

土居久志 経歴と業績 (2021年9月21日付)

略歴:

1971年	生まれ (大阪)
1993年	京都工芸繊維大学工芸学部卒業 (奥沢教授)
2000年	名古屋大学大学院理学研究科博士課程修了 (野依良治教授)
同年11月	学位取得 (博士 (理学))
2001年	スウェーデン・ウプサラ大学 PET センター留学 (Bengt Långström 教授)
2003年	岐阜大学大学院医学系研究科 学術創成研究・特定研究補佐員 (鈴木正昭教授)
2005年	理化学研究所入所 分子イメージング研究プログラム準備室・室員
2005年9月	分子イメージング研究プログラム 分子プローブ設計創薬研究チーム・研究員
2007年5月	同プログラム 分子プローブ設計創薬研究チーム・副チームリーダー
2008年10月	(改組後の) 分子イメージング科学研究センター 創薬合成化学研究ユニット・ユニットリーダー
2009年4月	同センター 分子イメージング標識化学研究チーム・チームリーダー
2013年4月	(改組後の) ライフサイエンス技術基盤研究センター 標識化学研究チーム・チームリーダー
2018年4月	(改組後の) 生命機能科学研究センター 標識化学研究チーム・チームリーダー

授賞:

第44回 (2007年度) エルヴィン・フォン・ベルツ賞 1等賞受賞, 渡辺恭良、鈴木正昭、尾上浩隆、土居久志、和田康弘、片岡洋祐、榎本秀一の7名の共同受賞

所属学会:

日本化学会、有機合成化学協会、近畿化学協会、
日本分子イメージング学会、日本ケミカルバイオロジー学会

その他:

- ・ 第1種放射線取扱主任者
- ・ 日本分子イメージング学会 編集委員 (2017年6月～現在)
- ・ 日本分子イメージング学会 理事 (2021年5月～2025年5月予定)
- ・ 科学技術振興機構 創発的研究支援事業 創発的研究支援事業アドバイザー [水島班; 創発プログラムオフィサー水島昇] (2021年3月～現在)
- ・ 大阪市立大学大学院医学研究科:客員教授 (2010年度～2018年度)

- 岐阜大学大学院連合創薬医療情報研究科：客員准教授（2011年度～2017年度）、客員教授（2018年度～現在）
- 浜松医科大学：客員准教授（2007年度～2009年度）、客員教授（2010年度～2014年度）
- 岡山大学大学院医歯薬学総合研究科：客員教授（2011年度～2014年度）
- 徳島大学大学院医科学教育部：客員教授（2016年度～現在）
- 名古屋大学大学院理学研究科：客員教授（2019年度～現在）
- 東京医科歯科大学：非常勤講師（2018年度～現在）

業績リスト (Publications)

【原著論文, Original Article】

- (1) Takatani, S., Tahara, T., Tsuji, M., Ozaki, D., Shibata, N., Hashizume, Y., Suzuki, M., Onoe, H., Watanabe, Y., Doi, H., “Synthesis of L-[5-¹¹C]Leucine and L- α -[5-¹¹C]Methylleucine via Pd⁰-mediated ¹¹C-Methylation and Microfluidic Hydrogenation: Potentiality of Leucine PET Probes for Tumor Imaging”, *ChemMedChem*, 2021, in press. (doi: 10.1002/cmdc.202100255) **This paper won Very Important Paper (VIP) designation and was selected as the front cover of the journal. Additionally, this paper was introduced as a news article in a chemistry magazine *ChemistryViews*.**
- (2) Doi, H., Goto, M., Sato, Y., “Pd⁰-Mediated Cross-Coupling of [¹¹C]Methyl Iodide with Carboxysilane for Synthesis of [¹¹C]Acetic Acid and Its Active Esters: ¹¹C-Acetylation of Small, Medium, and Large Molecules”, *Eur. J. Org. Chem.*, 3970–3979, (2021). (doi: 10.1002/ejoc.202100638) **This paper was selected as the front cover of the journal.**
- (3) Watanabe, Y., Mawatari, A., Aita, K., Sato, Y., Wada, Y., Nakaoka, T., Onoe, K., Yamano, E., Akamatsu, G., Ohnishi, A., Shimizu, K., Sasaki, M., Doi, H., Senda, M., “PET imaging of ¹¹C-labeled thiamine tetrahydrofurfuryl disulfide, vitamin B₁ derivative: First-in-human study”, *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, **555**, 7–12 (2021). (doi: 10.1016/j.bbrc.2021.03.119)
- (4) Nozaki, S., Nakatani, Y., Mawatari, A., Shibata, N., Hume, W. E., Hayashinaka, E., Wada, Y., Doi, H., Watanabe, Y., “¹⁸F-FIMP: a LAT1-specific PET probe for discrimination between tumor tissue and inflammation”, *Sci. Rep.* **9**, 15718 (2019). (doi: 10.1038/s41598-019-52270-x)
- (5) Takeuchi, J., Kikukawa, T., Saito, H., Hasegawa, I., Takeda, A., Hatsuta, H., Kawabe, J., Wada, Y., Mawatari, A., Iglesaka, A., Doi, H., Watanabe, Y., Shimada, H., Kitamura, S., Higuchi, M., Suhara, T., Itoh, Y., “Amyloid-Negative Dementia in the Elderly is Associated with High Accumulation of Tau in the Temporal Lobes”, *Open Biomed. Eng. J.* **13**, 55–66 (2019). (doi: 10.2174/1874120701913010055)
- (6) Watanabe, K., Nozaki, S., Goto, M., Kaneko, K., Hayashinaka, E., Irie, S., Nishiyama, A., Kasai, K., Fujii, K., Wada, Y., Mizuno, K., Mizuseki, K., Doi, H., Watanabe, Y., “PET imaging of ¹¹C-labeled coenzyme Q₁₀: Comparison of biodistribution between [¹¹C]ubiquinol-10 and [¹¹C]ubiquinone-10”, *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, **512**, 611–615 (2019). (doi: 10.1016/j.bbrc.2019.03.073)
- (7) Ose, T., Autio, J. A., Ohno, M., Nishigori, K., Tanki, N., Iglesaka, A., Mori, T., Doi, H., Wada, Y., Nakajima, I., Watabe, H., Hayashi, T., “A novel tungsten-based fiducial marker for multi-model brain imaging”, *J. Neurosci. Methods* **323**, 22–31 (2019). (doi: 10.1016/j.jneumeth.2019.04.014)

