, N., Nguyen, S. T., Kita, M., Ohdachi, S. Post K-Pg diversification of the mammalian order Eulipotyphla as suggested by phylogenomic analyses of ultra-conserved elements. *Mol. Phylogent. Evol.* 141, 106605, 2019.
- 4) *Kita, M., Watanabe, S., Oka, H., *Kigoshi, H. Synthesis of the trisoxazole macrolactone of mycalolides via template-directed E-selective ring-closing metathesis. *Tetrahedron Lett.* 59, 3664-3668, 2018.
- 5) Watanabe, R., Hu, Y., Iio, K., Yoneda, K., Hattori, A., Arai, A., *Kigoshi, H., *Kita, M. Specific protein-labeling and ligand-binding position analysis with amidopyrene probes as LDI MS tags. *Org. Biomol. Chem.* 16, 7883-7890, 2018.

【解説・総説, review】

- 1) *北将樹. MyPR: 異分野融合型の天然物化学者を志す. *有機合成化学協会誌* 77, 371-373, 2019.
- 2) *北将樹. 生理活性蛍光リガンドと LA-LDI MS ~標的分子の結合位置解析法の開発~. *生命化学研究レター* 59, 7-11, 2019.
- 3) *北将樹. 哺乳類由来の神経毒の化学生物学研究. *化学工業*, 71(2), 73-78, 2020.
- 4) *大館智志, ラザロ エチエニケ-ディアス, ヘラルド ベゲ-キアラ, 溝田浩二, 北将樹. 野生のキューバソレノドン (アルミキ) *Solenodon cubanus* の生態を垣間見る. *哺乳類科学* 58, 204, 2018.
- 5) *北将樹. 質量分析を用いた海洋天然物の構造解析および標的分子における結合位置解析. *有機合成化学協会誌* 76, 442-445, 2018.

【著書】

- 1) *Kita, M., *Kigoshi, H. Discovery and use of natural products and derivatives as chemical probes. in *The Discovery and Utility of Chemical Probes in Target Discovery*, Ed. Brennan P. (The Royal Society of Chemistry), in press (2020).

【招待講演・基調講演】

国際:

- 1) Kita, M. Bioorganic Studies on the Key Natural Products from Venomous Mammals and Marine Invertebrates. 8th International Conference of the Indonesian Chemical Society (ICICS 2019) (インドネシア・ボゴール農科大学) 2019.8.6-7. (基調講演)

- 2) Kita, M. PPI-inducing marine macrolide. 6th Yangtze River Delta International Symposium on Marine Drugs, Nanjing, China, November 2018. (基調講演)

国内：

- 1) 北将樹. 生理活性蛍光リガンドを用いた標的分子の結合様式解析. 理研シンポジウム・第14回有機合成化学のフロンティア, 和光, 6月, 2019. (招待講演)
- 2) 北将樹. 切れ味の良い分子を自然界にもとめて. 第3回函館セミナー, 函館, 9月, 2019. (招待講演)
- 3) 北将樹. 哺乳類由来の神経毒の化学生物学研究. 第42回日本分子生物学会年会・シンポジウム『トキシシン』の織りなす多元的世界, 福岡, 12月, 2019. (招待講演)
- 4) 北将樹. タンパク質間相互作用を誘導する天然物の新展開. 第100回日本化学会春季年会・中長期シンポジウム, 野田, 3月, 2020. (招待講演) [開催中止]
- 5) 北将樹. 哺乳類由来の神経毒の化学生物学研究. 日本農芸化学会 2019年度東京大会 シンポジウム・ケミカルバイオロジーに基づく化学コミュニケーションの理解と制御. 東京, 3月, 2019.

【特許等の出願状況】

- 1) 北将樹, 木越英夫. 質量分析用プローブ. 国立大学法人名古屋大学. 特願 2019-119846 (2019.6.27). 国内

【報道記事】

- 1) 「生命科学における分子化学のプレゼンス」化学と生命科学の融合深く, 化学工業日報, 2019. 3. 12.

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

8. 井貫晋輔 (京都大学大学院薬学研究科・助教)

INUKI, Shinsuke (Assistant Professor, Kyoto University)

