

## Original Publications

- (22) T. Toyama, **T. Saitoh**, Y. Takahashi, K. Oka, D. Citterio, K. Suzuki\*, S. Nishiyama\*  
“Click Reaction Based on the Biosynthesis of Firefly Luciferin”  
*Chemistry Letters*, in press, **2017**.  
[doi: 10.1246/cl.170094](https://doi.org/10.1246/cl.170094)
- (21) H. Nagase\*, N. Yamamoto, M. Yata, S. Ohruai, T. Okada, **T. Saitoh**, N. Kutsumura, Y. Nagumo, Y. Irukayama, Y. Ishiukawa, Y. Ogawa, S. Hirayama, D. Kuroda, Y. Watanabe, H. Gouda, M. Yanagisawa  
“Design and Synthesis of Potent and Highly Selective Orexin 1 Receptor Antagonists with a Morphinan Skeleton and their Pharmacologies”  
*Journal of Medicinal Chemistry*, Vol. 60, No. 3, pp. 1018–1040, **2017**.  
[doi: 10.1021/acs.jmedchem.6b01418](https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.6b01418)
- (20) S. Yajima, **T. Saitoh\***, K. Kawa, K. Nakamura, H. Nagase, Y. Einaga, S. Nishiyama  
“Asymmetric induction in cyclohexadienones carrying  $\alpha$ -D- glucopyranosyl moiety”  
*Tetrahedron*, Vol. 72, No. 51, pp. 8428–8435, **2016**.  
[doi: 10.1016/j.tet.2016.10.068](https://doi.org/10.1016/j.tet.2016.10.068)
- (19) S. Ioka, **T. Saitoh**, S. Iwano, S. A. Maki, M. Imoto, S. Nishiyama\*  
“Development of luminescence-controllable a firefly luciferin analogue using selective enzymatic cyclization”  
*Tetrahedron*, Vol. 72, No. 47, pp. 7505–7508, **2016**.  
[doi:10.1016/j.tet.2016.09.069](https://doi.org/10.1016/j.tet.2016.09.069)
- (18) S. Ioka, **T. Saitoh**, S. Iwano, K. Suzuki, S. A. Maki, A. Miyawaki, M. Imoto, S. Nishiyama\*  
“Synthesis of firefly luciferin analogues and evaluation of the luminescent properties”  
*Chemistry, A European Journal*, Vol. 22, pp. 9330–9337, **2016**.  
[doi:10.1002/chem.201600278](https://doi.org/10.1002/chem.201600278)
- (17) N. Kutsumura, R. Nakajima, Y. Koyama, Y. Miyata, **T. Saitoh**, N. Yamamoto, S. Iwata, H. Fujii, H. Nagase\*  
“Investigation of 7-benzylidenenaltrexone derivatives as a novel structural antitrichomonal lead compound”  
*Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, Vol. 25, No. 21, pp. 4890–489, **2015**.  
[doi:10.1016/j.bmcl.2015.06.002](https://doi.org/10.1016/j.bmcl.2015.06.002)

