

# 医薬品化学

Medicinal Chemistry

薬品製造学研究室

Synthetic Organic Chemistry

教授	根本 英雄	Hideo Nemoto
助教授	豊岡 尚樹	Naoki Toyooka
助手	松谷 裕二	Yuji Matsuya

## 原著

- 1) Matsuya Y., Ohsawa N., and Nemoto H. : Accelerated Electrocyclic Ring-opening of Benzocyclobutenes under the Influence of a  $\beta$ -Silicon Atom. *J. Am. Chem. Soc.*, 128 : 412-413, 2006.
- 2) Toyooka N., Dejun Z., Nemoto H., Garraffo H. M., Spande T. F., and Daly J. W. : The Enantioselective Synthesis of Poison-Frog Alkaloids (-)-203A, (-)-209B, (-)-231C, (-)-233D, and (-)-235B". *Tetrahedron Lett.*, 47 : 577-580, 2006.
- 3) Toyooka N., Dejun Z., Nemoto H., Garraffo H. M., Spande T. F., and Daly J. W. : Enantioselective Synthesis of Poison-Frog Alkaloids: 219F and 221I and an Epimer of 193E. *Tetrahedron Lett.*, 47 : 581-582, 2006.
- 4) Hayashi K., Lee J.-B., Maitani Y., Toyooka N., Nemoto H., and Hayashi T. : The Role of a HSV Thymidine Kinase Stimulating Substance, Scopadulciol, in Improving the Efficacy of Cancer Gene Therapy. *J. Gene Med.*, 8 : 1056-1067, 2006.
- 5) Matsuya Y., Kawaguchi T., Ishihara K., Ahmed K., Zhao Q.-L., Kondo T., and Nemoto H. : Synthesis of Macrophelides with a Thiazole Side Chain: New Antitumor Candidates Having Apoptosis-Inducing Property. *Org. Lett.*, 8 : 4609-4612, 2006.
- 6) Matsuya Y., Ohsawa N., and Nemoto H. : Facile Transformation of Benzocyclobutenones into 2,3-Benzodiazepines via  $4\pi$ - $8\pi$  Tandem Electrocyclic Reactions Involving Net Insertion of Diazomethylene Compounds. *J. Am. Chem. Soc.*, 128: 13072-13073, 2006.
- 7) Murata N., Fujimori S., Ichihara Y., Sato Y., Yamaji T., Tsuboi H., Uchida M., Suzuki H., Yamada M., Oikawa T., Nemoto H., Nobuhiro J., Choshi T., and Hibino S. : Synthesis and Anti-tumor Activity of a Fluorinated Analog of Methoxyprogesterone Acetate (MPA), 9 $\alpha$ -Fluoromedroxyprogesterone Acetate (FMPA). *Chem. Pharm. Bull.*, 54 :1567-1570, 2006.
- 8) Kawasaki M., Yoshikai H., Kakuda H., Toyooka N., Tanaka A., Goto M., and Kometani T. : Asymmetric Synthesis of Flindersiachromanone Using Lipase-Catalyzed Reaction. *Heterocycles*, 68 : 483-493, 2006.
- 9) Toyooka N., Dejun Z., Nemoto H., Garraffo H. M., Spande T. F., and Daly J. W. : Chiral Synthesis of Poison-Frog Alkaloids 251N and 221K. *Heterocycles*, 70 : 541-548, 2006.

## 総説

- 1) 豊岡尚樹, 根本英雄, 恒枝宏史 : 毒ガエルアルカロイドの合成とニコチン受容体に対する活性評価. *有機合成化学協会誌*, 64: 49-60, 2006.