- (8) Goto, M., Nishiyama, A., Yamaguchi, T., Watanabe, K., Fujii, K., Watanabe, Y., Doi, H., "Synthesis of ^{11}C -labeled ubiquinone and ubiquinol via Pd 0 -mediated rapid C-[^{11}C]methylation using [^{11}C]methyl iodide and 39-demethyl-39-(pinacolboryl)ubiquinone", *J. Labelled Compd. Radiopharm.* **62**, 86–94 (2019). (doi: 10.1002/jlcr.3700) **This research was adopted as the cover image and recognized as the top 10% most downloaded papers 2018–2019 in the journal.**
- (9) Takahashi, K., Hosoya, T., Onoe, K., Takashima, T., Tanaka, M., Ishii, A., Nakatomi, Y., Tazawa, S., Takahashi, K., Doi, H., Wada, Y., Watanabe, Y., "Association between aromatase in human brains and personality traits", *Sci. Rep.* **8**, 16841 (2018). (doi: 10.1038/s41598-018-35065-4)
- (10) Nozaki, S., Mawatari, A., Nakatani, Y., Hayashinaka, E., Wada, Y., Nomura, Y., Kitayoshi, T., Akimoto, K., Ninomiya, S., Doi, H., Watanabe, Y., "PET Imaging Analysis of Vitamin B₁ Kinetics with [^{11}C]Thiamine and its Derivative [^{11}C]Thiamine Tetrahydrofurfuryl Disulfide in Rats", *Mol. Imaging Biol.* **20**, 1001–1007 (2018). (doi: 10.1007/s11307-018-1186-y)
- (11) Doi, H., Kida, T., Nishino, K., Nakatsuji, M., Sakamoto, S., Shimizu, S., Teraoka, Y., Tamura, Y., Kataoka, Y., Inui, T., "Solubility-Improved 10-O-Substituted SN-38 Derivatives with Antitumor Activity", *ChemMedChem* **12**, 1715–1722 (2017). (doi: 10.1002/cmdc.201700454)
- (12) Morizane, A., Kikuchi, T., Hayashi, T., Mizuma, H., Takara, S., Doi, H., Mawatari, A., Glasser, M. F., Shiina, T., Ishigaki, H., Itoh, Y., Okita, K., Yamasaki, E., Doi, D., Onoe, H., Ogasawara, K., Yamanaka, S., Takahashi, J., "MHC matching improves engraftment of iPSC-derived neurons in non-human primates", *Nat. Commun.* **8**:385 (2017). (doi: 10.1038/s41467-017-00926-5)
- (13) Nozaki, S., Ozaki, N., Suzuki, S., Goto, M., Mawatari, A., Nakatani, Y., Hayashinaka, E., Doi, H., Wada, Y., Watanabe, Y., "Development of diagnostic techniques for early rheumatoid arthritis using positron emission tomography with [^{11}C]PK11195 and [^{11}C]ketoprofen tracers", *Mol. Imaging Biol.* **19**, 746–753 (2017). (doi: 10.1007/s11307-016-1039-5)
- (14) Yokoyama, C., Mawatari, A., Kawasaki, A., Takeda, C., Onoe, K., Doi, H., Newman-Tancredi, A., Zimmer, L., Onoe, H., "Marmoset serotonin 5-HT_{1A} receptor mapping with a biased agonist PET probe ^{18}F -F13714: comparison with an antagonist tracer ^{18}F -MPPF in awake and anaesthetized state", *Int. J. Neuropsychopharmacol.* **19**(12), 1–12 (2016). (doi: 10.1093/ijnp/pyw079)
- (15) Doi, H., Sato, K., Shindou, H., Sumi, K., Koyama, H., Hosoya, T., Watanabe, Y., Ishii, S., Tsukada, H., Nakanishi, K., Suzuki, M., "Blood-Brain Barrier Permeability of Ginkgolide: Comparison of the Behavior of PET Probes 7 α -[^{18}F]Fluoro- and 10-O-*p*-[^{11}C]Methylbenzyl Ginkgolide B in Monkey and Rat Brains", *Bioorg. Med. Chem.* **24**, 5148–5157 (2016). (doi: 10.1016/j.bmc.2016.08.032)
- (16) Ohnishi, A., Senda, M., Yamane, T., Mikami, T., Nishida, H., Nishio, T., Akamatsu, G., Ikari, Y., Kimoto, S., Aita, K., Sasaki, M., Shinkawa, H., Yamato, Y., Shukuri, M., Mawatari, A., Doi, H., Watanabe, Y., Onoe, H., "Exploratory human PET study of the effectiveness of ^{11}C -ketoprofen methyl ester, a potential biomarker of neuroinflammatory processes in Alzheimer's disease", *Nucl. Med. Biol.* **43**, 438–444 (2016). (doi: 10.1016/j.nucmedbio.2016.04.005)
- (17) Shukuri, M., Mawatari, A., Ohno, M., Suzuki, M., Doi, H., Watanabe, Y., Onoe, H., "Detection of cyclooxygenase-1 in activated microglia during amyloid plaque progression: PET studies in Alzheimer's disease model mice", *J. Nucl. Med.* **57**, 291–296 (2016). (doi: 10.2967/jnumed.115.166116)
- (18) Tahara, T., Zhang, Z., Ohno, M., Hosaka, N., Hirao, Y., Suzuki, M., Doi, H., Onoe, H., "A novel ^{11}C -labeled thymidine analog, [^{11}C]AZT, for tumor imaging by positron emission tomography", *EJNMMI Research* **5**:45 (2015). (doi: 10.1186/s13550-015-0124-0)
- (19) Doi, H., Mawatari, A., Kanazawa, M., Nozaki, S., Nomura, Y., Kitayoshi, T., Akimoto, K., Suzuki,