- (16) T. Nagahara, **T. Saitoh**, N. Kutsumura, Y. Irukayama-Tomobe, Y. Ogawa, D. Kuroda, H. Gouda, H. Kumagai, H. Fujii, M. Yanagisawa, H. Nagase\*  
“Design and Synthesis of Non-Peptide, Selective Orexin Receptor 2 Agonists”  
*Journal of Medicinal Chemistry*, Vol. 58, No. 20, pp. 7931–7937, 2015.  
[doi:10.1021/acs.jmedchem.5b00988](https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.5b00988)  
(Selected as a *Featured Article and Highly Read Article of 2015 in Journal of Medicinal Chemistry*)
- (15) T. Kojima, R. Obata, **T. Saito**, Y. Einaga, S. Nishiyama\*  
“Cathodic reductive coupling of methyl cinnamate on boron-doped diamond electrodes and synthesis of new neolignan-type products”  
*Beilstein Journal of Organic Chemistry*, Vol. 11, No.1, pp. 200–203, 2015.  
[doi:10.3762/bjoc.11.21](https://doi.org/10.3762/bjoc.11.21)
- (14) R. Nishihara, H. Suzuki, E. Hoshino, S. Suganuma, M. Sato, **T. Saitoh**, S. Nishiyama, N. Iwasawa, D. Citterio, K. Suzuki\*  
“Bioluminescent coelenterazine derivatives with imidazopyrazinone C-6 extended substitution”  
*Chemical Communications*, Vol. 51, No. 2, pp. 391–394, 2014.  
[doi:10.1039/C4CC06886F](https://doi.org/10.1039/C4CC06886F)
- (13) H. Kubo, K. Matsui, **T. Saitoh**, S. Nishiyama\*  
“Synthesis and assignment of the absolute stereochemistry of (+)-hemifistularin 3”  
*Tetrahedron*, Vol. 70, No.37, pp. 6392–6397, 2014.  
[doi:10.1016/j.tet.2014.07.049](https://doi.org/10.1016/j.tet.2014.07.049)
- (12) K. Kawa, **T. Saitoh**, E. Kaji, S. Nishiyama\*  
“Glycosylation of a Newly Functionalized Orthoester Derivative”  
*Molecules*, Vol. 19, No. 2, pp. 2602–2611, 2014.  
[doi:10.3390/molecules19022602](https://doi.org/10.3390/molecules19022602)
- (11) T. Kashiwagi, T. Fuchigami, **T. Saito**, S. Nishiyama, M. Atobe\*  
“Sequential Paired Electrosynthesis of a Diaryl Ether Derivative Using an Electrochemical Microreactor”  
*Chemistry Letters*, Vol. 43, pp. 799–801, 2014.  
[doi:10.1246/cl.140046](https://doi.org/10.1246/cl.140046)
- (10) K. Kawa, **T. Saitoh**, E. Kaji, S. Nishiyama\*  
“Development of Glycosylation Using the Glucopyranose 1,2-Orthobenzoate under

Electrochemical Conditions”  
*Organic Letters*, Vol. 15, pp. 5484–5487, 2013.  
[doi:10.1021/ol4026342](https://doi.org/10.1021/ol4026342)

- (9) Y. Kawabata, Y. Naito, **T. Saitoh**, K. Kawa, T. Fuchigami, S. Nishiyama\*  
“Synthesis of (+)-*O*-Methylthalibrine Employing a Stereocontrolled Bischler-Napieralski Reaction and an Electrochemically Generated Diaryl Ether”  
*European Journal of Organic Chemistry*, pp. 99–104, 2014.  
[doi:10.1002/ejoc.201301128](https://doi.org/10.1002/ejoc.201301128)
- (8) M. Kuroda, S. Funasaki, **T. Saitoh**, Y. Sasazawa, S. Nishiyama, K. Umezawa, S. Shimizu\*  
“Determination of topological structure of ARL6ip1 in cells: Identification of the essential binding region of ARL6ip1 for conophylline”  
*FEBS Letters*, Vol. 587, pp. 3656–3660, 2013.  
[doi:10.1016/j.febslet.2013.09.017](https://doi.org/10.1016/j.febslet.2013.09.017)
- (7) A. Hara, R. Morimoto, Y. Iwasaki, **T. Saitoh**, Y. Ishikawa, S. Nishiyama\*  
“Total Syntheses of Amphidinolides B, G, and H”  
*Angewante Chemie International Edition*, Vol. 51, No. 39, pp. 9877–9880, 2012.  
[doi:10.1002/anie.201204992](https://doi.org/10.1002/anie.201204992)
- (6) D. Kajiyama, **T. Saitoh**, S. Yamaguchi, S. Nishiyama\*  
“Oxidative Cyclization of Tryptamine by means of Hyper-valent Iodobenzene toward Pyrroloindole Alkaloid Synthesis”  
*SYNTHESIS*, Vol. 44, No. 11, pp. 1667–1671, 2012.  
[doi:10.1055/s-0031-1291006](https://doi.org/10.1055/s-0031-1291006)
- (5) T. Sumi, **T. Saitoh**, K. Natsui, T. Yamamoto, M. Atobe, Y. Einaga, S. Nishiyama\*  
“Anodic oxidation on a boron-doped diamond electrode mediated by methoxy radicals”  
*Angewante Chemie International Edition*, Vol. 51, No. 22, pp. 5443–5446, 2012.  
[doi:10.1002/anie.201200878](https://doi.org/10.1002/anie.201200878)
- (4) **T. Saitoh**, M. Takeiri, Y. Gotoh, Y. Ishikawa, K. Umezawa, S. Nishiyama\*  
“Design and synthesis of biotinylated for direct identification of its target NF- $\kappa$ B components”  
*Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, Vol. 21, No. 21, pp. 6293–6296, 2011.  
[doi:10.1016/j.bmcl.2011.08.122](https://doi.org/10.1016/j.bmcl.2011.08.122)

