

&lt; 受賞者 &gt;

**美多 剛** 北海道大学化学反応創成研究拠点 (WPI-ICReDD) 特任准教授

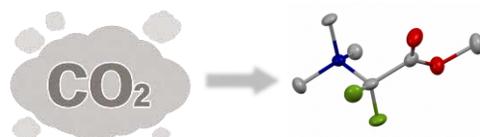
&lt; 功績名 &gt;

# 二酸化炭素ガスを原料としたアミノ酸の化学合成

 環境汚染物質である二酸化炭素を炭素資源として、 $\alpha$ -アミノ酸の化学合成に成功しました。

## 背景

二酸化炭素ガス ( $\text{CO}_2$ ) は廃棄物として地球上に豊富に存在することから、化石資源 (石油等) に代わる魅力的な炭素資源です。北海道は冬の寒さが厳しく、かつ車社会であるため、エネルギー消費に伴い  $\text{CO}_2$  を多く排出しています。そのため、 $\text{CO}_2$  を用いて人類の繁栄に必要な有機化合物の化学合成法の開発が求められていました。

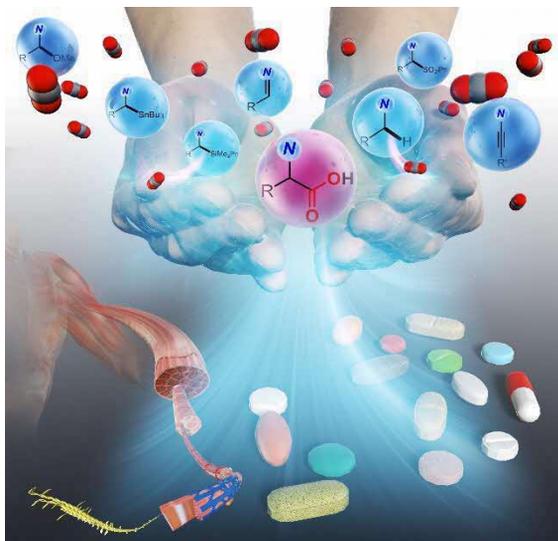


フルオロアミノ酸

## 研究内容

### 【 $\alpha$ -アミノ酸の化学合成】

$\alpha$ -アミノ酸は生命を形作るペプチドやタンパク質の構成単位であるとともに、栄養補助剤、食品添加物などにも含まれており、我々の生活に必要な不可欠な有機化合物です。自然界に存在する天然型  $\alpha$ -アミノ酸は安価な発酵法により合成されていますが、非天然型  $\alpha$ -アミノ酸は、主に化学合成によって提供されています。非天然型  $\alpha$ -アミノ酸が導入されたペプチド医薬品は、天然のペプチドには見られない新たな生物活性が期待されるため、入手可能な原料を用いた非天然型  $\alpha$ -アミノ酸の合成研究は現在でも活発に行われています。受賞者は、環境汚染物質である  $\text{CO}_2$  を用いた多種多様な非天然型  $\alpha$ -アミノ酸の化学合成に成功しました。


 【 $\text{CO}_2$ からの $\alpha$ -アミノ酸合成】

### 【計算科学が先導したフルオロアミノ酸の化学合成】

次に、非天然型  $\alpha$ -アミノ酸のなかでもフッ素原子が導入されたフルオロアミノ酸の化学合成を目指しました。フッ素原子を有機化合物の骨格に導入することで代謝安定性の向上に伴う体内動態の改善や生物活性の増強などの効果が見込まれます。したがって、フルオロアミノ酸をペプチド医薬品に組み込むことにより、効果の改善および増強が期待できます。しかし、フルオロアミノ酸の中でも最も単純なジフルオログリシン ( $\text{NH}_2\text{-CF}_2\text{-CO}_2\text{H}$ : グリシンの生物学的等価体) に関しては、これまで効率的な合成法が存在しませんでした。2018年10月に北海道大学に設立された化学反応創成研究拠点 (WPI-ICReDD) で量子化学計算を用いてジフルオログリシンの合成経路を予測したところ、 $\text{CO}_2$  を用いる合成経路が提案されました。それに従い合成化学実験を行うことで、その誘導体をわずか二か月で化学合成しました。



【計算予測によるフルオロアミノ酸合成】