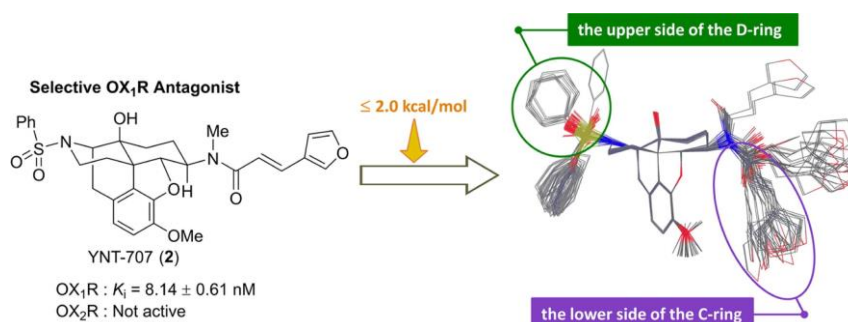


Original Publications

- (3) Naoshi Yamamoto, Sayaka Ohruai, Takahiro Okada, **Masahiro Yata**, Tsuyoshi Saitoh, Noriki Kutsumura, Yasuyuki Nagumo, Yoko Irukayama-Tomobe, Yasuhiro Ogawa, Yukiko Ishikawa, Yurie Watanabe, Daichi Hayakawa, Hiroaki Gouda, Masashi Yanagisawa and Hiroshi Nagase.

“Essential structure of orexin 1 receptor antagonist YNT-707, Part I: Role of the 4,5-epoxy ring for binding with orexin 1 receptor”

Bioorg. Med. Chem. Lett. **2017**, *27*, 4176-4179.

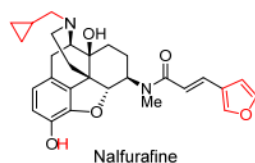


- (2) Hiroshi Nagase, Naoshi Yamamoto, **Masahiro Yata**, Sayaka Ohruai, Takahiro Okada, Tsuyoshi Saitoh, Noriki Kutsumura, Yasuyuki Nagumo, Yoko Irukayama-Tomobe, Yukiko Ishikawa, Yasuhiro Ogawa, Shigeto Hirayama, Daisuke Kuroda, Yurie Watanabe, Hiroaki Gouda, and Masashi Yanagisawa.

“Design and Synthesis of Potent and Highly Selective Orexin 1 Receptor Antagonists with a Morphinan Skeleton and Their Pharmacologies”

J. Med. Chem. **2017**, *60*, 1018-1040.

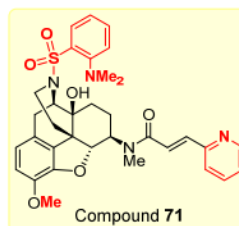
**κ Opioid Receptor Agonist
with orexin 1 receptor antagonistic activity**



OX₁R: $K_i = 250 \text{ nM}$
OX₂R: Not active
MOR: $K_i = 5.99 \text{ nM}$
DOR: $K_i = 693 \text{ nM}$
KOR: $K_i = 0.238 \text{ nM}$

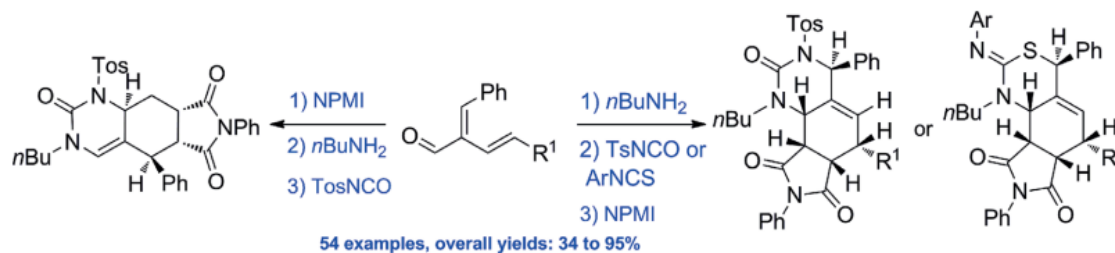


Selective Orexin 1 Receptor Antagonist



OX₁R: $K_i = 1.36 \text{ nM}$
OX₂R: Not active
MOR: $K_i = >1,000 \text{ nM}$
DOR: $K_i = >1,000 \text{ nM}$
KOR: $K_i = >1,000 \text{ nM}$

- (1) Satoru Kobayashi, Kenji Kudo, Ai Ito, Takuya Honjo, **Masahiro Yata**, Takashi Otani, Noriki Kutsumura, Takao Saito, Fabienne Berrée, Elise Romain, Fabien Tripoteau, and Bertrand Carboni. “[3]-1-Azadendralenes as Versatile Building Blocks for the Stereoselective Synthesis of Polysubstituted Hexahydroquinazolin-2-ones and Hexahydrobenzothiazine-2-imines”
Eur. J. Org. Chem. **2015**, 4367-4373



Review

- (1) 南雲康之、**谷田誠造**、山本直司、長瀬博
「新規オピオイド受容体作動薬の開発：副作用の分離を目指した新規選択的 κ 受容体作動薬の設計と合成」
Pain Clinics, Vol. 38 (2017.4), spring supplement, S211-S218.