【原著論文, original journal】

- 1) Kishi, J., *Inuki, S., Kashiwabara, E., Suzuki, T., Dohmae, N., *Fujimoto, Y. Design and Discovery of Covalent α -GalCer Derivatives as Potent CD1d Ligands. *ACS Chem. Biol.* 15, 353–359, 2020.
- 2) Yamaguchi, A., *Inuki, S., Tokimizu, Y., Oishi, S., Ohno, H. Gold(I)-Catalyzed Cascade Cyclization of Anilines with Dienes: Controllable Formation of Eight-Membered Ring-Fused Indoles and Propellane-Type Indolines. *J. Org. Chem.* 85, 2543–2559, 2020.
- 3) Inuki, S., Sato, K., Zui, N., Yamaguchi, R., Matsumaru, T., *Fujimoto, Y. Synthetic Studies on FNC-RED and Its Analogues Containing an All syn-Cyclopentanetetrol Moiety. *J. Org. Chem.* 84, 12680–12685, 2019.
- 4) Miyagawa, T., *Inuki, S., Oishi, S., Ohno, H. Construction of Quaternary Carbon Stereocenter of α -Tertiary Amine through Remote C–H Functionalization of Tris Derivatives: Enantioselective Total Synthesis of Myriocin. *Org. Lett.* 21, 5485–5490, 2019.
- 5) *Inuki, S., Miyagawa, T., Oishi, S., Ohno, H. Introduction of a Polar Functional Group to the Lipid Tail of 4-epi-Jaspine B Affects Sphingosine Kinase Isoform Selectivity. *Chem. Pharm. Bull.* 66, 866–872, 2018.

【解説・総説, review】

- 1) *井貫 晋輔. 天然有機化合物および誘導体の合成とそれらを活用した生体機能の制御と理解. 薬学雑誌, 2020, in press.

【著書】

【招待講演・基調講演】

国内：

- 1) 井貫晋輔, 免疫機構の調節に関わる天然有機化合物および誘導体の合成と機能解析. 第 18 回創薬基盤化学セミナー, 滋賀, 2 月, 2020. (招待講演)
- 2) 井貫晋輔, 生物活性を有する糖・脂質関連化合物の合成と機能解析. 第 39 回有機合成若手セミナー, 大阪, 8 月, 2019. (招待講演)

【特許等の出願状況】

【報道記事】

【受賞・表彰】

- 1) 日本薬学会奨励賞、天然有機化合物および誘導体の合成とそれらを活用した生体機能の制御と理解、日本薬学会、2019 年 3 月 20 日
- 2) 天然物化学談話会奨励賞、免疫機構の調節に関わる複合脂質・糖質の合成と構造展開による生物有機化学研究、天然物化学談話会、2018 年 7 月 4 日

【アウトリーチ活動】

9. 下山敦史 (大阪大学大学院理学研究科・助教)

SHIMOYAMA, Atsushi (Assistant Professor, Osaka University)

【原著論文, original journal】

- 1) Kabayama, K., Kaneda, K., Shinohara, A., Shirakami, Y., Watabe, T., Zhang, Z., Toyoshima, A., Yoshimura, T., Manabe, Y., Shimoyama, A., *Fukase, K. Activities of the Consortium for Medicine, Chemistry, and Physics at Osaka University, *Journal of Medical Imaging and Radiation Sciences* 50(1), S40, 2019.
- 2) Masui, S., Manabe, Y., Hirao, K., Shimoyama, A., Fukuyama, T., Ryu, I., *Fukase, K. Kinetically controlled Fischer glycosidation under fluidic conditions: A new method for preparing furanosides. *Synlett* 30, 397-400, 2019.
- 3) Hu, R., Shimoyama, A., *Fukase, K., Synthesis of Helicobacter pylori peptidoglycan fragments, *PEPTIDE SCIENCE* 2018, 109, 2019.
- 4) Lembo-Fazio, L., Billod, J-M., Di Lorenzo, F., Paciello, I., Pallach, M., Vaz Francisco, S., Holgado, A., Beyaert, R., Fresno, M., Shimoyama, A., Fukase, K., Giraud, E., *Martín Santamaría, S., *Bernardini, M-L., *Silipo, A. Bradyrhizobium Lipid a: Immunological Properties and Molecular Basis of its Binding to the Myeloid Differentiation Protein-2/Toll-like receptor 4 complex, *Front. Immunol.* 9, 1888, 2018.
- 5) Arai, Y., Yokoyama, K., Kawahara, Y., Feng, Q., Ohta, I., Shimoyama, A., Inuki, S., Fukase, K., *Kabayama, K., *Fujimoto, Y. Time-lapse Monitoring of TLR2 Ligand Internalization with Newly Developed Fluorescence Probes, *Org Biomol Chem* 16, 3824-3830, 2018.
- 6) *Suzuki, T., Ishigaki, Y., Sugawara, K., Umezawa, Y., Katoono, R., Shimoyama, A., Manabe, Y., Fukase, K., Fukushima, T. Narrower HOMO-LUMO gap attained by conformational switching through peripheral polyarylation in 1,4,5,8-tetraaza-9,10-anthraquinodimethanes, *Tetrahedron* 74, 2239-2244, 2018.
- 7) Shibata, N., Kunisawa, J., Hosomi, K., Fujimoto, Y., Mizote, K., Kitayama, N., Shimoyama, A., Mimuro, H., Sato, S., Kishishita, N., Ishii, K-J., Fukase, K., *Kiyono, H. Lymphoid tissue-resident Alcaligenes LPS

induces IgA production without excessive inflammatory responses via weak TLR4 agonist activity, *Mucosal Immunology* 11, 693-702, 2018.

