

hanced  $^3\text{H}$ -choline incorporation into cellular phospholipids by phloroglucinol derivatives from *Mallotus japonicus*. International Research Congress on Natural Products, The 32nd Annual Meeting of the American Society of Pharmacognosy, 1991, 7, Chicago, U.S.A.

- 8) 清水昌寿, 太田隆英, 有澤宗久, 越村三郎, 小田島肅夫: 分化誘導剤併用による化学・免疫療法の抗腫瘍効果増強について(II). 第50回日本癌学会総会, 1991, 9, 東京.
- 9) 清水岑夫, 長谷香織, 鶴見淑子, 松澤孝泰, 森田直賢, 関 太輔, 高橋省三, 諸橋正昭, 鳥居塚和生, 寺澤捷年: 薬湯料の効用に関する研究 (I) 皮膚病関連症状に対する効果. 日本生薬学会第38回年会, 1991, 9, 神戸.
- 10) 毛利哲郎, 千葉賢三, 山崎眞津美, 清水岑夫, 森田直賢, 鳥居塚和生: 淫羊藿脂溶性成分のPC12細胞活性化作用. 日本生薬学会第38回年会, 1991, 9, 神戸.
- 11) 林 利光, 岡村香奈, 森田直賢, 浅水哲也: *Scoparia dulcis* のケモタイプと生物活性ジテルペン, *scopadulcic acid B* の合成制御. 日本生薬学会第38回年会, 1991, 9, 神戸.
- 12) 友田輝夫, 有澤宗久, 越村三郎: ヒトヘモグロビンによる 2-アミノ-5-メチルフェノールの酸化反応とその生成物質の同定. 日本生化学会大会, 1991, 10, 東京.

#### ◆ その他

- 1) パラグアイ薬草の化学・薬学的研究プロジェクト・チーム: パラグアイ薬草写真集, 国際協力事業団編, 1991.
- 2) パラグアイ薬草の化学・薬学的研究プロジェクト・チーム: パラグアイ国研究協力(薬草の化学・薬学的研究)最終報告書, 国際協力事業団編, 1991.
- 3) 有澤宗久: 呉茱萸湯の脳循環改善作用物質に関する化学的研究. 和漢薬を含む生物活性天然物・バイオテクノロジー研究成果報告書(平成2年度受託研究 富山県), 1-5, 1991.

## 薬 用 資 源 学 (2)

教 授 小 泉 徹  
助 教 授 竹 内 義 雄  
助 手 荒 井 謙 次  
助 手 高 橋 たみ子

#### ◆ 原 著

- 1) Takeuchi Y., Nabetani M., Takagi K., Hagi T., and Koizumi T.: Synthetic Studies for Novel Structure of  $\alpha$ -Nitrogenously Functionalized  $\alpha$ -Fluorocarboxylic Acids. Part 1. The First Synthesis and Reactions of *N*-Protected  $\alpha$ -Fluoroglycines. J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1. 49-53, 1991.
- 2) Ojima J., Higuchi H., Sata Y., Yamamoto H., Koizumi T., Iyoda M., and Yamamoto G.: Synthesis and Properties of *N*-Cyano Derivatives of Trideca-, Pentadeca-, Heptadeca-, and Nonadecaazafulvenes. Chem. Lett. 507-510, 1991.
- 3) Takahashi T., Kotsubo H., and Koizumi T.: New Approach to Sugar Derivatives by Pummerer Reactions of Optically Active Sulfoxide and Sulfide having a 7-Oxabicyclo[2.2.1]heptane Ring System. J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1. 1667-1671, 1991.
- 4) Arai Y., Hayashi K., Matsui M., Koizumi T., Shiro M., Kuriyama K.: Synthesis and Asymmetric Diels-Alder Reaction of Dimethyl ('d-Isoborneol-10-sulphinyl')maleate: Novel Route to Key Intermediates for Synthesis of Some Carbocyclic Nucleosides and Terpenoids. J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1. 1709-1716, 1991.
- 5) Arai Y., Matsui M., Koizumi T., and Shiro M.: Powerful Dienophiles for Asymmetric Diels-Alder Reactions:  $\alpha$ -(2-*exo*-Hydroxy-10-bornylsulfinyl)-maleimides. J. Org. Chem. 56:1983-1985, 1991.
- 6) Ojima J., Higuchi H., Sata Y., Yamamoto H., Koizumi T., Iyoda M., and Yamamoto G.: Synthesis and Properties of *N*-Cyanodimethyltetrahydrotrideca-, -pentadeca-, -heptadeca-, and nonadecaazafulvenes, and Benzannelated *N*-Cyanotridecaazafulvene Derivatives. J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1. 2111-2120, 1991.
- 7) Takahashi T., Kotsubo H., and Koizumi T.: Enantioselective Synthesis of Carbocyclic Showdomycin Derivative via Asymmetric Diels-Alder Reaction of (S)-3-(2-Pyridylsulfinyl)acrylate. Tetrahedron: Asymmetry 2:1035-1040, 1991.