- M., Ninomiya, S., Watanabe, Y., "Synthesis of ^{11}C -Labeled Thiamine and Fursultiamine for In Vivo Molecular Imaging of Vitamin B₁ and Its Prodrug Using Positron Emission Tomography", *J. Org. Chem.* **80**, 6250–6258 (2015). (doi: 10.1021/acs.joc.5b00685)
- (20) Goto, M., Mizuma, H., Wada, Y., Suzuki, M., Watanabe, Y., Onoe, H., Doi, H., " ^{11}C -Labeled Capsaicin and Its In Vivo Molecular Imaging in Rats by Positron Emission Tomography", *Food and Nutrition Sciences* **6**, 216–220 (2015). (doi: 10.4236/fns.2015.62022)
- (21) Han, C., Doi, H., Kimura, J., Nakao, Y., Suzuki, M., " ^{11}C -Labeling of the C(1)-C(10) Dihydroxy Acid Moiety for the Study on the Synthesis of Kulokekahilide-2 PET Tracer", *Int. J. Org. Chem.* **4**, 269–277 (2014). (doi: 10.4236/ijoc.2014.44029)
- (22) Zhang, Z., Doi, H., Koyama, H., Watanabe, Y., Suzuki, M., "Efficient synthesis of [^{11}C]zidovudine and its analogs by convenient one-pot palladium(0)-copper(I) co-mediated rapid C-[^{11}C]methylation", *J. Label. Compd. Radiopharm.* **57**, 540–549 (2014). (doi: 10.1002/jlcr.3213)
- (23) Suzuki, M., Takashima-Hirano, M., Ishii, H., Watanabe, C., Sumi, K., Koyama, H., Doi, H., "Synthesis of ^{11}C -labeled retinoic acid, [^{11}C]ATRA, via an alkenylboron precursor by Pd(0)-mediated rapid C-[^{11}C]methylation", *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **24**, 3622–3625 (2014). (doi: 10.1016/j.bmcl.2014.05.041)
- (24) Ohnishi, A., Senda, M., Yamane, T., Sasaki, M., Nishio, T., Mikami, T., Ikari, Y., Nishida, H., Shukuri, M., Takashima, T., Mawatari, A., Doi, H., Watanabe, Y., Onoe, H., "Human whole-body biodistribution and dosimetry of a new PET tracer, [^{11}C]ketoprofen methyl ester, for imagings of neuroinflammation", *Nucl. Med. Biol.* **41**, 594–599 (2014). (doi: 10.1016/j.nucmedbio.2014.04.008)
- (25) Mukai, H., Ozaki, D., Cui, Y., Kuboyama, T., Yamato-Nagata, H., Onoe, K., Takahashi, M., Wada, Y., Imanishi, T., Kodama, T., Obika, S., Suzuki, M., Doi, H., Watanabe, Y., "Quantitative evaluation of the improvement in the pharmacokinetics of a nucleic acid drug delivery system by dynamic PET imaging with ^{18}F -incorporated oligodeoxynucleotides", *J. Control. Release.* **180**, 92–99 (2014). (doi: 10.1016/j.jconrel.2014.02.014)
- (26) Yamanaka, H., Yokoyama, C., Mizuma, H., Kurai, S., Finnema, S.J., Halldin, C., Doi, H., Onoe, H., "A possible mechanism of the nucleus accumbens and ventral pallidum 5 HT1B receptors underlying the antidepressant action of ketamine: a PET study with macaques", *Transl. Psychiatry* **4**, e342 (2014). (doi: 10.1038/tp.2013.112)
- (27) Takahashi, K., Hosoya, T., Onoe, K., Doi, H., Nagata, H., Hiramatsu, T., Li, X., Watanabe, Y., Wada, Y., Takashima, T., Suzuki, M., Onoe, H., Watanabe, Y., "[^{11}C]Cetrozole: an improved C-[^{11}C]methylated PET probe for aromataseimaging in the brain", *J. Nucl. Med.*, **55**, 852–857 (2014).
- (28) Koyama, H., Doi, H., Suzuki, M., "Evaluation of TlOH Effect for Pd⁰-Mediated Cross-Coupling of Methyl Iodide and Excess Boronic Acid Ester Toward Fabrication of [^{11}C]CH₃-Incorporated PET Tracer", *Int. J. Org. Chem.*, **3**, 220–223 (2013).
- (29) Kimura, T., Sako, T., Siqin, Hosokawa-Muto, J., Cui, Y., Wada, Y., Kataoka, Y., Doi, H., Sakaguchi, S., Suzuki, M., Watanabe, Y., Kuwata, K., "Synthesis of ^{11}C -Labeled Antiprion GN8 Derivative and Evaluation of Its Brain Uptake by Positron Emission Tomography", *ChemMedChem*, **8**, 1035–1039 (2013). (doi: 10.1002/cmdc.201300167)
- (30) Takashima, T., Shingaki, T., Katayama, Y., Hayashinaka, E., Wada, Y., Kataoka, M., Ozaki, D., Doi, H., Suzuki, M., Ishida, S., Hatanaka, K., Sugiyama, Y., Akai, S., Oku, N., Yamashita, S., Watanabe, Y., "Dynamic Analysis of Fluid Distribution in the Gastrointestinal Tract in Rats: PET Imaging after Oral Administration of Non-absorbable Marker, [^{18}F]Deoxyfluoropoly(ethylene glycol)", *Mol.*