【解説・総説, review】

- 1) *Shimoyama, A. Gut Microbial Lipopolysaccharide Interacts with Host Immune System, *TIGG* 31 (179), E55-E56, J55-J56, 2019.
- 2) *Shimoyama, A. Development of Chemically Synthesized Self-adjuvanting Vaccine, *TIGG* 30 (173), E41-E43, J19-J21, 2018.

【著書】

- 1) 狩野裕考, 新田昂大, 藤居真優, 樺山一哉, 下山敦史, 深瀬浩一, Sandro Sonnini, 鈴木明身, *井ノ口仁一, ガングリオシドのアシル鎖構造による Toll-like receptor 4 活性化制御メカニズム, エンドトキシン・自然免疫研究 22~, 隅田泰生他 監修, 医学図書出版, 22, 1-7, 2019.

【招待講演・基調講演】

国際：

- 1) Shimoyama, A. Elucidation of bacterial-host chemical communications based on chemically synthesized lipid As, The 4th A3 Roundtable Meeting on Chemical Probe Research Hub, Sendai, Japan, November 18-20, 2019. (招待講演)
- 2) Shimoyama, A. Synthesis and functions of symbiotic bacterial lipopolysaccharide partial structures, 1st Japan Europe Workshop on Glycosphingolipids and Membrane Homeostasis, Strasbourg, France, September 2-4, 2019. (招待講演)
- 3) Shimoyama, A. Synthesis and immunomodulative functions of symbiotic bacterial lipid A, 25th International Symposium on Glycoconjugates (Glyco25), Milano, Italy, August 25-31, 2019. (招待講演)
- 4) Shimoyama, A. Chemical synthesis of bacterial lipid As and elucidation of bacterial-host chemical communications, 3rd NAPOSAKA meeting, Napoli, Italy, June 28, 2019, (招待講演)
- 5) Shimoyama, A. Synthesis and Function of Symbiotic Bacterial Lipid A, Kick-off meeting for BRuSH "Oral Bacteria as Determinants for Respiratory Health", Solstrand Hotel, Os, Norway, March, 2019.
- 6) Shimoyama, A. Synthesis and immunomodulating function of symbiotic bacterial lipopolysaccharide partial structures, A3 young scientist & young PI meeting, Sendai, Japan, February, 2019.

国内：

- 1) 下山敦史. 免疫調節因子リポド A の化学合成が拓く細菌-宿主間のケミカルエコロジー. 第 54 回天然物化学談話会, 札幌, 7 月, 2020. (招待講演)
- 2) 下山敦史. 寄生・共生菌由来リポ多糖部分構造の合成と免疫調節機能の解明、第一回おおさか未来化学研究会、大阪、8 月、2018.

【特許等の出願状況】

【報道記事】

【受賞・表彰】

- 1) 松浦良史 (D2) . 優秀演題賞、相乗的作用により受容体機能制御を行う TLR4/MD-2 リガンドの機能評価、第 25 回 日本エンドトキシン・自然免疫研究会、2019 年 11 月 30 日
- 2) 松浦良史 (D2) . 日本糖質学会ポスター賞、相乗的に受容体機能制御を行う TLR4/MD-2 リガンドの構造活性相関研究、日本糖質学会、2019 年 8 月 19~21 日
- 3) 下山敦史. 第 18 回天然物化学談話会奨励賞、微生物の特性に着目した寄生・共生菌由来リポ多糖部分構造の合成と免疫調節機能の解明、天然物化学談話会、2018 年 7 月 10 日

【アウトリーチ活動】

- 1) 大阪大学まちかね祭開催時（大阪、2019年11月3日）に、小中高生およびその保護者（約50名）に対し、味覚に関する公開講座を実施し、関連領域の紹介も行った。
- 2) ひらめきときめき夢化学開催時（大阪、2019年8月10日）に、高校生（約10名）に対し、カフェイン抽出実験を指導し、天然物化学研究の紹介を通じ、関連領域の紹介も行った。
- 3) オープンキャンパス開催時（大阪、2019年8月8日）に、中高生（約50名）に対してケミカルバイオロジーに関する説明を行い、関連領域の紹介も実施した。
- 4) 大阪大学いちよう祭開催時（大阪、2019年5月2日）に、小中高生およびその保護者（約50名）に対し、味覚に関する公開講座を実施し、関連領域の紹介も行った。