National Presentations

- (9) **Masahiro Yata**, Naoshi Yamamoto, Yasuyuki Nagumo, Hiroshi Nagase. “Design and synthesis of novel κ opioid receptor agonists without both sedation and aversion” Tsukuba Global Science Week Interdisciplinary Work Shop on Science and Patents 2017, September, Tsukuba International Congress Center, Tsukuba, Japan, IWP-042.
- (8) **谷田誠造**、山本直司、南雲康行、長瀬博；“鎮静作用を分離したナルフラフィンの設計・合成”；第 37 回鎮痛薬・オピオイドペプチドシンポジウム (2017 年 9 月, 東京慈恵会医科大学)、口頭発表 一般演題 6.
- (7) **Masahiro Yata**, Naoshi Yamamoto, Yasuyuki Nagumo, Hiroshi Nagase. “Design and synthesis of novel κ opioid receptor agonists isolating both sedation and aversion” International Narcotics Research Conference 2017, July, Hyatt Centric Magnificent Mile, Chicago, USA, Poster 123.
- (6) **谷田誠造**、山本直司、南雲康行、長瀬博；“ナルフラフィンの活性立体配座の固定による鎮静作用の分離”；第 34 回メディシナルケミストリーシンポジウム (2016 年 11 月, つくば国際会議場)、ポスター発表 1P-22.

- (5) 大類彩、山本直司、谷田誠造、岡田卓大、斉藤毅、沓村憲樹、南雲康行、入鹿山容子、石川有紀子、小川靖裕、平山重人、柳沢正史、長瀬博；“モルヒナン骨格を有するオレキシン 1 受容体選択的拮抗薬の設計・合成とその薬理作用”；第 34 回メディシナルケミストリーシンポジウム (2016 年 11 月、つくば国際会議場)、ポスター発表 1P-23.
- (4) 大類彩、山本直司、谷田誠造、岡田卓大、斉藤毅、沓村憲樹、南雲康行、入鹿山容子、石川有紀子、小川靖裕、柳沢正史、長瀬博；“モルヒナン骨格を有する新規オレキシン 1 受容体選択的拮抗薬の設計・合成①”；第 60 回日本薬学会 関東支部大会 (2016 年 9 月、東京大学大学院薬学研究科)、口頭発表 一般演題 C-16.
- (3) 岡田卓大、山本直司、谷田誠造、大類彩、斉藤毅、沓村憲樹、南雲康行、入鹿山容子、石川有紀子、小川靖裕、柳沢正史、長瀬博；“モルヒナン骨格を有する新規オレキシン 1 受容体選択的拮抗薬の設計・合成②”；第 60 回日本薬学会 関東支部大会 (2016 年 9 月、東京大学大学院薬学研究科)、口頭発表 一般演題 C-17.
- (9) 谷田誠造、山本直司、南雲康行、長瀬博；“新規ビシクロ[2.2.2]オクテン骨格を有する κ 受容体選択的作動薬の合成と薬理評価”；第 36 回鎮痛薬・オピオイドペプチドシンポジウム (2016 年 8 月、北海道大学薬学部)、口頭・ポスター発表 一般演題 14.
- (1) Naoshi Yamamoto, Masahiro Yata, Sayaka Ohru, Takahiro Okada, Tsuyoshi Saitoh, Noriki Kutsumura, Yasuyuki Nagumo Yoko Irukayama-Tomobe, Yukiko Ishikawa, Yasuhiro Ogawa, Daisuke Kuroda, Hiroaki Gouda, Masashi Yanagisawa. “Synthesis of Novel, Potent and Highly Selective Orexin 1 Receptor Antagonists with a Morphinan Skeleton” The 25th French-Japanese Symposium on Medicinal and Fine Chemistry 2016, May, Keio Plaza Hotel Tama, Tokyo, Japan.

Award

- (1) Tsukuba Global Science Week Interdisciplinary Work Shop on Science and Patents 2017
“Design and synthesis of novel κ opioid receptor agonists without both sedation and aversion”
Excellent Poster Award