

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 高 橋 たみ子

◆ 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合成と応用研究

◆ 原 著

- 1) Kakuda H., Suzuki T., Takeuchi Y., and Shiro M. : X-Ray Crystallographic Structure Determination of Some Unique Chiral Sultam Derivatives. *J. Chem. Soc., Chem. Commun.*, 85-86, 1997.
- 2) Takeuchi Y., Satoh A., Suzuki T., Kameda A., Dohrin M., Satoh T., Koizumi T., and Kirk K. L. : Enantioselective Fluorination of Organic Molecules. I. Synthetic Studies of the Agents for Electrophilic, Enantioselective Fluorination of Carbanions. *Chem. Pharm. Bull.*, 45:1085-1088 1997.
- 3) Shibata N., Katoh, T., and Terashima, S. : An Expedient Synthesis of (2*R*,3*S*)-3-*tert*-Butoxycarbonylamino-1-isobutylamino-4-phenyl-2-butanol, A Key Building Block of HIV Protease Inhibitors. *Tetrahedron Lett.*, 38:619-620 1997.
- 4) Shibata N., Matsugi M., Kawano, K., Fukui, S., Fujimori C., Gotanda K., Murata K., and Kita Y. : Highly Asymmetric Pummerer-type Reaction Induced by Ethoxyvinyl Esters. *Tetrahedron: Asymmetry*, 8:303-310, 1997.
- 5) Shibata N., Baldwin J. E., and Wood M. E. : Resin-bound Peptide Libraries Showing Specific Metal Ion Binding. *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, 7:413-416, 1997.
- 6) Kita Y., Shibata N., Fukui S., Bando M., and Fujita S. : Enantioselective Pummerer-type Rearrangement by Reaction of *O*-Silylated Ketene Acetals with Enantiopure α -Substituted Sulfoxides. *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1*, 1763-1767, 1997.
- 7) Roach P. L., Clifton I. J., Hensgens C. M. H., Shibata N., Schofield C. J., and Baldwin J. E. : Structure of Isopenicillin N

Synthase Complexed with Substrate and the Mechanism of Penicillin Formation. *Nature (London)*, 387 (June):827-830, 1997.

- 8) Zhang J., Takahashi T., and Koizumi T. : Optically Pure Alkoxychlorosulfuranes. Synthesis and Transformation to Chiral Sulfoxides, *N-p*-Tosylsulfilimines, and Sulfonium Ylides. *Heterocycles*, 44:325-339, 1997.
- 9) Zhang J., Saito S., Takahashi T., and Koizumi T. : Synthesis of Cyclic Halooxatelluranes *via* Dehalogenation of α -Halo Carbonyl Compounds with Tellurides Containing Hydroxy Group on Side Chain. *Heterocycles*, 45:575-584, 1997.
- 10) Kurose N., Takahashi T., and Koizumi T. : Asymmetric [2,3] Sigmatropic Rearrangement of Chiral Allylic Selenonium Ylides. *J. Org. Chem.*, 62:4562-4563, 1997.
- 11) Kurose N., Takahashi T., and Koizumi, T. : First Synthesis of Optically Pure Selenuranes and Stereoselective Alkaline Hydrolysis. Their Application to Asymmetric [2,3] Sigmatropic Rearrangement of Allylic Selenoxides. *Tetrahedron*, 53:12115-12129, 1997.
- 12) Takahashi T., Nakao N., and Koizumi T. : Enantioface-differentiating Protonation with Chiral γ -Hydroxyselenoxides. *Tetrahedron: Asymmetry*, 8:3293-3308, 1997.

◆ 総 説

- 1) 竹内義雄 : 多重官能性炭素化合物の合成と反応. *有機合成化学協会誌* 55:886-896, 1997.

◆ 学会報告

- 1) Takeuchi Y., Konishi M., Hori H., and Kometani T. : Enzymatic Resolution of Esters of CFPA Analogs for Chiral Derivatizing Agents. ACS 13th Winter Fluorine Conference, 1997, 1, St. Petersburg, Florida.
- 2) 柴田哲男, 加藤 正, 寺島孜郎 : 抗HIV活性物質VX-478鍵中間体の合成研究 : 光学活性ヒドロキシエチルアミン誘導体の立体選択的合成. 日本薬学会第117年会, 1997, 3, 東京.
- 3) 山田飛鳥, 関 香織, 高橋たみ子, 竹内義雄 : 含フッ素擬似ペプチド類の合成研究. 2. 日本薬学会第117年会, 1997, 3, 東京.
- 4) 亀崎 誠, 山田飛鳥, 高橋たみ子, 竹内義雄 : 含フッ素ペプチド類縁体の合成研究. 1. 日本薬学会第117年会, 1997, 3, 東京.

