

# 薬品合成化学

教授 吉井英一  
助教授 小泉徹  
助手 竹内義雄  
教務員 織部多喜子

## 1. 研究概要

### (1) 強心性ステロイドの合成研究

ジギトキシゲニン(カルデノライド), プファリン(プファジェノライド)によって代表される天然強心性ステロイドは, 心疾患の治療薬として重要であるのみならず, 最近に至り抗腫瘍薬物として注目されているが, 本研究室ではこれらの化合物の有利(短行程, 高収率)な合成法の開発を研究課題の一つとしている。すなわち入手容易で安価なステロイドを原料とし, 強心作用発現に必須な官能基の導入に必要な新合成反応を開発しながら目標を達成せんとするもので, 今年度においてはプファジェノライドの効率的な新合成法を完成した。

### (2) 光学活性有機リン化合物の合成研究

リン原子上での置換反応の機構の研究, 有機リン系医薬, 農薬の作用機序を明らかにするためには光学活性体が必要不可欠であるが, その合成は困難で少数例があるだけである。本研究室ではL-アミノ酸を不斉源として光学活性ホスホラスアミドを合成, その立体特異的ソルボリシスを行なうことにより, 各種光学活性リン化合物を得る方法を検討しており, 一般合成法として優れた方法であることが明らかになりつつある。

### (3) 動物生薬の品質評価に関する研究

ジャコウの科学的品質評価法を確立するため, その特有成分を明らかにし, それらの定量法を検討した結果, ケトステロイド, ムスコンの含量を指標とする品質評価法を確立することができた。

## 2. 学会発表

1) Bufa-20(22)-enolideのDDO脱水素について: 吉井英一, 小泉徹, 織部多喜子, 津村久美子, 日本薬学会第97年会, 東京。

2) N-ホスホリルジヒドロキノリンの反応とリン酸化反応への応用: 小泉徹, 武田敬, 吉井英一, 日本薬学会第97年会, 東京。

3) 光学活性ホスホトリエステルの新合成法: 小泉徹, 小林恵子, 網谷弘子, 吉井英一, 日本薬学会北陸支部第44例会, 富山。

4) 8,13-Diazagona-1,3,5(10)-trien-12-oneの合成とその立体化学: 小泉徹, 梁川由芳, 吉井英一, 山崎高應, 日本薬学会北陸支部第44例会, 富山。

5) Phosphoramidate類の酸触媒ソルボリシスの立体化学: 小林恵子, 小泉徹, 吉井英一, 日本薬学会北陸支部第45例会, 金沢。

## 3. 刊行論文・著書等

1) Yoshii, E., Oribe, T., Koizumi, T., Hayashi, I. and Tumura, K.: Studies on the synthesis of cardiotonic steroids III. New and effective route to bufadienolide. Chem. Pharm. Bull. **25**: 2249-2256 (1977).

2) Yoshii, E., Koizumi, T., Hayashi, I. and Hiroj Y.: Selective reduction of conjugated enones and dienones with trialkylsilane and titanium tetrachloride. Chem. Pharm. Bull. **25**: 1468-1470, (1977).

3) Koizumi, T., Takeda, K., Yoshida, Y. and Yoshii, E.: The use of phase-transfer catalysis in the reissert reaction. Synthesis 497-498(1977).

4) Koizumi, T., Watanabe, Y., Yoshida, Y., Takeda, K. and Yoshii, E.: The hydrolysis of heteroatom containing benzophospholes. Tetrahedron Letters 1913-1916 (1977).

5) 小林恵子, 小泉徹, 吉井英一: モノ置換 diphenylphosphinamide類のアルキル反応. 薬学雑誌 **97**: 1063-1065 (1977).

6) 久保喜一, 高桑徳太郎, 吉井英一, 北辻栄太郎, 森腰正弘: ジャコウの品質評価に関する研究. 薬学雑誌, 印刷中。