10. 山下敦子（岡山大学大学院医歯薬学総合研究科（薬学系）・教授）

YAMASHITA, Atsuko (Professor, Okayama University)

【原著論文, original journal】

- 1) Yoshida, T., Yasui, N., Kusakabe, Y., Ito, C., Akamatsu, M., *Yamashita, A. Differential scanning fluorimetric analysis of the amino-acid binding to taste receptor using a model receptor protein, the ligand-binding domain of fish T1r2a/T1r3. *PLoS ONE* 14, e0218909, 2019.
- 2) Nakatani, T., *Yasui, N., Tamura, I., *Yamashita, A. Specific modification at the C-terminal lysine residue of the green fluorescent protein variant, GFPuv, expressed in *Escherichia coli*. *Sci. Rep.* 9, 4722, 2019.
- 3) 細谷麻以子, *山下敦子. うま味受容体細胞外リガンド結合ドメインの X 線結晶構造解析. *SPring-8/SACLA 利用研究成果集*, 7, 2019.

【解説・総説, review】

- 1) 魚住信之, 山下敦子. 微生物 TRP チャネルの機能と役割. *医学のあゆみ*, 270, 970-976, 2019.
- 2) *山下敦子. 食行動と栄養摂取をむすぶ味覚受容体による味分子認識. *実験医学*, 37, 531-535, 2019.

【著書】

【招待講演・基調講演】

国際：

- 1) Yamashita, A. A fish taste receptor opened the way for structural biology of taste perception. The 18th International Symposium on Molecular and Neural Mechanisms of Taste and Olfactory Perception (ISMNTOP2019), Fukuoka, Nov. 2019. (招待講演)
- 2) Yamashita, A. Structural basis of amino acid-perception by T1r taste receptors. The 9th Federation of Asian and Oceanian Physiological Societies Congress (FAOPS2019) in conjunction with the 96th Annual Meeting of the Physiological Society of Japan, Kobe, Japan, Mar, 2019.
- 3) Yoshida, T., Yasui, N., Atsumi, N., Kusakabe, Y., Yamashita, A. Protein thermal shift assay indicated a broad amino acid-binding capability of the ligand-binding domains of fish T1r taste receptor. The 17th International Symposium on Molecular and Neural Mechanisms of Taste and Olfactory Perception (ISMNTOP2018), Fukuoka, Japan, Dec, 2018.

国内：

- 1) 山下敦子. 食品成分と生体のインターフェース・味覚受容体による味物質認識の構造基盤. 日本生化学会北陸支部第37回大会シンポジウム「食品機能発現のインターフェースを探る」, 福井, 6月, 2019. (招待講演)
- 2) Yamashita, A. Structural basis for recognition of preferable taste substances by T1r taste receptors. 第41回日本分子生物学会年会. 横浜, 11月, 2018.

- 3) Yamashita, A. Taste perception approached by biophysics and structural biology. 日本生物物理学会第56回年会. 岡山, 9月, 2018.

【特許等の出願状況】

【報道記事】

- 1) 科学の扉『「おいしい」の秘密とは』, 朝日新聞 2020年2月17日
URL: <https://www.asahi.com/articles/DA3S14367584.html>
- 2) 「大腸菌に緑色蛍光タンパク質 (GFP) をつくらせると、わずかな違いをもつ2種類の GFP ができることを発見」、岡山大学、プレスリリース、2019. 3. 18.
URL: http://www.okayama-u.ac.jp/tp/release/release_id606.html

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

- 1) 理化学研究所放射光科学研究センター発行の広報用小冊子「SPring-8 持続可能な未来へ」(2020年1月1日発行)にて関連研究内容が取り上げられた。
- 2) 金光学園高等学校(岡山, 2019年5月11日)にて、高校生約13名、教員4名に対して関連研究内容の紹介を行った。

11. 新藤充 (九州大学先導物質化学研究所・教授)

SHINDO, Mitsuru (Professor, Kyushu University)