- 5) 柴田哲男, 松儀真人, 五反田建徳, 村田健司, 北 泰行: エトキシビニルエステルを用いた高エナンチオ選択的不斉プメラ型反応: 硫黄原子上キラリティーの α 炭素への効率的転位. 日本薬学会第117年会, 1997, 3, 東京.
- 6) 佐藤 朗, 亀田彩子, 竹内義雄: 立体選択的フッ素化試薬の開発研究. 6. 日本薬学会第117年会, 1997, 3, 東京.
- 7) 高橋たみ子, 山村祐加, 竹内義雄: 光電子移動反応を利用する環状アミンの合成研究. 日本薬学会第117年会, 1997, 3, 東京.
- 8) 角田広子, 鈴木孝則, 竹内義雄, 城 始勇: キラルスルタム化合物の構造解析. 日本薬学会第117年会, 1997, 3, 東京.
- 9) 張 健, 斎藤慎一, 高橋たみ子, 小泉 徹: α -ハロカルボニル化合物の脱ハロゲン化反応を利用したハロオキサテルランの合成. 日本薬学会第117年会, 1997, 3, 東京.
- 10) 亀崎 誠, 柴田哲男, 竹内義雄: α -フルオログリシン含有ジペプチドの合成研究: 重要中間体アミノ酸アミドの改良合成. 日本薬学会北陸支部第96回例会, 1997, 6, 金沢.
- 11) Kometani T., Isobe T., Goto M., and Takeuchi Y. : Enzymatic Resolution of 2-Fluoro-2-Arylacetic Acid Derivatives. 15th International Symposium on Fluorine Chemistry, 1997, 8, Vancouver.
- 12) Suzuki T., Shibata N., Satoh, A., and Takeuchi Y. : The Firast Highly Enantioselective Fluorinating Agents; Chiral, Non-racemic *N*-Fluorosultams. 15th International Symposium on Fluorine Chemistry, 1997, 8, Vancouver.
- 13) Satoh A., Shibata N., and Takeuchi Y. : A Novel Synthesis of *N*-Fluorosultam Derivatives. 15th International Symposium on Fluorine Chemistry, 1997, 8, Vancouver.
- 14) Kamezaki M., Shibata N., and Takeuchi Y. : The First Synthesis of the α -Fluoroglycine-containing Peptides. 15th International Symposium on Fluorine Chemistry, 1997, 8, Vancouver.
- 15) 鈴木孝則, 柴田哲男, 佐藤 朗, 竹内義雄: 高選択的不斉フッ素化試薬・光学活性*N*-フルオロスルタムの開発. 第21回フッ素化学討論会, 1997, 10, 札幌.
- 16) 小西 幸, 高橋たみ子, 福島亜希, 竹内義雄, 米谷 正: CFTAを用いるキラル誘導化法と絶対構造決定法への応用研究. 第21回フッ素化学討論会, 1997, 10, 札幌.
- 17) 鈴木孝則, 柴田哲男, 佐藤 朗, 竹内義雄: これまでの常識を破った不斉フッ素化剤 CMIT-F. モレキュラーキラリティー1997, 1997, 10, 名古屋.
- 18) Takeuchi Y., Konishi M., Fukushima A., Kometani T., and Takahashi T. : CFTA, a New Efficient Agent for Ee Determination of Chiral Molecules. 9th International Symposium on Chiral Discrimination, 1997, 10, Nagoya.
- 19) 高橋たみ子, 小西 幸, 福島亜希, 竹内義雄, 米谷 正: 高性能キラル誘導化試薬CFTAの簡易合成法の開発と絶対構造決定法への応用の試み. 第72回有機合成シンポジウム, 1997, 10, 東京.
- 20) 桐原清敏, 亀崎 誠, 柴田哲男, 竹内義雄: α -フルオログリシン含有ペプチドの合成研究: 配座を固定した架橋ペプチド類の設計と合成. 日本薬学会北陸支部第97回例会, 1997, 11, 富山.
- 21) Takeuchi Y., Kirihara K., Kamezaki M., and Shibata N.: Design and Synthesis of Conformationally Constrained Dipeptides Containing the α -Fluoroglycine Residue. 1st International Peptide Symposium, 1997, 11-12, Kyoto.