- (3) C. Shimada, **T. Saitoh**, Y. Ishikawa, S. Nishiyama, K. Umezawa\*  
“Structure-activity relationship of NF-kappa B inhibitor DHMEQ and preparation of soluble analog”  
*INTERNATIONAL JOURNAL OF MOLECULAR MEDICINE*, Vol. 26, pp. S11, **2010**.
- (2) **T. Saitoh**, C. Shimada, M. Takeiri, M. Shiino, S. Ohba, R. Obata, Y. Ishikawa, K. Umezawa, S. Nishiyama\*  
“A new NF- $\kappa$ B inhibitor based on the amino-epoxyquinol core of DHMEQ”  
*Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, Vol. 20, No. 19, pp. 5638–5642, **2010**.  
[doi:10.1016/j.bmcl.2010.08.036](https://doi.org/10.1016/j.bmcl.2010.08.036)
- (1) **T. Saitoh**, E. Suzuki, A. Takasugi, R. Obata, Y. Ishikawa, K. Umezawa, S. Nishiyama\*  
“Efficient synthesis of ( $\pm$ )-parasitenone, a novel inhibitor of NF- $\kappa$ B”  
*Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, Vol. 19, No. 18, pp. 5383–5386, **2009**.  
[doi:10.1016/j.bmcl.2009.07.120](https://doi.org/10.1016/j.bmcl.2009.07.120)

## Reviews

- (7) **齊藤 毅**, 長瀬 博  
“睡眠覚醒を制御する世界初の分子：オレキシン2受容体作動薬 YNT-185 の創製”  
*和光純薬時報*, 第84巻, 第3号, **2016**.
- (6) **齊藤 毅**, 長瀬 博  
“低分子オレキシン受容体アゴニストの創製”  
*MEDCHEM NEWS*, 第26巻, 第7号, pp. 90–96, **2016**.  
[目次](#)
- (5) **齊藤 毅**, 西山 繁  
“超原子価ヨードベンゼンを活用した含窒素天然物の合成”  
*有機合成化学協会誌*, 第72巻, 第10号, pp. 1120–1130, **2014**.  
[doi:10.5059/yukigoseikyokaishi.72.1120](https://doi.org/10.5059/yukigoseikyokaishi.72.1120)
- (4) **齊藤 毅**  
“オレキシン受容体を標的とした不眠症治療薬の可能性”  
*ファルマシア*, 第50巻, 第1号, pp. 61, **2014**.
- (3) D. Kajiyama, **T. Saitoh**, S. Yamaguchi, S. Nishiyama  
“Application of the Hypervalent Iodine Oxidant Electrochemically Generated to Natural

Products Synthesis”  
*Electrochemistry, Vol. 81*, pp. 319-324, 2013.  
[doi:10.5796/electrochemistry.81.319](https://doi.org/10.5796/electrochemistry.81.319)

- (2) **齊藤 毅**, 角 武法, 西山 繁, 栄長 泰明  
“ダイヤモンド電極を用いた環境低負荷型電解反応”  
*NEW DIAMOND*, 第 28 巻, 第 4 号, pp. 20-23, 2012.  
[表紙](#)

- (1) **齊藤 毅**, 牧 昌次郎, 西山 繁  
「ホタル生物発光をモデルとした赤色発光基質の創製」  
*ケミカルバイオロジー*, 第 4 巻, 第 1 号, pp.3-6, 2011.

