

J., 350 : 229-235, 2000.

- 7) Hayashi, K., Kawahara, K., Nakai, C., Sankawa, U., Seto, H., and Hayashi, T.: Evaluation of (1R,2R)-1-(5'-methylfur-3'-yl) propane-1,2,3-triol, a sphingolipid derivative isolated from a *Streptomyces* species, as an anti-herpesvirus drug. *J. Antimicrob. Chemother.*, 46 : 181-189, 2000.
- 8) Suh, D.-Y., Kagami, J., Fukuma, K., and Sankawa U.: Evidence for catalytic cysteine-histidine dyad in chalcone synthase. *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, 275 : 725-730, 2000
- 9) Hayakawa, Y., Hayashi, T., Lee, J.-B., Preeprame, S., Maeda, M., Ozawa, T., Sakuragawa, N.: Inhibition of thrombin by sulfated polysaccharides isolated from green algae. *Biochim. Biophys. Acta*, 1543 : 86-94, 2000.
- 10) Matsumura, T., Kasai, M., Hayashi, T., Arisawa, M., Momose, Y., Arai, I., Amagaya, S., and Komatsu, Y.:  $\alpha$ -Glucosidase inhibitors from Paraguayan natural medicine, Nangapiry, the leaves of *Eugenia uniflora*. *Pharmaceutical Biol.*, 38 : 302-307, 2000.

#### ◆ 学会報告

- 1) 李 貞範, 田中友康, 林 京子, 林 利光, 三川潮: スピリリナ由来硫酸化多糖カルシウムスピランの低分子化と抗ウイルス活性. 日本薬学会第120年会, 2000, 3, 岐阜.
- 2) 河原 究, 林 利光, 三川 潮, 林 京子, 竹中裕行: 食用陸生藻“髮菜”を対象とした新規抗ウイルス活性分子の探索. 日本薬学会第120年会, 2000, 3, 岐阜.
- 3) 江村宣弘, 藤井 勲, 原田繁春, 海老塚豊, 三川 潮: Dihydrogeodin oxidase のヘテロな系での発現とその精製(3). 日本薬学会第120年会, 2000, 3, 岐阜.
- 4) 宮原龍郎, 加藤安代, 李 貞範, 田中友康, 根本信雄, 林 利光: 食用藻類由来新規硫酸化多糖の骨吸収抑制作用. 第21回日本糖質学会年会, 2000, 7, 名古屋.
- 5) 鍛冶利幸, 島田智美, 山本千夏, 藤原泰之, 李 貞範, 林 利光: 血管内皮細胞層からのプロテオグリカン放出に対する新奇硫酸化多糖Na-Spirulan の作用. 日本薬学会北陸支部第103回例会, 2000, 11, 富山

## 薬 用 資 源 学

### 合 成 化 学 研 究 室

教	授	竹	内	義	雄
講	師	柴	田	哲	男
助	手	阿	部		肇

#### ◆ 研究概要

医薬品創製を志向する含フッ素生体関連有機化合物の設計, 合成およびその応用研究

#### ◆ 著 書

- 1) Matsugi M., Shibata N., and Kita Y.: Asymmetric pummerer rearrangement and related reactions. In *Advances in Sulfur Chemistry*, 2, by Rayner, C. M.(Ed.) 215-248, JAI Press Inc., Stamford, 2000.

#### ◆ 原 著

- 1) 竹内義雄: 未開拓の化合物, キラル有機フッ化物. その合成と薬学への応用に挑戦. *ファルマシア*, 36 : 113-115, 2000.
- 2) Takahashi T., Fukushima A., Tanaka Y., Segawa M., Hori H., Takeuchi Y., Burchardt A., and Haufe G.: A new efficient chiral diverting agent,  $\alpha$ -cyano- $\alpha$ -fluoro(2-naphthyl)acetic acid (2-CFNA). Application to the ee determination of  $\alpha$ -3-acetoxy-2-fluoro-2-(hexadecyloxymethyl)propan-1-ol. *Chirality*, 12 : 458-463, 2000.
- 3) Takeuchi Y., Kirihaara K., Kirk K. L., and Shibata N.: Synthesis of carbonyl-bridged-peptides containing an  $\alpha$ -fluoroglycine residue. *Chem. Commun.*: 785-786, 2000.
- 4) Takahashi T., Fukushima A., Tanaka Y., Takeuchi Y., Kabuto K., and Kabuto C.: C FTA, a new efficient agent for determination of absolute configurations of chiral secondary alcohols. *Chem. Commun.*: 787-788, 2000.
- 5) Takeuchi Y., Tarui T., and Shibata N.: A novel and efficient synthesis of 3-fluoro-oxindoles from indoles mediated by select-fluor. *Org. Lett.*, 2 : 639-642, 2000.
- 6) Kirihaara M., Takuwa T., Okumura M., Wakikawa T., Takahata T., Momose T., Takeuchi Y., and Nemoto H.:  $\alpha$ -Bromo- $\alpha$ ,  $\alpha$ -difluoroallyl derivatives as synthetic intermediate: Nucleophilic substitution of  $\alpha$ -bromo- $\alpha$ ,  $\alpha$ -difluoroallyl derivatives in

the presence of palladium catalysts. Chem. Pharm. Bull., 48 : 885-888, 2000.