- 8) Takahashi T., Fujii A., Sugita J., Hagi T., Kitano K., Arai Y., Koizumi T., and Shiro M.: Asymmetric 1,3-Dipolar Cycloaddition of Chiral Sulphinylethenes with 1-Methyl-3-oxidopyridinium and Some Nitrones. *Tetrahedron: Asymmetry* **2**: 1379-1390, 1991.
  - 9) Arai Y., Kontani T., and Koizumi T.: A Novel Approach to Bicyclic Alkaloids Using a Tandem Diastereoselective Acyliminocyclization and Retro Diels-Alder Reaction Sequence. Synthesis of (+)-Indolizidine and (+)-Laburnine. *Chem. Lett.* 2135-2138, 1991.
  - 10) Arai Y., Kawanami S., and Koizumi T.: Novel Route to Some Biologically Important Compounds Starting with a Common Chiral, Bicyclic, Fused Lactone: Enantioselective Synthesis of (-)-Boschnialactone and Two Antibiotics. *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1*. 2969-2975, 1991.
  - 11) Takeuchi Y., Itoh N., Note H., Koizumi T., and Yamaguchi K.:  $\alpha$ -Cyano- $\alpha$ -fluorophenylacetic Acid (CFPA): A New Reagent for Determining Enantiomeric Excess That Gives Very Large  $^{19}\text{F}$  NMR  $\Delta\delta$  Values. *J. Am. Chem. Soc.* **113**: 6318-6320, 1991.
  - 12) Takeuchi Y., Takagi K., Nagata K., and Koizumi T.: Synthetic Studies for Novel Structure of  $\alpha$ -Nitrogenously Functionalized  $\alpha$ -Fluorocarboxylic Acids. II. Synthesis and Some Reactions of  $\alpha$ -Fluoro- $\alpha$ -nitrocarboxylic Ester and Carboxamide Derivatives. *Chem. Pharm. Bull.* **39**: 3120-3122, 1991.
- ◆ 総 説
- 1) Takeuchi Y.: Chemistry of Multifunctional Carbon Compounds. I. Synthetic Studies and Some Reactions of Multifunctional Carbon Compounds. *Rev. Heteroatom Chem.* **4**: 64-77, 1991.