【原著論文, original journal】

- 1) Yoshinaga, T., Iwata, T., *Shindo, M. Mild Environment-Friendly Oxidative Debenzylation of *N*-Benzylnilines using DMSO as an Oxidant, *Chem Lett* 49, 191-194, 2020.
- 2) *Shindo, M., Makigawa, S., Matsumoto, K., Iwata, T., Wasano, N., Kano, A., Terao Morita, M., Fujii, Y. Essential structural features of (2*Z*,4*E*)-5-phenylpenta-2,4-dienoic acid for inhibition of root gravitropism, *Phytochemistry* 172, 112287, 2020.
- 3) Hirao-Suzuki, M., *Takeda, S., Iwata, T., Fujita, S., Tomiyama, T., Takiguchi, M., Toda, A., Shindo, M. (-)-Isostemonamine can enhance the anti-proliferative activity of trichostatin A against human breast cancer MDA-MB-231 cells, *BPB Reports*, 3(2): 56-59, 2020.
- 4) Sun, J., Yoshiiwa, T., Iwata, T., *Shindo, M. Synthesis of Ynolates via Double Deprotonation of Non-Brominated Esters, *Org. Lett.* 21, 6585-6588, 2019. [Editor's choice] [Cover Figure]
- 5) Yoshinaga, T., Fujiwara, T., Iwata, T., *Shindo, M. Synthesis of Distorted 1,8,13-Trisilyl-9-hydroxytricycenes by Triple Cycloaddition of Ynolates to 3-Silylbenzynes, *Chem. Eur. J.* 25, 13855-13859, 2019. [Cover Figure] [highlighted by *Synfacts*, 03012020, 16(01), 0032]
- 6) *Kano, A., Iwasaki, T., Shindo, M. Bongkrekiic acid facilitates glycolysis in cultured cells and induces cell death under low glucose conditions, *Biochemistry and Biophysics Reports*, 20, 100683, 2019.
- 7) Fujita, S., Nishikawa, K., Iwata, T., Tomiyama, T., Ikenaga, H., Matsumoto, K., *Shindo, M. Asymmetric Total Synthesis of (-)-Stemonamine and its Stereochemical Stability, *Chem. Eur. J.* 24, 1539-1543, 2018.
- 8) Fujita, S., Suyama, M., Matsumoto, K., Yamamoto, A., Yamamoto, T., Hiroshima, Y., Iwata, T., Kano, A., *Shinohara, Y., *Shindo, M. Synthesis and evaluation of simplified functionalized bongkrekiic acid analogs, *Tetrahedron* 74, 962-969, 2018.
- 9) Iwata, T., Tomiyama, T., Fujita, T., *Shindo, M. First Asymmetric Total Synthesis of (-)-Isostemonamine And Kinetic Analysis of Its Isomerizations, *Heterocycles* 97, 712 – 718, 2018.

- 10) Hirao-Suzuki, M., *Takeda, S., Iwata, T., Fujita, S., Tomiyama, T., Takiguchi, M., Shindo, M. Anti-proliferative effects of (-)-isostemonamine on highly aggressive human breast cancer MDA-MB-231 cells, *BPB Reports* 1, 32-34, 2018.

【解説・総説, review】

- 1) Iwata, T., *Shindo, M. Synthesis, Stereochemical Stability, and Biological Activity of Stemonamine and Its Related Stemonamine Alkaloids, *Heterocycles* 98, 349-377, 2019.
- 2) 新藤充. 生理活性アルケンの幾何異性は生体に厳密に認識される. 化学の要点シリーズ 27 アルケンの合成, コラム pp62-63. 日本化学会編, 安藤香織著, 共立出版, 2018.

【著書】

【招待講演・基調講演】

- 1) 新藤充. 高エネルギー反応剤：イノラートの最近の研究展開, 徳島大学薬学部特別講演会, 徳島, 6月, 2019. (招待講演)
- 2) 新藤充. 高エネルギー分子：イノレートに関する最近の研究展開, 岡山大学大学院医歯薬学総合研究科特別講演会, 岡山, 7月, 2019. (招待講演)

【特許等の出願状況】

【報道記事】

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

- 1) オープンキャンパス開催時 (福岡、2019年5月18日) に大学生、一般人 (約10名) に対して研究内容のポスター発表を行い、アレロパシーに関する説明を行った。
- 2) オープンキャンパス開催時 (福岡、2018年5月) に大学生、一般人 (約20名) に対して研究内容のポスター発表を行い、アレロパシーに関する説明を行った。

12. 高橋栄夫 (横浜市立大学大学院生命医科学研究科・教授)

TAKAHASHI, Hideo (Professor, Yokohama City University)