### Doctor Thesis

慶應義塾大学大学院理工学研究科 甲 第 3 6 6 4 号

題目：NF- $\kappa$ B 阻害剤 DHMEQ の作用機序解明に向けた化学的アプローチ

平成 2 4 年 3 月

主査：西山繁 慶應義塾大学理工学部化学科教授

### Invited Lectures

- (18) 「睡眠覚醒を制御するオレキシン 2 受容体作動薬の創製」  
慶應義塾大学薬学部講演会, 2016 年 12 月 14 日 (東京)
- (17) 「オレキシン 2 受容体作動薬 YNT-185 の創製」  
第 34 回メデイシナルケミストリーシンポジウム MCS サテライトセッション：次世代を担う  
研究者による「MCS 優秀賞」受賞講演, 2016 年 11 月 30 日 (つくば)
- (16) 「オレキシン 2 受容体作動薬 YNT-185 の開発」  
北里大学大学院特別講義 兼 北里セミナー, 2016 年 11 月 1 日 (東京)
- (15) 「低分子オレキシン受容体アゴニストの創製」  
第 60 回日本薬学会 関東支部大会, 2016 年 9 月 17 日 (東京)
- (14) オレキシン受容体アゴニストの創製と薬理作用の解明  
成人病の原因・病態の解明に関する研究助成 (TMFC) 第 22 回研究発表会、2016 年 7 月 2 日  
(大阪)
- (13) “Development of non-peptidic orexin receptor agonists for controlling sleep-wake cycles”  
ITbM-IGER Seminar, Nagoya, Japan, July 11, 2016.
- (12) “Cathodic reduction on boron-doped diamond electrodes”  
The 12th International Symposium on Organic Reactions (ISOR12), Kyoto, Japan, April 23,  
2016.

- (11) 「化学者、眠りを研究する」  
静岡大学大学院特別講義 兼 第1回グリーン科学技術研究所セミナー, 2016年4月15日(浜松) .
- (10) “Electrochemical reduction by means of boron-doped diamond electrode”  
Pacifichem 2015, Honoruru, USA, December 19, 2015.
- (9) 「境界領域を有機化学で切り開く」  
熊本大学大学院特別講義 兼 自然科学研究科 研究コア 「キラル分子生命科学」特別講演会, 2015年12月2日(熊本) .
- (8) 「ダイヤモンド電極を活用した有機電解合成」  
一般財団法人ニューダイヤモンドフォーラム平成26年第3回研究会, 2015年1月16日(東京).
- (7) “Anodic oxidation of opioid alkaloids for novel derivatization”  
Electrochemistry 2014; German-Japanese Meeting on Electrosynthesis, Mainz, Germany, September 2014.
- (6) 「化学で科学する」  
第9回有機電子移動化学若手の会, 2013年6月22日(岡山).
- (5) 「有機電解反応を活用した天然物合成(ダイアで拓くものづくり)」  
電気化学会第80回大会, 2013年3月30日(仙台).
- (4) “Chemical and biological study of bioluminescence”  
International Mini Symposium on Chemical Biology of Natural Products: Target ID and Regulation of Bioactivity, Yokohama, Japan, March 2013.
- (3) 「電気化学で出来ること」  
近畿大学セミナー, 近畿大学, 2012年11月10日(大阪).
- (2) 「電子と光子で何が出来るのか」  
若手研究者セミナー, 東京医科歯科大学, 2012年6月29日(東京).
- (1) The 1st German- Japanese Meeting on Electrosynthesis  
“The application of firefly bioluminescence, how to tune the emission color”  
Bonn, Germany, October 2010.

## Patents

- (6) 特願2016-074928  
「骨代謝調節用組成物」  
発明者：禹 濟泰、車 炳允、岩井 みどり、米澤 貴之、鄭 雄一、西山 繁、斉藤 毅  
出願人：中部大学  
出願日：2016年 4月 4日
- (5) 特願2015-212553  
「オレキシン1受容体拮抗薬」

発明者：長瀬 博、山本 直司、入鹿山 容子、斉藤 毅。

出願人：東レ株式会社

出願日：2015年10月29日

(4) 特願2015-119785

「スルホンアミド誘導体またはその薬学的に許容される酸付加塩」

発明者：長瀬 博、柳沢 正史、斉藤 毅、杳村 憲樹、入鹿山 容子。

出願人：筑波大学

出願日：2015年 6月12日

(3) 特願2015-031041 (PCT/JP2016/054700)

「スルホンアミド誘導体またはその薬学的に許容される酸付加塩」

発明者：柳沢 正史、長瀬 博、入鹿山 容子、斉藤 毅。

出願人：筑波大学

出願日：2014年12月 3日

(2) 特願2012-265382

「環化化合物の製造方法、及び、環化化合物を有する溶液の発光方法」

発明者：斉藤 毅、西山 繁、井岡 秀二、牧 昌次郎、丹羽 治樹。

出願人：慶應義塾大学

出願日：2012年12月 4日

(1) 特願2011-182224 (PCT/JP2012/027770, WO2013/02770)

