

【目的】天然のL- α -アミノ酸の α 位の水素をアルキル基で置換したものは、 α,α -ジ置換アミノ酸と呼ばれており、天然のL- α -アミノ酸にはない特徴を有する。今回、 α 位にフッ素を導入したアルキル基を有する光学活性な α,α -ジ置換アミノ酸を導入したアミノ酸を合成し、ペプチド中に導入することでペプチドの機能化を目指した。

【方法】 α -トリフルオロメチルアミノ酸をラセミ体で合成し、その後に光学分割するアプローチを計画した。そして α -CF₃-ジ置換アミノ酸をロイシンペプチド中へ導入して得られるペプチドの二次構造解析を行うことで、 α -CF₃-ジ置換アミノ酸がペプチド全体へ与える影響を調べた。

【結果】入手容易な出発原料から、種々のラセミ体 α -トリフルオロメチルアミノ酸を3工程で合成することができた。合成したラセミ体の光学分割は(*R*)-BINOLエステルへと誘導化することで達成し、光学純度の高いアミノ酸を得ることができた。この光学活性体をペプチド中に導入することで、ペプチドの二次構造に関する様々な情報を得ることができ、今後機能性ペプチドのデザインに応用することが期待される。

フッ素導入ジ置換アミノ酸含有ペプチド