  - 2) Koizumi T.: Sulfinylethenes, Versatile Molecules, for the Chiral Synthesis of Bio-active Compounds. Phosphorus, Sulfur, and Silicon. **58**: 111-127, 1991.
  - 3) 荒井謙次: 新規光学活性  $\alpha$ ,  $\beta$ -不飽和スルホキシド類の合成と不斉付加反応への展開, 薬学研究所の進歩, **7**: 74-86, 1991.
- ◆ 学会報告
- 1) 高橋たみ子, 小泉 徹: 新規カルコゲン化合物の分子設計と不斉ディールス・アルダー反応, 日本薬学会第111年会, 1991, 3, 八王子.
  - 2) 小坪弘典, 高橋たみ子, 小泉 徹: (Pyridylsulfinyl) acrylate の不斉 Diels-Alder 反応を利用する擬似  $\alpha$ -L-allofuranose 誘導体及び炭素環 C-nucleoside 誘導体の合成. 日本薬学会第111年会, 1991, 3, 八王子.
  - 3) 紺谷 徹, 荒井謙次, 小泉 徹: 不斉ディールス・アルダー反応を活用する (+)-トラキランタミジンの合成. 日本薬学会第111年会, 1991, 3, 八王子.
  - 4) 河南三郎, 荒井謙次, 小泉 徹: 不斉ディールス・アルダー反応を活用する TXA<sub>2</sub> アントゴニスト類の合成. 日本薬学会第111年会, 1991, 3, 八王子.
  - 5) 金田有弘, 川原俊一, 竹内義雄, 小泉 徹: 多重官能性炭素構造を有する新規化合物の化学 15. 三級フッ化物の一般的合成ルートの開発研究. 日本薬学会第111年会, 1991, 3, 八王子.
  - 6) 伊藤典明, 佐藤俊広, 竹内義雄, 小泉 徹: 多重官能性炭素構造を有する新規化合物の化学 16. 新規光学純度決定試薬 CFPA 類の開発研究. 日本薬学会第111年会, 1991, 3, 八王子.
  - 7) Takeuchi Y.: General Synthetic Routes to Tertiary Alkyl Fluorides, 7th Regular Meeting of Japanese-Soviet Fluorine Chemists, 1991, 5, Fukuoka.
  - 8) Takeuchi Y., Kanada A., Kawahara S., and Koizumi T.: Synthetic Studies of Some Useful Building Blocks for Preparation of the Novel Tertiary Alkyl Fluorides. 13th International Symposium on Fluorine Chemistry, 1991, 9, Bochum.
  - 9) 荒井謙次, 紺谷 徹, 藤井昭仁, 小泉 徹: ビシクロ [2.2.1] ヘプタン縮環系の立体制御による高選択的アシルイミノ付加反応: アルカロイドのキラル合成への応用. 第33回天然有機化合物討論会, 1991, 10, 大阪.
  - 10) 竹内義雄, 川原俊一, 金田有弘, 小泉 徹: 三級フッ化物の一般的合成法の開発. 第16回フッ素化学討論会, 1991, 10, 名古屋.
  - 11) 高橋たみ子, 小坪弘典, 小泉 徹: (S)-3-(2-ピリジルスルフィニル)アクリルレートの不斉ディールス・アルダー反応を利用する新規炭素環 C-ヌクレオシドのエナンチオ選択的合成. 第18回核酸化学シンポジウム, 1991, 10, 仙台.
  - 12) 竹内義雄, 伊藤典明, 佐藤俊広, 野手 宏, 小泉 徹: MTPA を凌ぐ光学純度決定試薬 CFPA の分子設計とその開発. 第17回反応と合成の進歩シンポジウム, 1991, 11, 福岡.
  - 13) 杉田 淳, 荒井謙次, 小泉 徹: ヨウ化サマリウム(II)を用いるイソキサゾリン誘導体の N-O