- 7) Liu Z., Shibata N., and Takeuchi, Y.: Novel methods for the facile construction of 3,3-disubstituted and 3,3-spiro-2H, 4H-benzo[e]1,2-thiazine-1,1-diones: synthesis of (11S, 12R, 14R)-2-fluoro-14-methyl-11-(methyl-ethyl)spiro[4H-benzo[e]-1,2-thiazine-3,2'-cyclohexane]-1,1-dione, an agent for the electrophilic asymmetric fluorination of aryl ketone enolates. J. Org. Chem., 65 : 7583-7587, 2000.
- 8) Shibata N., Suzuki E., and Takeuchi Y.: A fundamentally new approach to enantioselective fluorination based on cinchona alkaloid derivatives/selectfluor combination. J. Am. Chem. Soc., 122 : 10728-10729, 2000.
- 9) Takeuchi, Y.: Why fluorine has fascinated me for 30 years. J. Fluorine Chem., 105 : 215-217, 2000.
- 10) Shibata N., Liu Z., and Takeuchi Y.: Novel enantioselective fluorinating agents, (R)- and (S)-N-fluoro-3-tert-butyl-7-nitro-3,4-dihydro-2H-benzo[e][1,2]thiazine 1,1-dioxides. Chem. Pharm. Bull., 48 : 1954-1958, 2000.
- 11) Shibata N., Das B. K., and Takeuchi Y.: Application of the Ugi four-component condensation reaction for the synthesis of  $\alpha$ ,  $\alpha$ - and  $\alpha$ ,  $\beta$ -dipeptides substituted with fluoroarylalkyl pendent groups. J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1 : 4234-4236, 2000.

#### ◆ 学会報告

- 1) 樽井隆直, 柴田哲男, 竹内義雄 : 生体分子の互変異性体に関する研究 : トリプトファン副互変異性相似体の合成. 日本薬学会第120年会, 2000, 3, 岐阜.
- 2) 柴田哲男, 鈴木英美子, 木村健一, 白神友樹, 竹内義雄 : サリドマイドイソスター, フルオロサリドマイドの合成. 日本薬学会第120年会, 2000, 3, 岐阜.
- 3) 鈴木英美子, 白神友樹, 柴田哲男, 竹内義雄 : 市販試薬を用いた実用的不斉フッ素化反応の開発. 日本薬学会第120年会, 2000, 3, 岐阜.
- 4) Das B. K., 柴田哲男, 竹内義雄 : Synthesis of N-(p-fluorophenyl)ethyl peptides. 日本薬学会第120年会, 2000, 3, 岐阜.
- 5) 釣 敬, 柴田哲男, 竹内義雄 : 3-フルオロテトラミン酸類の合成. 日本薬学会北陸支部第102回例会, 2000, 6, 石川.
- 6) 鈴木英美子, 木村健一, 柴田哲男, 竹内義雄 : 光学活性フルオロサリドマイドの合成と生物活性. モレキュラー・キラリティー2000, 2000, 6, 東京.
- 7) 藤原朋也, 小俣乾二, 甲國信, 甲千寿子, 高橋たみ子, 瀬川大, 竹内義雄 : 絶対配置決定試薬CF<sub>3</sub>TAの一級アミン類への適用-CFTAアミドの立体配座-. モレキュラー・キラリティー2000, 2000, 6, 東京.
- 8) Takeuchi Y., Tarui T., and Shibata N.: A novel synthesis of 3-fluorooxindoles from indoles mediated by selectfluor. 16th International Symposium Fluorine Chemistry, 2000, 7, Durham, UK.
- 9) Shibata N., Suzuki E., Kimura K., and Takeuchi Y.: Design and synthesis of 3-fluorothalidomide, an isosteric analog of thalidomide. 16th International Symposium Fluorine Chemistry, 2000, 7, Durham, UK.
- 10) 樽井隆直, 土井康広, 柴田哲男, 竹内義雄 : トリプトファン環状互変異性体の設計と合成および生物活性物質合成への応用. 第24回フッ素化学討論会, 2000, 9, 京都.
- 11) Das B. K., 原田和行, 柴田哲男, 竹内義雄 : Design and synthetic studies of biologically active compounds having fluoroaromatics. 第24回フッ素化学討論会, 2000, 9, 京都.
- 12) Takeuchi Y., and Kabuto K.: The CFTA method: a new procedure for determination of absolute configurations of chiral molecules. The International Symposium on Chirality, 2000, 9, Chamonix, France.
- 13) 阿部 肇, 網井秀樹, 宇根山健治 : パラジウム触媒-含フッ素アルコール溶媒系における含フッ素イミンの不斉水素化反応. 第47回有機金属化学討論会, 2000, 10, 名古屋.
- 14) Liu Z., Shibata N., and Takeuchi Y.: Design and synthesis of novel enantioselective, electrophilic fluorinating agents. 2000 International Symposium on Organic Reactions-Tokyo, 2000, 10, Tokyo.
- 15) 鈴木英美子, 柴田哲男, 竹内義雄 : N-フルオロキニン誘導体を用いる不斉フッ素化反応の開発研究. 第26回反応と合成の進歩シンポジウム, 2000, 11, 大阪.
- 16) 土井康広, 樽井隆直, 柴田哲男, 竹内義雄 : ト

リプトファンの副互変異性相似体に関する研究：  
12-フルオロプレビアナミドEの合成研究. 日本  
薬学会北陸支部第103回例会, 2000, 11, 富山.