Pharmaceutics, **10**(6), 2261–2269 (2013).

- (31) Koyama, H., Zhang, Z., Ijuin, R., Siqin, Son, J., Hatta, Y., Ohta, M., Wakao, M., Hosoya, T., Doi, H., Suzuki, M., “Pd⁰-mediated rapid coupling of methyl iodide with excess amounts of benzyl- and cinnamylboronic acid esters: efficient method for incorporation of positron-emitting ¹¹C radionuclide into organic frameworks by coupling between two sp³-hybridized carbons”, *RSC Advances*, **3**, 9391–9401 (2013).
- (32) Miyazaki, S., Minami, T., Mizuma, H., Kanazawa, M., Doi, H., Matsumura, S., Lu, J., Onoe, H., Furuta, K., Suzuki, M., Ito, S., “The action site of the synthetic kainoid (2S,3R,4R)-3-carboxymethyl-4-(4-methylphenylthio)pyrrolidine-2-carboxylic acid (PSPA-4), an analogue of Japanese mushroom poison acromelic acid, for allodynia (tactile pain)”, *Eur. J. Pharmacol.*, **710**, 120–127 (2013). (doi: 10.1016/j.ejphar.2012.10.023)
- (33) Nakazawa, S., Yokoyama, C., Nishimura, N., Horisawa, T., Kawasaki, A., Mizuma, H., Doi, H., Onoe, H., “Evaluation of dopamine D₂/D₃ and serotonin 5-HT_{2A} receptor occupancy for a novel antipsychotic, lurasidone, in conscious common marmosets using small-animal positron emission tomography”, *Psychopharmacology* **225**, 329–339 (2013). (doi: 10.1007/s00213-012-2815-9)
- (34) Doi, H., Goto, M., Suzuki, M., “Pd⁰-Mediated Rapid C-[¹⁸F]Fluoromethylation by the Cross-Coupling Reaction of a [¹⁸F]Fluoromethyl Halide with an Arylboronic Acid Ester: Novel Method for the Synthesis of a ¹⁸F-Labeled Molecular Probe for Positron Emission Tomography”, *Bull. Chem. Soc. Jpn.* **85**, 1233–1238 (2012). (doi:10.1246/bcsj.20120151)
- (35) Takashima, T., Kitamura, S., Wada, Y., Tanaka, M., Shigihara, Y., Ishii, H., Ijuin, R., Shiomi, S., Nakae, T., Watanabe, Yu., Cui Y., Doi, H., Suzuki, M., Maeda, K., Kusuvara, H., Sugiyama, Y., Watanabe, Y., “PET imaging-based evaluation of hepatobiliary transport in human using 15R-[¹¹C]TIC-Me”, *J. Nucl. Med.* **53**, 741–748 (2012).
- (36) Kawasaki, T., Marumo, T., Shirakami, K., Mori, T., Doi, H., Suzuki, M., Watanabe, Y., Chaki, S., Nakazato, A., Ago, Y., Hashimoto, H., Matsuda, T., Baba, A., Onoe H., “Increase of 20-HETE synthase after brain ischemia in rats revealed by PET study with ¹¹C-labeled 20-HETE synthase-specific inhibitor”, *J. Cereb. Blood Flow Metab.*, **32**, 1737–1746 (2012).
- (37) Suzuki, M., Takashima-Hirano, M., Koyama, H., Yamaoka, T., Sumi, K., Nagata, H., Hidaka, H., Doi, H., “Efficient synthesis of [¹¹C]H-1152, a PET probe specific for Rho-kinases, highly potential targets in diagnostic medicine and drug development”, *Tetrahedron* **68**, 2336–2341 (2012). (doi: 10.1016/j.tet.2012.01.033)
- (38) Yashio, K., Katayama, Y., Takashima, T., Ishiguro N., Doi, H., Suzuki, M., Wada, Y., Tamai, I., Watanabe, Y., “Synthesis of [¹¹C]uric acid, using [¹¹C]phosgene, as a possible biomarker in PET imaging for diagnosis of gout”, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **22**, 115–119 (2012).
- (39) Shukuri, M., Takashima-Hirano, M., Tokuda, K., Takashima, T., Matsumura, K., Inoue, O., Doi, H., Suzuki, M., Watanabe, Y., Onoe, H., “In Vivo Expression of Cyclooxygenase-1 in Activated Microglia and Macrophages During Neuroinflammation Visualized by PET with ¹¹C-Ketoprofen Methyl Ester”, *J. Nucl. Med.*, **52**(7), 1094–1101 (2011).
- (40) Takashima-Hirano, M., Tazawa, S., Takahashi, K., Doi, H., Suzuki, M., “Efficient Synthesis of [¹¹C]Ramelteon as a Positron Emission Tomography Probe for Imaging Melatonin Receptors Involved in Circadian Rhythms”, *Chem. Pharm. Bull.*, **59**(8), 1062–1064 (2011).
- (41) Takahashi, K., Onoe, K., Doi, H., Nagata, H., Yamagishi, G., Hosoya, T., Tamura, Y., Wada, Y., Yamanaka, H., Yokoyama, C., Mizuma, H., Takashima, T., Bergström, M., Onoe, H., Långström, B., Watanabe, Y., “Increase in hypothalamic aromatase in macaque monkeys treated with