## 学会報告

- 1) 松谷裕二, 佐々木和重, 鈴木望美, 小林真也, 落合宏, 根本英雄 : 抗ウイルス活性を有するフラン融合縮環化合物の含フッ素誘導体化と活性評価. 日本薬学会第 126 年会, 2006, 3, 仙台.
- 2) 松谷裕二, 高柳祥一, 笠木 亮, 根本英雄 : 閉環メタセシスによる CJ-12,950 基本骨格の構築. 日本薬学会第 126 年会, 2006, 3, 仙台.
- 3) 松谷裕二, 今村良明, 熊倉高志, 根本英雄 : Wortmannin フェルマコフォア構造の合成研究. 日本薬学会第 126 年会, 2006, 3, 仙台.
- 4) 松谷裕二, 増田誠治, 根本英雄 : OSW-1 を基盤とした新規抗癌剤の設計と合成. 日本薬学会第 126 年会 (講演ハイライトに掲載), 2006, 3, 仙台.
- 5) 松谷裕二, 山田和佳, 根本英雄 : 抗マラリア薬開発を志向した Hypothemycin 類の合成研究. 日本薬学会第 126 年会, 2006, 3, 仙台.
- 6) 松谷裕二, 小林勇太, 坂本啓二, 根本英雄 : 閉環メタセシスを利用した Macrophelide 類の合成. 日本薬学会第 126

年会, 2006, 3, 仙台.

- 7) 松谷裕二, 大澤徳子, 根本英雄: ベンゾシクロブテン熱開裂における  $\beta$ -シリル置換基の効果. 日本薬学会第 126 年会, 2006, 3, 仙台.
- 8) 林 衡佑, 松谷裕二, 根本英雄: 共役アルキン類を基質とした新規炭素-炭素結合形成反応の開発とその応用. 日本薬学会第 126 年会シンポジウム, 2006, 3, 仙台.
- 9) 近藤 隆, Kanwal A., Dayong Y., 趙 慶利, 松谷裕二, 根本英雄: アポトーシスを指標にした抗がん剤および増感剤の開発. 第 8 回癌治療増感研究シンポジウム, 2006, 2, 奈良.
- 10) Toyooka N., Z.Dejun, Nemoto H., Garraffo H.M., Spande T.F., and Daly J.W. : Chiral Synthesis of 5,8-Disubstituted Indolizidine Type Poison-frog Alkaloids. International Molecular Chirality Conference in Toyama, 2006, 5, Toyama (Japan).
- 11) 松谷裕二, 和田明穂, 根本英雄: プロピオレート, イミン類, およびスルホンアミドの新規 3 成分連結反応. 日本薬学会北陸支部第 114 例会, 2006, 7, 金沢.
- 12) 増田誠治, 松谷裕二, 根本英雄: 抗癌剤創製を目指した OSW-1 類似化合物の新規合成法の開発. 日本薬学会北陸支部第 114 例会, 2006, 7, 金沢.
- 13) 小林勇太, 松谷裕二, 根本英雄: マクロスフェライド I および L の全合成研究. 日本薬学会北陸支部第 114 例会, 2006, 7, 金沢.
- 14) 周 徳軍, 豊岡尚樹, 根本英雄, Garraffo H. M., Spande T. F., Daly J. W. : 毒ガエルアルカロイド 233A, 251AA, 235U のキラル合成. 日本薬学会北陸支部第 114 例会, 2006, 7, 金沢.
- 15) Ahmed K., Zhao Q.-L., Kondo T., Yu D.-Y., Feril L.B. Jr., Matsuya Y., and Nemoto H. : Enhancement of a novel macrophelide-induced Apoptosis by mild hyperthermia. 12<sup>th</sup> Annual Meeting On The Sensitization Of Cancer Treatment, 2006, 5, Toyama (Japan).
- 16) 松谷裕二, 笠木 亮, 高柳祥一, 根本英雄: 天然マクロライド CJ-12,950 の合成研究. 第 36 回複素環化学討論会, 2006, 11, 長崎.
- 17) 松谷裕二, 河口尚則, 石原健太郎, Ahmed K., Zhao Q.-L., 近藤 隆, 根本英雄: マクロスフェライド類を基盤とした新規生理活性物質の設計, 合成, 活性評価. 第 48 回天然有機化合物討論会, 2006, 10, 仙台.