【原著論文, original journal】

- 1) Argunhan, B., Sakakura, M., Afshar, N., Kurihara, M., Ito, K., Maki, T., Kanamaru, S., Murayama, Y., Tsubouchi, H., Takahashi, M., *Takahashi, H., *Iwasaki, H. Cooperative interactions facilitate stimulation of Rad51 by the Swi5-Sfr1 auxiliary factor complex. *eLife*, 24;9. e52566, 2020. doi: 10.7554/eLife.52566.
- 2) *Sakakura, M., Ohkubo, Y., Oshima, H., Re, S., Ito, M., Sugita, Y., *Takahashi, H. Structural mechanisms underlying activity changes in an AMPA-type glutamate receptor induced by substitutions in its ligand-binding domain. *Structure*, 27, 1698-1709, 2019. [press release]
- 3) Oshima, H., Re, S., Sakakura, M., Takahashi, H., *Sugita, Y. Population shift mechanism for partial agonism of AMPA receptor. *Biophys. J.* 116, 52-68, 2019.
- 4) Sugiki, T., Egawa, D., Kumagai, K., Kojima, C., Fujiwara, T., Takeuchi, K., Shimada, I., *Hanada, K., *Takahashi, H. Phosphoinositide binding by the PH domain in ceramide transfer protein (CERT) is inhibited by hyperphosphorylation of an adjacent serine-repeat motif. *J. Biol. Chem.* 293, 11206-11217, 2018.
- 5) Suzuki, R., Sakakura, M., Mori, M., Fujii, M., Akashi, S., *Takahashi, H. Methyl-selective isotope labeling

using α -ketoisovalerate for the yeast *Pichia pastoris* recombinant protein expression system. *J. Biomol. NMR.* 71, 213-223, 2018.

【解説・総説, review】

【著書】

【招待講演・基調講演】

国際：

- 1) Takahashi, H. NMR analysis of the structural and functional stability of proteins. The 6th International Symposium on Drug Discovery and Design by NMR, Yokohama, Japan, 2018.

国内：

- 1) 高橋栄夫, NMR 相互作用解析による創薬アプローチ. 生有研シンポジウム“生体分子間に働く相互作用解析法の現状と今後の可能性”(サントリー生命科学財団主催), 奈良, 12月, 2019. (招待講演)

【特許等の出願状況】

【報道記事】

- 1) 「グルタミン酸受容体の活性調節に重要な構造の変化を解明 ～動きを指標とした脳神経疾患の新薬開発に期待～」, https://www.yokohama-cu.ac.jp/news/2019/01910sakakura_Strct.html

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

13. 砂塚敏明 (北里大学北里生命科学研究所・教授)

SUNAZUKA, Toshiaki (Professor, Kitasato University)

【原著論文, original journal】

- 1) *Sadamatsu, H., Takahashi, K., Tashiro, H., Kato, G., Noguchi, Y., Kurata, K., Ōmura, S., Kimura, S., Sunazuka, T., Sueoka-Aragane, N. The non-antibiotic macrolide EM900 attenuates HDM and poly(I:C)-induced airway inflammation with inhibition of macrophages in a mouse model. *Inflamm. Res.*, 69, 139-151, 2020. doi: 10.1007/s00011-019-01302-3.
- 2) Miyano, R., Matsuo, H., Mokudai, T., Noguchi, Y., Higo, M., Nonaka, K., Niwano, Y., Sunazuka, T., Shiomi, K., Takahashi, Y., *Ōmura, S., Nakashima, T. Trichothioneic acid, a new antioxidant compound produced by the fungal strain *Trichoderma virens* FKI-7573. *J. Biosci. Bioeng.* 129(4), 508-513, 2020. doi: 10.1016/j.jbiosc.2019.11.007.
- 3) Goto, K., Horikoshi, R., Nakamura, S., Mitomi, M., Oyama, K., Hirose, T., *Sunazuka, T., Ōmura, S. Synthesis of pyripropene derivatives and their pest-control efficacy. *J. Pestic Sci.*, 25, 255-263, 2019. doi: 10.1584/jpestics.D19-032.
- 4) Matsuo, H., Hirose, T., Mokudai, T., Nonaka, K., Niwano, Y., Sunazuka, T., Takahashi, Y., *Ōmura, S., Nakashima, T. Absolute structure and anti-oxidative activity of chaetochiversin C isolated from fungal strain *Neocosmospora* sp. FKI-7792 by physicochemical screening. *J. Gen. Appl. Microbiol.* 2019. doi: 10.2323/jgam.2019.06.001.