「ルシフェラーゼの発光基質」

発明者：西山 繁、斉藤 毅、牧 昌次郎、丹羽 治樹。

出願人：電気通信大学

出願日：2011年 8月24日

## Awards

(10) 2017年 筑波大学 若手研究奨励賞

(9) 2016年 日本化学会第96回春季年会 優秀講演賞

(8) 2016年 日本応用酵素協会 若手研究助成

(7) 2015年 日本薬学会医薬化学部会 メディシナルケミストリーシンポジウム優秀賞

(6) 2014年 公益財団法人倉田記念日立科学技術財団 倉田奨励金

(5) 2013年 電気化学会有機電気化学研究会 有機電気化学奨励賞

(5) 2011年 公益財団法人日本科学協会 笹川科学研究助成

(4) 2011年 慶應義塾大学 藤原賞

(3) 2010年 日本ケミカルバイオロジー学会 第5回年会ポスター賞

- (2) 2009年 新規素材探索研究会 第8回セミナー最優秀ポスター賞
- (1) 2008年 慶應義塾大学 小泉信三記念大学院特別奨学金

## Research Funds

- (11) 課題名：オレキシン受容体アゴニストの創出と薬理作用の解明  
研究期間：2016年4月－2017年3月  
研究代表者：齊藤毅  
助成団体/助成名：公益財団法人日本応用酵素協会/成人病の病因・病態の解明に関する研究  
助成
  
- (10) 課題名：新規オレキシンリガンドの創出と薬理作用の解明  
研究期間：2016年4月－2018年3月  
研究代表者：長瀬博（分担者：齊藤毅）  
助成団体/助成名：日本学術振興会/科学研究費 基盤研究(B)
  
- (9) 課題名：ダイヤモンド電極の物質科学と応用展開  
研究期間：2015年4月－2018年3月  
研究代表者：栄長泰明（研究分担者：齊藤毅）  
助成団体/助成名：独立行政法人科学技術振興機構/戦略的創造研究推進事業（ACCEL）
  
- (8) 課題名：光により睡眠・摂食を制御する分子ツールの開発  
研究期間：2015年4月－2018年3月  
研究代表者：齊藤毅  
助成団体/助成名：日本学術振興会/若手研究(B)
  
- (7) 課題名：革新的環境改善材料としての導電性ダイヤモンドの機能開発  
研究期間：2014年4月－2016年3月  
研究代表者：栄長泰明（研究分担者：齊藤毅）  
助成団体/助成名：独立行政法人科学技術振興機構/戦略的創造研究推進事業（CREST）
  
- (6) 課題名：安定かつ多色発光するホタルルシフェリンアナログの開発  
研究期間：2014年4月－2015年3月  
研究代表者：齊藤毅  
助成団体/助成名：公益社団法人倉田記念日立科学技術財団/倉田奨励金
  
- (5) 課題名：骨粗鬆症治療効果を有する新規化合物の創製とその作用機序解明  
研究期間：2012年4月－2013年3月  
研究代表者：齊藤毅



助成団体/助成名：財団法人天野工業技術研究所/財団法人天野工業技術研究所助成金

- (4) 課題名：レアメタルフリーな有機合成による新規生物活性物質の創製  
研究期間：2012年4月－2013年3月  
研究代表者：斉藤毅  
助成団体/助成名：慶應義塾大学/慶應義塾学事振興資金
- (3) 課題名：腹腔内転移のバイオイメージングと抑制物質の分子デザイン  
研究期間：2011年4月－2013年3月  
研究代表者：梅沢一夫（分担者：斉藤毅）  
助成団体/助成名：日本学術振興会/科学研究費 基盤研究(B)
- (2) 課題名：レアメタルフリーな有機合成による新規生物活性物質の創製  
研究期間：2011年4月－2012年3月  
研究代表者：斉藤毅  
助成団体/助成名：慶應義塾大学/慶應義塾学事振興資金
- (1) 課題名：ホタル生物発光をモデルとした近赤外発光基質の創製  
研究期間：2011年4月－2012年3月  
研究代表者：斉藤毅  
助成団体/助成名：財団法人日本科学協会/笹川科学研究助成