- anabolic-androgenic steroids: PET study with [¹¹C]vorozole”, *NeuroReport*, **22**, 326–330 (2011).
- (42) Takashima-Hirano, M., Takashima, T., Katayama, Y., Wada, Y., Sugiyama, Y., Watanabe, Y., Doi, H., Suzuki, M., “Efficient sequential synthesis of PET Probes of the COX-2 inhibitor [¹¹C]celecoxib and its major metabolite [¹¹C]SC-62807 and in vivo PET evaluation”, *Bioorg. Med. Chem.*, **19**, 2997–3004 (2011).
- (43) Koyama, H., Siqin, Zhang, Z., Sumi, K., Hatta, Y., Nagata, H., Doi, H., Suzuki, M., “Highly efficient syntheses of [methyl-¹¹C]thymidine and its analogue 4’-[methyl-¹¹C]thiothymidine as nucleoside PET probes for cancer cell proliferation by Pd⁰-mediated rapid C-[¹¹C]methylation” *Org. Biomol. Chem.*, **9**, 4287–4294 (2011).
- (44) Kanazawa, M., Furuta, K., Doi, H., Mori, T., Minami, T., Ito, S., Suzuki, M., “Synthesis of an acromelic acid A analog-based ¹¹C-labeled PET tracer for exploration of the site of action of acromelic acid A in allodynia induction”, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **21**, 2017–2020 (2011).
- (45) Takashima, T., Yokoyama, C., Mizuma, H., Yamanaka, H., Wada, Y., Onoe, K., Nagata, H., Tazawa, S., Doi, H., Takahashi, K., Morita, M., Kanai, M., Shibasaki, M., Kusuhara, H., Sugiyama, Y., Onoe, H., Watanabe, Y., “Developmental Changes in P-Glycoprotein Function in the Blood-Brain Barrier of Nonhuman Primates: PET Study with R-¹¹C-Verapamil and ¹¹C-Oseltamivir”, *J. Nucl. Med.* **52**, 950–957 (2011).
- (46) Ozawa, M., Takahashi, K., Akazawa, K., Takashima, T., Nagata, H., Doi, H., Hosoya, T., Wada, Y., Cui, Y., Kataoka, Y., Watanabe, Y., “PET of Aromatase in Gastric Parietal Cells Using ¹¹C-Vorozole”, *J. Nucl. Med.* **52**, 1964–1969 (2011).
- (47) Takahashi, K., Yamagishi, G., Hiramatsu, T., Hosoya, A., Onoe, K., Doi, H., Nagata, H., Wada, Y., Onoe, H., Watanabe, Y., Hosoya, T., “Practical synthesis of precuesor of [N-methyl-¹¹C]vorozole, an efficient PET tracer targeting aromatase in the brain”, *Bioorg. Med. Chem.*, **19**, 1464–1470 (2011).
- (48) Kuboyama, T., Nakahara, M., Yoshino, M., Cui, Y., Sako, T., Wada, Y., Imanishi, T., Obika, S., Watanabe, Y., Suzuki, M., Doi, H., “Stoichiometry-Focused ¹⁸F-Labeling of Alkyne-Substituted Oligodeoxynucleotides Using Azido([¹⁸F]fluoromethyl)benzenes by Cu-Catalyzed Huisgen Reaction”, *Bioorg. Med. Chem.*, **19**, 249–255 (2011). (doi: 10.1016/j.bmc.2010.11.033)
- (49) Takashima, T., Nagata, H., Nakae, T., Cui, Y., Wada, Y., Kitamura, S., Doi, H., Suzuki, M., Maeda, K., Kusuhara, H., Sugiyama, Y., Watanabe, Y., “Positron Emission Tomography Studies Using (15R)-16-m-[¹¹C]tolyl-17,18,19,20-tetranorisocarbacyclin Methyl Ester for the Evaluation of Hepatobiliary Transport”, *J. Pharmacol. Exp. Ther.* **335**, 314–323 (2010).
- (50) Takashima-Hirano, M., Shukuri, M., Takashima, T., Goto, M., Wada, Y., Watanabe, Y., Onoe, H., Doi, H., Suzuki, M., “General Method for ¹¹C-Labeling of 2-Arylpropionic Acids and Their Esters: Construction of a PET Tracer Library for a Study of Biological Events Involved in COXs Expression”, *Chem. Eur. J.*, **16**, 4250–4258 (2010).
- (51) Yokoyama, C., Yamanaka, H., Onoe, K., Kawasaki, A., Nagata, H., Shirakami, K., Doi, H., Onoe, H., “Mapping of Serotonin Transporters by Positron Emission Tomography with [¹¹C]DASB in Conscious Common Marmosets: Comparison with Rhesus Monkeys”, *Synapse*, **64**(8), 594–601 (2010).
- (52) Suzuki, M., Sumi, K., Koyama, H., Siqin, Hosoya, T., Takashima-Hirano, M., Doi, H., “Pd(0)-Mediated Rapid Coupling between Methyl Iodide and Hetero-Arylstannanes: an Efficient and General Method for the Incorporation of a Positron-Emitting ¹¹C Radionuclide into Heteroaromatic Frameworks”, *Chem. Eur. J.*, **15**, 12489–12495 (2009).
- (53) Cui, Y., Takashima, T., Takashima-Hirano, M., Wada, Y., Shukuri, M., Tamura, Y., Doi, H., Onoe, H.,