17) Takeuchi Y.: CFPA and CFTA: New fluorine-  
containing chiral-derivatizing agents for  
determinations of both enantiomeric excess  
and absolute configuration of chiral molec-  
ules. PACIFICHEM 2000, 12, Honolulu.

18) Abe H., Uneyama K., and Amii H.: Pd-  
catalyzed asymmetric hydrogenation of  
fluorinated imines in fluorous alcohol. PAC  
IFICHEM 2000, 12, Honolulu.

19) 柴田哲男, 鈴木英美子, 木村健一, 竹内義雄：  
ラセミ化しないサリドマイド誘導体の設計と合成.  
第20回メデイシナルケミストリーシンポジウム,  
2000, 12, 東京.

#### ◆ その他

1) 鈴木英美子, 柴田哲男, 竹内義雄: 新規不斉フッ  
素化反応剤, 光学活性N-フルオロアンモニウム塩.  
平成12年度有機合成化学北陸セミナー, 2000, 10,  
富山.

2) 豊吉哲也, 劉兆鵬, 柴田哲男, 竹内義雄: 不斉  
フッ素化試薬の研究. 平成12年度有機合成化学北  
陸セミナー, 2000, 10, 富山.

3) 田中昌子, 柴田哲男, 竹内義雄: 光学活性N-フ  
ルオロスルタム誘導体の合成とフッ素化反応の機  
構的考察. 平成12年度有機合成化学北陸セミナー,  
2000, 10, 富山.

4) 鈴木英美子, 白神友樹, 釣 敬, 柴田哲男, 竹  
内義雄: 3-デユウテリオサリドマイドの合成.  
平成12年度有機合成化学北陸セミナー, 2000, 10,  
富山.

5) 秦野真也子, 藤澤英仁, 阿部 肇, 竹内義雄：  
絶対配置決定試薬CFTAのベンズヒドロール類へ  
の応用研究. 平成12年度有機合成化学北陸セミナー,  
2000, 10, 富山.

## 薬 剤 設 計 学 物 理 化 学 研 究 室

教	授	上	野	雅	晴
助	教	授	吉	川	広
講	師	柏	木		寛

#### ◆ 原 著

1) Kashiwagi H., Aizawa K., and Ueno M.:  
Hyperfine Splitting of 2, 2, 6, 6-Tetramethyl-  
piperidine-N-oxyl in Octyl  $\beta$ -D-Glucoside-  
containing Large Unilamellar Vesicle Suspen-  
sions. Chem. Lett., 2000 : 134-135, 2000.

2) Sun C. and Ueno M.: Study on size growth  
in the vesicle formation upon detergent  
removal from phospholipid/detergent mixed  
micelles. Colloid Polym. Sci. 278 : 855-863,  
2000.

3) Hu Z., Mawatari S., Shibata N., Takada  
K., Yoshikawa H., Arakawa A., and Yosida  
Y.: Application of a biomagnetic measure-  
ment system (BMS) to the evaluation of  
gastrointestinal transit of intestinal pressure-  
controlled colon delivery capsules (PCDCs)  
in human subjects. Pharmaceut. Res., 17 :  
160-167, 2000.

4) Hashida M., Akamatsu K., Nishikawa M.,  
Yamashita F., Yoshikawa H., and Takakura  
Y.: Design of polymeric prodrugs of PGE1  
for cell-specific hepatic targeting. Pharmazie,  
55 : 202-205, 2000.

5) Sun C., Hanasaka A., Kashiwagi H., and  
Ueno M.: Formation and Characterization  
of Phosphatidylethanolamine/Lysophospha-  
tidylcholine Mixed Vesicles. Biochim. Biophys.  
Acta, 1467 : 18-26, 2000.

6) Kogure K., Itoh T., Okuda O., Hayashi  
K., and Ueno M.: The delivery of protein  
into living cells by use of membrane fusibles  
erythrocyte ghosts. Int. J. Pharmaceutics,  
210 : 117-120, 2000.

#### ◆ 総 説

1) 上野雅晴, 柏木 寛: リボソームと界面活性剤  
とのかかわり. 日本油化学会誌, 49 : 1131-1139,  
2000.

#### ◆ 学会報告

1) 柏木 寛, 相澤和年, 小岩陽子, 上野雅晴: TE