- 5) Matsuo, H., Nakanishi, J., Noguchi, Y., Kitagawa, K., Shigemura, K., [Sunazuka, T.](#), Y., *[Ōmura, S.](#), Nakashima, T. Nanaomycin K, a new epithelial-mesenchymal transition inhibitor produced by the actinomycete "*Streptomyces rosa* subsp. *notoensis*" OS-3966. *J. Biosci. Bioeng.*, 127, 1389-1723, 2019.
- 6) Hayashi, Y., Hirose, T. Iwatsuki, M., [Ōmura, S.](#), *[Sunazuka, T.](#) Synthesis of the Antimalarial Peptide Aldehyde, a Precursor of Kozupeptin A, Utilizing a Designed Hydrophobic Anchor Molecule. *Org. Lett.*, 21, 8229-8233 2019.
- 7) Tran, D.H., Sugamata, R., Hirose, T., Suzuki, S., Noguchi, Y., Sugawara, A., Ito, F., Yamamoto, T., Kawachi, S., Akagawa, K.S., [Ōmura, S.](#) [Sunazuka, T.](#), Ito, N., Mimaki, M., *Suzuki, K. Azithromycin, a 15-membered macrolide antibiotic, inhibits influenza A(H1N1) pdm09 virus infection by interfering with virus internalization process. *J. Antibiot.*, 72, 759-768, 2019.
- 8) Watanabe, M., Sugawara, A., Noguchi, Y., Hirose, T., [Ōmura, S.](#), *[Sunazuka, T.](#), Horie, R. Jietacins, azoxy natural products, as novel NF- κ B inhibitors: Discovery, synthesis, biological activity, and mode of action. *Eur. J Med. Chem.*, 178, 636-647, 2019.
- 9) Goto, K., Horikoshi, R., Mitomi, M., Oyama, K., Hirose, T., *[Sunazuka, T.](#), [Ōmura, S.](#) Synthesis and insecticidal efficacy of pyripyropene derivatives. Part II-Invention of afidopyropen. *J. Antibiot.*, 72. 661-681, 2019.
- 10) Sakai, K., Unten, Y., Iwatsuki, M., Matsuo, H., Fukasawa, W., Hirose, T., Chinen, T., Nonaka, K., Nakashima, T., [Sunazuka, T.](#), Usui, T., Murai, M., Miyoshi, H., Asami, Y., *[Ōmura, S.](#), Shiomi, K. Fusaramin, an antimitochondrial compound produced by *Fusarium* sp., discovered using multidrug-sensitive *Saccharomyces cerevisiae*. *J. Antibiot.*, 72, 645-652, 2019.
- 11) *Uchimura, T., Nakamura, D.S., Link, E.M., Noguchi, Y., [Ōmura, S.](#), [Sunazuka, T.](#) Greenblatt, D.J., Zeng, L. Erythromycin acts through the ghrelin receptor to attenuate inflammatory responses in chondrocytes and maintain joint integrity. *Biochem. Pharmacol.*, 165, 79-90, 2019.
- 12) Matsuo, H., Noguchi, Y., Také, A., Nakanishi, J., Shigemura, K., [Sunazuka, T.](#), Takahashi, Y., *[Ōmura, S.](#), Nakashima, T. Nanaomycin I and J: New nanaomycins generated by mycothiol-mediated compounds from "*Streptomyces rosa* subsp. *notoensis*" OS-3966. *J. Biosci. Bioeng.*, 127, 549-553, 2019.
- 13) Hayashi, Y., Fukasawa, W., Hirose, T., Iwatsuki, M., Hokari, R., Ishiyama, A., Kanaida, M., Nonaka, K., Také, A. Otoguro, K. [Ōmura, S.](#), *[Sunazuka, T.](#) Kozupeptins, antimalarial agents produced by *Paracamarosporium* species: isolation, structural elucidation, total synthesis, and bioactivity. *Org. Lett.* 21, 2180-2184, 2019.
- 14) Hayashi, Y., Fukasawa, W., Hirose, T., Iwatsuki, M., Hokari, R., Ishiyama, A., Kanaida, M., Nonaka, K., Take, A., [Ōmura, S.](#), Shiomi, K., *[Sunazuka, T.](#) Kozupeptins, Antimalarial Agents Produced by *Paracamarosporium* Species: Isolation, Structural Elucidation, Total Synthesis, and Bioactivity. *Org. Lett.* 21, 2180-2184, 2019.
- 15) Sakai, K., Hirose, T., Iwatsuki, M., Chinen, T., Kimura, T., Suga, T., Nonaka, K., Nakashima, T., [Sunazuka, T.](#), Usui, T., Asami, Y., [Ōmura, S.](#), *Shiomi, K. Pestynol, an Antifungal Compound Discovered Using a *Saccharomyces cerevisiae* 12gene Δ 0HSR-iERG6-Based Assay. *J. Nat. Prod.* 81, 1604-1609, 2018.
- 16) *Horikoshi, R., Goto, K., Hirose, T., Miomi, M., Iwatsuki, M., Oyama, K., [Sunazuka, T.](#), [Ōmura, S.](#) Insecticidal properties of pyripyropene A, a microbial secondary metabolite, against agricultural pests. *J. Pestic. Sci.* 43, 266-271, 2018.
- 17) *Goto, K., Horikoshi, R., Mitomi, M., Oyama, K., Hirose, T., [Ōmura, S.](#), [Sunazuka, T.](#) Synthesis and insecticidal efficacy of pyripyropene derivatives focusing on the C-1, C-7, and C-11 positions' substituent groups. *J. Antibiot.* 71, 785-797, 2018.
- 18) Yamada, T., Yagita, M., Kobayashi, Y., Sennari, G., Matsui, H., Horimatsu, Y., Hanaki, H., Hirose, T., [Ōmura, S.](#), *[Sunazuka, T.](#) Synthesis and evaluation of antibacterial activity of Bottromycins. *J. Org. Chem.* 83, 7135-7149, 2018.
- 19) Sugawara, A., Kubo, M., Hirose, T., Yahagi, K., Tsunoda, N., Noguchi, Y., Nakashima, T., Takahashi, Y., Welz, C., Mueller, D., Mertens, C., Kobberling, J., [Ōmura, S.](#), *[Sunazuka, T.](#) Jietacins, azoxy antibiotics with potent nematocidal activity: Design, synthesis, and biological evaluation against parasitic nematodes. *Eur. J. Med.*