- Kataoka, Y., Watanabe, Y., “¹¹C-PK11195 PET for the In Vivo Evaluation of Neuroinflammation in the Rat Brain After Cortical Spreading Depression”, *J. Nuc. Med.*, **50**, 1904–1911 (2009).
- (54) Doi, H., Ban, I., Nonoyama, A., Sumi, K., Kuang, C., Hosoya, T., Tsukada, H., Suzuki, M., “Palladium(0)-Mediated Rapid Methylation and Fluoromethylation on Carbon Frameworks by Reacting Methyl and Fluoromethyl Iodide with Aryl and Alkenyl Boronic Acid Esters Useful for the Synthesis of [¹¹C]CH₃—C- and [¹⁸F]FCH₂—C-Containing PET Tracers”, *Chem. Eur. J.*, **15**, 4165–4171 (2009).
- (55) Barletta, J., Karimi, F., Doi, H., Långström, B., “Synthesis of diethyl [carbonyl-¹¹C]malonate from [¹¹C]carbon monoxide by rhodium-promoted carbonylation and its application as a reaction intermediate”, *J. Label. Compd. Radiopharm.* **49**, 801–809 (2006).
- (56) Hosoya, T., Sumi, K., Doi, H., Wakao, M., Suzuki, M., “Rapid methylation on carbon frameworks useful for the synthesis of ¹¹CH₃-incorporated PET tracers: Pd(0)-mediated rapid coupling of methyl iodide with an alkenyltributylstannane leading to a 1-methylalkene”, *Org. Biomol. Chem.*, **4**, 410–415 (2006).
- (57) Doi, H., Barletta, J., Suzuki, M., Noyori, R., Watanabe, Y., Långström, B., “Synthesis of ¹¹C-labelled N,N'-diphenylurea and ethyl phenylcarbamate by a rhodium-promoted carbonylation via [¹¹C]isocyanatobenzene using phenyl azide and [¹¹C]carbon monoxide”, *Org. Biomol. Chem.*, **2**, 3063–3066 (2004). (doi: 10.1039/B409294E)
- (58) Hosoya, T., Wakao, M., Kondo, Y., Doi, H., Suzuki, M., “Rapid methylation of terminal acetylenes by the Stille coupling of methyl iodide with alkynyltributylstannanes: a general protocol potentially useful for the synthesis of short-lived ¹¹CH₃-labeled PET tracers with 1-propynyl group”, *Org. Biomol. Chem.*, **2**, 24–27 (2004).
- (59) Suzuki, M., Doi, H., Kato, K., Björkman, M., Långström, B., Watanabe, Y., Noyori, R., “Rapid Methylation for the Synthesis of a ¹¹C-Labeled Tolylisocarbacyclin Imaging the IP₂ Receptor in a Living Human Brain”, *Tetrahedron*, **56**, 8263–8273 (2000).
- (60) Björkman, M., Doi, H., Resul, B., Suzuki, M., Noyori, R., Watanabe, Y., Långström, B., “Synthesis of a ¹¹C-Labelled Prostaglandin F_{2α} Analogue Using an Improved Method for Stille Reactions with [¹¹C]Methyl Iodide”, *J. Labelled Compd. Radiopharm.*, **43**, 1327–1334 (2000).
- (61) Björkman, M., Andersson, Y., Doi, H., Kato, K., Suzuki, M., Noyori, R., Watanabe, Y., Långström, B., “Synthesis of ¹¹C/¹³C-labelled Prostacyclins”, *Acta Chem. Scand.*, **52**, 635–640 (1998).
- (62) Mori, T., Taniguchi, M., Suzuki, F., Doi, H., Oku, A., “Ring-enlargement reaction of alkylidenecarbenes bearing a cyclic ether or acetal group. Formation of medium-sized cyclic enol ethers or dienol ethers via bicycloalkenyloxonium ylides”, *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1*, 3623–3628 (1998).
- (63) Suzuki, M., Doi, H., Björkman, M., Andersson, Y., Långström, B., Watanabe, Y., Noyori, R., “Rapid Coupling of Methyl Iodide with Aryltributylstannanes Mediated by Palladium(0) Complexes: A General Protocol for the Synthesis of ¹¹CH₃-Labeled PET Tracers.”, *Chem. Eur. J.*, **3**, 2039–2042 (1997). (doi: 10.1002/chem19970031219)