結合の簡便な切断法。第85回日本薬学会北陸支部例会, 1991, 11, 金沢。

- 14) 川原俊一, 関 陽子, 竹内義雄, 小泉 徹:  $\beta$ -フルオロアルコール類を経由した2級及び3級モノフルオロアルカン類の合成検討。第85回日本薬学会北陸支部例会, 1991, 11, 金沢。
- 15) 野島浩史, 田中克尚, 木村郁子, 小泉 徹, 木村正康: 脱分極遮断薬のSuChから展開したPMBA系化合物によるACh受容体脱感作性神経筋遮断作用。日本薬学会第1回医薬化学薬化学部会年会, 1991, 12, 岡山。

#### ◆ そ の 他

- 1) 竹内義雄: 含フッ素多重官能性炭素化合物の合成と応用。1991有機合成相模セミナー, 1991, 7, 相模原。
- 2) 藤井昭仁, 荒井謙次, 小泉 徹: 光学活性5-置換-2-ピロリドン誘導体の新合成法の開発。第26回有機反応若手の会, 1991, 7, 福井。
- 3) 小泉 徹: スルフィニルエテン型キラルジエノフィルの分子設計と生物活性物質のキラル合成への展開。第26回有機反応若手の会, 1991, 7, 福井。
- 4) 杉田 淳, 荒井謙次, 小泉 徹: ヨウ化サマリウム(II)を用いたイソキサゾリジン誘導体のN-O結合の簡便な切断法。有機合成化学北陸セミナー, 1991, 9, 富山。
- 5) 河南三郎, 荒井謙次, 小泉 徹: 光学活性セレンキシドの新合成法の開発。有機合成化学北陸セミナー, 1991, 9, 富山。
- 6) 荒井謙次, 紺谷 徹, 小泉 徹: 光学活性N-Silylated  $\alpha$ -(sulfinyl)maleimideの合成。有機合成化学北陸セミナー, 1991, 9, 富山。
- 7) 藤井昭仁, 荒井謙次, 小泉 徹: 光学活性5-置換ピロリドン誘導体の新合成法の開発。有機合成化学北陸セミナー, 1991, 9, 富山。
- 8) 川原俊一, 関 陽子, 竹内義雄, 小泉 徹:  $\beta$ -フルオロアルコール類からフルオロアルカン類への変換反応の検討。有機合成化学北陸セミナー, 1991, 9, 富山。
- 9) 伊藤典明, 竹内義雄, 小泉 徹: 新規光学純度決定試薬CFPAの合成とその有用性の研究。有機合成化学北陸セミナー, 1991, 9, 富山。

## 薬 剤 設 計 学 (1)

教 授 上 野 雅 晴  
助 教 授 吉 川 広 之  
助 手 柏 木 寛  
支部技官 松 本 千 香

#### ◆ 著 書

- 1) 吉川広之, 村西昌三: 界面活性剤の効果。薬物の消化管吸収および癌化学療法における界面活性物質の応用。「バイオサーフェクタント」安田寛基他編, 409-419, サイエンスフォーラム, 東京, 1990。
- 2) 吉川広之, 村西昌三: リンパ管系移行。「最新生物薬剤学」栗津莊司, 小泉 保, 共編, 90-98, 南江堂, 東京, 1991。

#### ◆ 原 著

- 1) Ueno M., and Akechi Y.: Morphological Transformation of Solubilization Process of Large Unilamellar Vesicle by a Nonionic Detergent, Octyl Glucoside. Chem.Lett.:1801-1804, 1991.
- 2) Ueno M., Yoshida S., and Horikoshi I.: Characteristics of the Membrane Permeability of Temperature-Sensitive Liposome. Bull. Chem. Soc. Jpn. 64:1588-1593, 1991.
- 3) Mizuma T., Komori M., Ueno M., and Horikoshi I.: Sulphate Conjugation Enhances Reversible Binding of Drug to Human Serum Albumin. J. Pharma. Pharmacol. 43: 446-448, 1991.
- 4) Adachi I., Murase A., Ueno M., and Horikoshi I.: Study on the Cupric Phenanthroline-Induced  $\beta$ -Glucuronidase Release in Saponin-Permeabilized Polymorphonuclear Leukocytes. Chem. Pharm. Bull. 39: 2395-2399, 1991.
- 5) 金本郁男, 鄭 年 新, 上野雅晴, 小泉 保, 足立伊佐雄, 堀越 勇: ウサギに3種類の座剤を投与した際のモルヒネの体内動態。臨床薬理 22: 489-496, 1991。
- 6) 上野雅晴, 鄧 一 愚, 小野敦央, 堀越 勇: 温度感受性リポソームを用いた肝癌化学塞栓療法の基礎的検討—動物実験—。癌と化学療法 18: 2183-2185, 1991。
- 7) 刘 紅星, 足立伊佐雄, 堀越 勇, 上野雅晴: 牛乳脂肪球被膜物質による薬物の消化管吸収促進作用。薬誌 111: 510-514, 1991。
- 8) 山田 明, 藤巻雅夫, 上野雅晴: ペプロマイシン封入W/O/W型リピドールエマルジョンに