

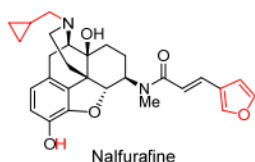
Original Publications

- (2) Hiroshi Nagase, Naoshi Yamamoto, **Masahiro Yata**, Sayaka Ohru, 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.

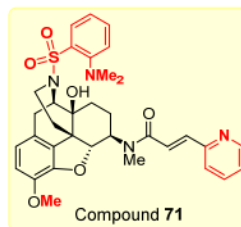
κ Opioid Receptor Agonist
with orexin 1 receptor antagonistic activity



OX₁R: K_i = 250 nM
OX₂R: Not active
MOR: K_i = 5.99 nM
DOR: K_i = 693 nM
KOR: K_i = 0.238 nM



Selective Orexin 1 Receptor Antagonist

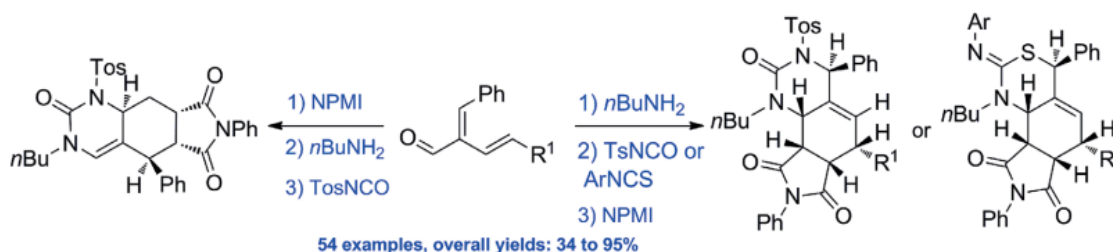


OX₁R: K_i = 1.36 nM
OX₂R: Not active
MOR: K_i = >1,000 nM
DOR: K_i = >1,000 nM
KOR: K_i = >1,000 nM

- (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、**谷田誠浩**、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 Clinic, Vol. 38 (2017.4), spring supplement, S211-S218.

National Presentations

- (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.
- (2) 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 Ohroi, 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.