【総説, Review Article】

- (1) Doi, H., “Pd-Mediated Rapid Cross-Coupling Using [¹¹C]Methyl Iodide: Groundbreaking Labeling Methods in ¹¹C Radiochemistry”, Special Issue; Bengt Långström, *J. Label. Compd. Radiopharm.* **58**, 73–85 (2015). (doi: 10.1002/jlcr.3253)
- (2) Suzuki, M., Doi, H., Koyama, H., Zhang, Z., Hosoya, T., Onoe, H., Watanabe, Y. “Pd⁰-Mediated

- Rapid Cross-Coupling Reactions, the Rapid C-[¹¹C]Methylations, Revolutionarily Advancing the Syntheses of Short-Lived PET Molecular Probes”, *Chem. Rec.*, **14**(3), 516–541 (2014).
- (3) Suzuki, M., Doi, H. “Pd⁰-Mediated Rapid C-[¹¹C]Methylations and C-[¹⁸F]Fluoromethylations: Revolutionary New Methodologies for the Synthesis of Short-Lived PET Molecular Probes”, *J. Synth. Org. Chem. Jpn.*, **68**(11), 1195–1206 (2010).
- (4) Suzuki, M., Doi, H., Hosoya, T., Långström, B., Watanabe, Y. “Rapid methylation on carbon frameworks leading to the synthesis of a PET tracer capable of imaging a novel CNS-type prostacyclin receptor in living human brain”, *Trends Anal. Chem.*, **23**, 595–607 (2004).

【著書、一般科学雑誌、新聞, Book & Scientific Journal】

English language books

- (1) Suzuki, M., Koyama, H., Kato, K., Ögren M., Doi, H., “Green Process of Three-Component Prostaglandin Synthesis and Rapid ¹¹C Labelings of Short-Lived PET Tracers: Highly Polished C-Couplings Revolutionizing Advances in Bio- and Medical Sciences”, Intech, 2018. (doi: 10.5772/intechopen.72868, ISBN: 978-953-51-3765-8, Print ISBN: 978-953-51-3764-1)
- (2) Suzuki, M., Koyama, H., Takashima-Hirano, M., Doi, H. “Pd⁰-Mediated Rapid C-[¹¹C]Methylation and C-[¹⁸F]Fluoromethylation: Revolutionary Advanced Methods for General Incorporation of Short-Lived Positron-Emitting ¹¹C and ¹⁸F Radionuclides in an Organic Framework” in *Positron Emission Tomography: Current Clinical and Research Aspects*, chapter 5, pp. 115–152, InTech, 2012.

日本語書籍・科学雑誌・新聞

- (1) 土居久志、渡辺恭良, “PET 分子プローブ：生体内の分子の活動を見る”, 実験医学 増刊, **36**(20), 180–182 (2018).
- (2) 馬渡彩、野崎聰、二宮伸二、渡辺恭良、土居久志, “チアミンおよびフルスルチアミンの ¹¹C-標識 PET プローブの合成”, ビタミン誌, ビタミン学会, 91(3), pp. 190-192 (2017).
- (3) 土居久志, “科学の中身；化学の英知で生命科学に挑戦”, 産経新聞、関西版、2016 年 5 月 12 日、朝刊、22 ページ .(Web ページ : <http://www.sankei.com/west/news/160612/wst1606120008-n1.html>)
- (4) 土居久志、渡辺恭良, “展望；チアミン（ビタミン B₁）およびフルスルチアミン（プロドラッグ型ビタミン B₁）の ¹¹C-標識化と PET イメージングへの展開”, Isotope News, 日本アイソトープ協会, pp. 2-6, No. 742, (2016).
- (5) 土居久志, “コラム；PET 分子イメージング”, 大学院講義有機化学II巻 第2版, 東京化学同人, pp. 436-437, 初版発行年月日 : 2015 年 10 月 28 日.
- (6) 土居久志, “食品含有有機化合物の ¹¹C-標識 PET プローブ化”, 月刊ファインケミカル（シーエムシー出版）, 特集-天然物合成化学の新たな展開, **43**(2), pp. 53–57 (2014).
- (7) 土居久志, “PET 分子プローブの合成化学：低分子化合物の高速 ¹¹C-標識化”, ファルマシア（日本薬学会会誌）, セミナー, **49**(7), pp. 645-649 (2013).
- (8) 土居久志, “PET 分子イメージングプローブの開発研究と化学イノベーション”, 細胞 The CELL (ニューサイエンス社), **45**(2), pp. 54-58(6-10) (2013).
- (9) 宿里充穂、高島好聖、徳田景子、松村潔、土居久志、鈴木正昭、渡辺恭良、尾上浩隆, “脳内 COX-1 を標的分子とした活性化マイクログリアのイメージング”, トピックス第6回日本分子イメージング学会総会最優秀発表者賞受賞から, 日本分子イメージング学会機関誌, **5**(1), 13–16, (2012).
- (10) 土居久志, “短寿命 PET 分子プローブ合成のための高速化学反応の開発”, 科学と工業 (大

阪工研協会会誌) , **85**(4), 154-161 (2011).

