

# 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キラル有機化合物の分子設計，反応，合成，および評価

### 原 著

- 1) Fujisawa H., Fujiwara T., Takeuchi Y., and Omata K.: Synthesis and optical resolution of 2-aryl-2-fluoropropionic acids, fluorinated analogues of non-steroidal anti-inflammatory drugs (NSAIDs). *Chem. Pharm. Bull.*, 53: 524-528, 2005.
- 2) Takeuchi Y., Fujisawa H., Fujiwara T., Matsuura M., Komatsu H., Ueno S., and Matsuzaki T.: Biological evaluation of 2-aryl-2-fluoropropionic acids as possible platforms for new medicinal agents. *Chem. Pharm. Bull.*, 53: 1062-1064, 2005.
- 3) Fujiwara T. and Takeuchi Y.: Synthesis, reactions, and applications of fluorine-containing multifunctional carbon compounds. *J. Fluorine Chem.*, 126: 941-955, 2005.

### 学会報告

- 1) 藤澤英仁，蛭間かおり，藤原朋也，竹内義雄：2-アリール-2-フルオロプロピオン酸類の光学分割と絶対配置の決定．日本薬学会第125年会，2005，3，東京．
- 2) 藤原朋也，藤澤英仁，森山史就，竹内義雄：生体関連分子の互変異性に関する研究3：含フッ素チロシン互変異性等価体の合成研究．日本薬学会第125年会，2005，3，東京．
- 3) 藤澤英仁，藤原朋也，竹内義雄，小俣乾二，松浦 衛，小松弘嗣，上野 哲，松崎 健：キラル2-アリール-2-フルオロプロピオン酸の合成と薬理活性．シンポジウム「モレキュラー・キラリティー2005」，2005，6，大阪．
- 4) Brand D. J., Steenkamp J. A., Brandt E. V., Roodt A., Fujiwara T., and Takeuchi Y.: Conformational studies of epicatechin-MTPA and -CFTA ester derivatives. シンポジウム「モレキュラー・キラリティー2005」，2005，6，大阪．
- 5) 関 孝行，藤澤英仁，藤原朋也，竹内義雄：生体関連分子の互変異性に関する研究4：メラトニン互変異性体の含フッ素環状等価体の合成研究．日本薬学会北陸支部第112回例会，2005，7，富山．
- 6) Takeuchi Y., Fujisawa H., Fujiwara T., Omata K., and Kabuto K.: The CFTA method using NMR: a very reliable, convenient procedure for assignment of absolute stereochemistry of chiral secondary alcohols. 17th International Symposium on Chiral Discrimination, 2005, 9, Parma, Italy.
- 7) 竹内義雄：2-アリール-2-フルオロプロピオン酸の合成と薬理学的研究．日本学術振興会第155委員会第63回研究会，2005，10，東京．
- 8) 藤澤英仁，藤原朋也，竹内義雄：2-フルオロアルカン酸誘導体の合成および光学分割．平成17年度有機合成化学北陸セミナー，2005，10，福井．
- 9) 関 孝行，藤澤英仁，藤原朋也，竹内義雄：副互変異性体介在仮説に基づいたインドール類の含フッ素等価体の合成．平成17年度有機合成化学北陸セミナー，2005，10，福井．
- 10) Sahnoun R., Fujimura Y., Kabuto K., Takeuchi Y., and Noyori R.: Toward understanding the conformational preference in  $\alpha$ -cyano- $\alpha$ -fluoro-p-tolylacetic acid derivatives: an ab initio molecular orbital study. International Fluorine Conference in Toyama, 2005, 11, Toyama, Japan.
- 11) Murai T., Fujisawa H., Okada T., Fujiwara T., and Takeuchi Y.: Studies on the tautomers of bioorganic molecules 5: attempted synthesis of fluorine-containing pseudologs for tyrosine tautomer. International Fluorine Conference in Toyama, 2005, 11, Toyama, Japan.
- 12) Fujiwara T., Omata K., Kabuto K., and Takeuchi Y.: The relationship between the  $^{19}\text{F}$  chemical shifts in the diastereomeric CFTA esters of secondary alcohols and their absolute configurations. International Fluorine Conference in Toyama, 2005, 11,

Toyama, Japan.

- 13) 藤原朋也, 藤澤英仁, 村井大樹, 竹内義雄, 小俣乾二, 甲 千寿子, 甲 國信, Ludwig S. N., Unkefer C. J.: 新規絶対配置決定手段としての CFTA 法:  $^{19}\text{F}$  NMR を用いるアルコールおよびアミン類の絶対配置決定への応用. 第 31 回反応と合成の進歩シンポジウム, 2005, 11, 神戸.
- 14) 藤澤英仁, 藤原朋也, 竹内義雄, 小俣乾二, 松浦 衛, 小松弘嗣, 上野 哲, 松崎 健: 2-アリール-2-フルオロプロピオン酸の合成, 光学分割, および薬理活性. 第 24 回メディシナルケミストリーシンポジウム, 2005, 11, 大阪.
- 15) Fujiwara T., Fujisawa H., Moriyama F., and Takeuchi Y.: Studies on the tautomers of bioorganic molecules: attempted synthesis of fluorine-containing tryptophan- and tyrosine-tautomer pseudologs. Pacificchem 2005, 2005, 12, Honolulu, Hawaii, USA.

### その他

- 1) Takeuchi Y.: Chiral organofluorine compounds: development of the CFTA method, an efficient procedure for determination of absolute configurations of chiral molecules. University of Rennes, 2005, 9, Rennes, France.
- 2) Takeuchi Y.: Chiral organofluorine compounds: development of the CFTA method, an efficient procedure for determination of absolute configurations of chiral molecules. University of Caen, 2005, 9, Caen, France.