Chem. 145, 524-538, 2018.

- 20) Ando, H., Kimishima, A., Ohara, M., Hirose, T., Matsumaru, T., Takada, H., Morodome, K., Miyamoto, T., Sugawara, A., Ōmura, S., *Sunazuka, T. Toward the total synthesis of luminamicin; an anaerobic antibiotic: construction of highly functionalized cis-decalin containing a bridged ether moiety. *J. Antibiot.* 71, 268–272, 2018.

【解説・総説, review】

【著書】

【招待講演・基調講演】

国内：

- 1) 砂塚敏明. 「日本発の大村天然物による創薬研究」講演会. 情報計算法学生物学会, 東京, 5 月, 2019. (招待講演)
- 2) 砂塚敏明. 「日本発の大村天然物による創薬研究」第 402 回 CBI 学会 (情報計算法学生物学会) 講演会. 東京, 1 月, 2019.
- 3) 砂塚敏明. 「大村創薬グループにおける微生物創薬」第 36 回メディシナルケミストリーシンポジウム. 京都, 11 月, 2018.
- 4) 砂塚敏明. 「日本発の大村天然物による微生物創薬」有機合成化学協会 平成 30 年度 後期有機合成化学講習会. 東京, 11 月, 2018.

【特許等の出願状況】

【報道記事】

【受賞・表彰】

【アウトリーチ活動】

14. 細川誠二郎 (早稲田大学理工学術院・准教授)

HOSOKAWA, Seijiro (Associate Professor, Waseda University)

【原著論文, original journal】

- 1) Kiritani, K., *Hosokawa, S. Synthesis of Karrikinolide Using the Aldol Type Acetal Addition Reaction. *J. Org. Chem.* 85, 3936-3941, 2020.
- 2) *Hosokawa, S., Nakanishi, K., Udagawa, Y., Maeda, M., Sato, S., Nakano, K., Masuda, T., Ichikawa, Y. Total synthesis of exigurin: the Ugi reaction in a hypothetical biosynthesis of natural products. *Org. Biomol. Chem.* 18, 687-693, 2020.
- 3) *Ichikawa, Y., Yamasaki, T., Nakanishi, K., Udagawa, Y., Hosokawa, S., Matsuda, T. Bioinspired Synthesis of the Central Core of Halichonadin H: The Passerini Reaction in a Hypothetical Biosynthesis of Marine Natural Products. *Synthesis*, 51, 2305-2310, 2019.
- 4) Sengupta, A., *Hosokawa, S. Total Synthesis of PF1163B. *Synlett*, 30, 709-712, 2019.
- 5) Sato, H., *Hosokawa, S. Synthesis of the C1–C17 Segment of Bafilomycin N, *Synlett*, 30, 577-580, 2019.
- 6) Murakoshi, S., *Hosokawa, S. Synthesis of C3-C21 Segment of Aflastatin A Using Remote Asymmetric Induction Reactions, *Organic Letters*, 21, 758-761, 2019.
- 7) Sengupta, A., *Hosokawa, S. 2-Isopropylbenzimidazole and 2-methylbenzimidazole as bulky proton sources: Stereoselective protonation and application to the synthesis of γ - and δ -lactones, *Tetrahedron Letters*, 60, 411-414, 2019.

【解説・総説, review】

【著書】

- 1) Hosokawa, S. Stereoselective C-Acylation Reactions and Their Applications to Bioactive Compounds. Chapter 3 (pp. 149-212) in *Advances in Chemistry Research, volume 48*. James C. Taylor eds. Nova Science Publishers, Inc., 2019.

【招待講演・基調講演】

【特許等の出願状況】

【報道記事】

【受賞・表彰】

- 1) 桐田奏（細川研究室）、優秀発表賞、煙に含まれる発芽促進物質 *karrikinolide* のグラムスケール合成、日本農芸化学会関東支部 2019 年度大会、2019 年 9 月 7 日

【アウトリーチ活動】