

薬 用 資 源 学

Medicinal Resources

合 成 化 学 研 究 室

Bio-Organic and Medicinal Chemistry

教授 竹内 義雄 Yoshio Takeuchi

助手 藤原 朋也 Tomoya Fujiwara

◆ 研究概要

新型医薬品の創製を志向した含フッ素有機化合物の分子設計, 反応, 合成, および評価

◆ 原 著

- 1) Fujisawa H., Takeuchi Y.: Simple Procedure for Preparation of α -Fluoro Esters by Fluorination of Ester Enol Silyl Ethers with Perchloryl Fluoride. *J. Fluorine Chem.*, 117: 173-176, 2002.
- 2) Kirihara M., Kawasaki M., Takawa T., Kakuda H., Wakikawa T., Takeuchi Y., Kirk K. L.: Efficient Synthesis of (*R*)- and (*S*)-1-Amino-2, 2-difluorocyclopropanecarboxylic Acid *via* Lipase-catalyzed Desymmetrization of Prochiral Precursors. *Tetrahedron: Asymmetry.*, 14:1753-1761, 2003.
- 3) Liu Z., Toyoshi T., Takeuchi Y.: A Novel Synthetic Approach to Benzo[*d*]isothiazole 1, 1-Diones Having a Secondary Alkyl Substituent at the 3-Position. *Synth. Commun.*, in Press.

◆ 学会報告

- 1) 竹内義雄: 含フッ素キラル誘導体試薬CFTAを用いる絶対配置決定法の拡大研究. 日本学術振興会フッ素化学155委員会第52研究会, 2003, 1, 京都.
- 2) 藤原朋也, 小俣乾二, 甲 國信, 甲千寿子, 竹内義雄: 2-シアノ-2-フルオロ-3-フェニルプロピオン酸 (CFPP) のキラル誘導体化試薬としての性質 (1): CFPPの光学分割と絶対配置決定. 日本化学会第83春季年会, 2003, 3, 東京.
- 3) 藤原朋也, 小俣乾二, 甲 國信, 甲千寿子, 竹内義雄: 2-シアノ-2-フルオロ-3-フェニルプロピオン酸 (CFPP) のキラル誘導体化試薬としての性質 (2): アルコール, アミノ酸エステルのCFPP誘導体の化学シフト非等価性と絶対配置の相関. 日本化学会第83春季年会, 2003, 3, 東京.
- 4) 藤原朋也, 小俣乾二, 甲 國信, 甲千寿子, 竹

内義雄: ^{19}F NMRを用いる絶対配置決定法, ^{19}F CFTA法の二級アルコールへの適用: カルビニル炭素上の置換基のかさ高さが $\Delta\delta$ 値に及ぼす影響. 日本化学会第83春季年会, 2003, 3, 東京.

- 5) 藤澤英仁, 竹内義雄: フッ化過クロリルを用いるエステル α 位のフッ素化反応 Part2. 日本薬学会第123年会, 2003, 3, 長崎.
- 6) Hori H., Nagasawa H., Uto Y., Ohkura K., Takeuchi Y., Kirk K. L., Miyataka H., Satoh T.: Design of Selective Arachidonic Acid Cascade Inhibitors of Low-mitochondrial-toxic PTK Inhibitor TX-1123 Analogues based on Their COX-1, 2 and 5-LO Inhibitory Activities. The Tumor Micro-environment and Its Impact on Cancer Therapies 8th International Workshop, 2003, 5, Miami, Florida, USA.
- 7) 藤原朋也, 竹内義雄, 小俣乾二, 甲 國信, 甲千寿子: CFTA誘導体の ^{19}F NMR化学シフトを利用する α -アミノ酸エステルの絶対配置決定法. 日本薬学会北陸支部第108回例会, 2003, 7, 金沢.
- 8) 藤原朋也, 小俣乾二, 甲 國信: ランタン (III) イオンのキレーションによるMTPA誘導体の配座変化と絶対配置決定への応用. 第29回反応と合成の進歩シンポジウム, 2003, 10, 岐阜.
- 9) Fujiwara T., Takeuchi Y., Omata K., Kabuto C., Kabuto K.: Determination of Absolute Configurations of α -Amino Esters by ^{19}F NMR Conformational Analysis of Their CFTA Amides. 15th International Symposium on Chirality, 2003, 10, Shizuoka, Japan.
- 10) 藤澤英仁, 藤原朋也, 竹内義雄, 大熊 毅, 野依良治: CFTAエステルのNMR測定による, キラルアルコール類の絶対配置決定法. 第27回フッ素化学討論会, 2003, 11, 長野.
- 11) Takeuchi Y., Fujisawa H., Fujiwara T., Omata K., Kabuto K.: The ^1H NMR Method Using CFTA: An Efficient Procedure for Determination of Absolute Configurations of Chiral Molecules. International Symposium on Organic Reactions 2003, 2003, 12, Kaohsiung, Taiwan.