- 18) 松谷裕二, 大澤徳子, 根本英雄: 電子供与性置換基によるベンゾシクロブテン開裂の促進効果と 2,3-ベンゾジアゼピン合成への応用. 第 32 回反応と合成の進歩シンポジウム, 2006, 12, 広島.
- 19) 周 徳軍, 豊岡尚樹, 恒枝宏史, 古林創史, 笹岡利安, 根本英雄, Daly J. W., Spande T.F., Garraffo H. M. : 毒ガエルアルカロイドの合成とそのニコチン受容体抑制活性評価. 第 32 回反応と合成の進歩シンポジウム, 2006, 12, 広島.
- 20) 松谷裕二, 佐々木和重, 鈴木望美, 落合宏, 根本英雄: フラン融合縮環化合物の合成と抗インフルエンザウイルス活性. 第 25 回メデイシナルケミストリーシンポジウム, 2006, 11, 名古屋.
- 21) 小林勇太, 河口尚則, 石原健太郎, 松谷裕二, Ahmed K., Zhao Q.-L., 近藤 隆, 根本英雄: チアゾール側鎖を有するマクロスフェライド誘導体の合成とアポトーシス誘導活性. 第 25 回メデイシナルケミストリーシンポジウム, 2006, 11, 名古屋.
- 22) 松谷裕二, 大澤徳子, 根本英雄: オキシアニオンによるベンゾシクロブテンの開環促進効果を活用した 2,3-ベンゾジアゼピン類への変換反応, 平成 18 年度有機合成化学北陸セミナー, 2006, 10, 富山.
- 23) Ahmed K., Zhao Q.-L., Kondo T., Yu D.-Y., Feril L. B. Jr, Matsuya Y., and Nemoto H. : Enhancement of a novel macrophelide-induced apoptosis by mild hyperthermia. The 4th Asian Congress of Hyperthermic Oncology and the 23<sup>rd</sup> Japanese Congress of Hyperthermic Oncology, 2006, 9, Nara (Japan).
- 24) Yu D.-Y., Matsuya Y., Zhao Q.-L., Ahmed K., Wei Z.-L., Kondo T., and Nemoto H.: Enhancement of hyperthermia-induced apoptosis by a new synthesized class of furan-fused tetracyclic compounds. The 4th Asian Congress of Hyperthermic Oncology and the 23<sup>rd</sup> Japanese Congress of Hyperthermic Oncology, 2006, 9, Nara (Japan).
- 25) 近藤 隆, 于 大永, 松谷裕二, 趙 慶利, Ahmed K., 魏 政立, 根本英雄: 新規フラン融合性四環性化合物による温熱誘発アポトーシスの増強. 日本放射線影響学会第 49 回大会, 2006, 9, 札幌.

## その他

### 招待講演

- 1) 根本英雄: Benzocyclobutene 有機合成化学と医薬品化学への新展開. 平成 18 年度白鷺セミナー (大阪府立大学), 2006, 6, 大阪.

- 2) 根本英雄：Benzocyclobutene 有機合成化学と医薬品化学. 千葉大学大学院薬学研究院特別講演，2006， 9， 千葉.
- 3) 豊岡尚樹：毒ガエルアルカロイドの合成とそのニコチン受容体における薬理活性. 佐藤記念国内賞受賞講演，日本薬学会第 126 年会，仙台.
- 4) Toyooka N. : Synthetic Studies on Biologically Active Alkaloids. Shanghai Institute of Organic Chemistry. Chinese Academy of Sciences, October, 2006, Shanghai (China) .
- 5) Toyooka N. : Synthetic Studies on Biologically Active Alkaloids. Xiamen University, October, 2006, Xiamen (China).
- 6) 松谷裕二：共役アルキン類の連続的活性化と 3 成分連結反応への展開. 学術奨励賞受賞講演：日本薬学会北陸支部第 115 回例会，富山.