- (11) 土居久志, 遺伝子医学 MOOK18 号 創薬研究への分子イメージング応用, “第 1 章 3. PET 分子プローブの合成法”, メディカルドゥ, pp. 47-53. 初版発行年月日 : 2010 年 12 月 25 日.
- (12) 土居久志, 臨床医とコメディカルのための最新クリニカル PET, “第 15 章 2. PET 分子プローブの開発研究とその進歩”, 先端医療技術研究所, pp. 251-257. 初版発行年月日 : 2010 年 11 月 30 日.
- (13) 高島忠之、長田浩子、中江崇敬、橋爪良信、土居久志、和田康弘、崔翼龍、鈴木正昭、渡辺恭良、北村吏司、前田和哉、楠原洋之、杉山雄一, “ $^{15}R-[^{11}C]$ TIC を用いた Positron Emission Tomography (PET) による肝胆系輸送の機能評価”, *Jpn. Pharmacol. Ther.* (薬理と治療), **37**, supplement, S65-S69 (2009).
- (14) 杉山雄一、北村吏司、前田和哉、楠原洋之、高島忠之、長田浩子、橋爪良信、土居久志、中江崇敬、和田康弘、崔翼龍、鈴木正昭、渡辺恭良, “PET プローブ $^{15}R-[^{11}C]$ TIC の肝胆系輸送に関与するトランスポーターの同定ならびにヒト相互作用試験時の血漿・肝臓内濃度変動および *in vitro* 試験からの予測”, *Jpn. Pharmacol. Ther.* (薬理と治療), **37**, supplement, S71-S78 (2009).
- (15) C. WU, H. Kusuhara, Y. Sugiyama, T. Takashima, M. Takashima-Hirano, H. Doi, M. Suzuki, Y. Watanabe, “Investigation of Canalicular Efflux Mechanisms of SC-62807, a Major Metabolite of Celecoxib”, *Jpn. Pharmacol. Ther.* (薬理と治療), **37**, supplement, S37-S42 (2009).
- (16) 鈴木正昭、土居久志、渡辺恭良, “PET 法による分子イメージング研究の新展開-創薬プロセス・疾患診断の革新を目指して”, 化学工業, **58**, No. 5, 351-359 (2007).
- (17) 鈴木正昭、土居久志, マイクロドーズ臨床試験 理論と実践 一新たな創薬開発ツールの活用に向けて一, “第 4 章 3. (1) 薬剤標識と安全性 PET トレーサーの新合成法とその一般化”, じほう, pp. 140-150. 初版発行年月日 : 2007 年 2 月 15 日.
- (18) 鈴木正昭、土居久志, “PET トレーサーの新合成法-創薬・疾患診断法の革新を目指して”, 化学, **61**, No. 10, 28-33 (2006).
- (19) 鈴木正昭、土居久志、細谷孝充, “PET プローブの新合成法と活用”, オプトロニクス, **25**, No. 3, 94-100 (2006).
- (20) 鈴木正昭、土居久志、細谷孝充, “脳化学-PET 研究基盤を刷新するプローブ創製と ^{11}C 新導入法”, 神経研究の進歩, **49**, 939-947 (2005).
- (21) 鈴木正昭、土居久志, “PET トレーサー合成基盤を刷新する高速メチル化反応-プロスタグラシン受容体の可視化”, 化学と生物 (日本農芸化学会会誌), **43**, 804-808 (2005).
- (22) 鈴木正昭、土居久志、細谷孝充、塙田秀夫, “先端の分析法-理工学からナノ・バイオまで-”, “第 10 章 生体トモグラフィー 第 1 節 PET”, エヌ・ティー・エス, pp. 814-829. 初版発行年月日 : 2004 年 12 月 15 日
- (23) 土居久志, “ ^{11}C 化学 パラジウム触媒を用いた ^{11}C 放射核の高効率導入法”, PET 通信, No. 47, 16-17 (2004).
- (24) 鈴木正昭、土居久志、細谷孝充、渡辺恭良, “Positron Emission Tomography (PET) 法による生体の分子イメージング研究と創薬・医療への応用”, 生物物理, **44**, 265-270 (2004).
- (25) 鈴木正昭、土居久志、加藤孝一、細谷孝充、渡辺由美子、渡辺恭良, “脳を探る分子プローブ設計: ヒト脳内 IP₂ 受容体の分子イメージング”, 日本神経精神薬理学雑誌 (*Jpn. J. Neuropsychopharmacol.*) **24**, 221-229 (2004).
- (26) 鈴木正昭、土居久志、細谷孝充、Bengt Långström、渡辺由美子、渡辺恭良, “設計 PG プローブによるヒト脳内 IP₂ 受容体の分子イメージング”, 細胞工学, **22**, No. 2, 165-171 (2003 年 2 月号).

- (27) 鈴木正昭、土居久志、細谷孝充、渡辺恭良、 “生体の非破壊分析（9）：PET 法による脳内中枢型プロスタサイクリン受容体の分子イメージング”， 現代化学，387，46-54（2003年6月号）。
- (28) 鈴木正昭、土居久志，創薬サイエンスのすすめ，“第5章 創薬分子科学から生体非侵襲測定へ”，共立出版，pp. 65-84. 初版発行年月：2002年9月15日
- (29) 鈴木正昭、土居久志、加藤孝一，“陽電子放射断層画像撮影法（PET 法）によるヒト脳機能分析のための高次プロスタグランジン（PG）プローブの創製”，ファルマシア，最前線，37，994-998（2001）。