

Automne 2014  
**Conférence**  
 au Département de chimie  
 présentée conjointement avec  
**PROTEO**

CONFÉRENCIER

DATE

**PROF. THIERRY BRIGAUD**

Laboratoire de chimie biologique  
 Université de Cergy-Pontoise, Neuville-sur-Oise, France

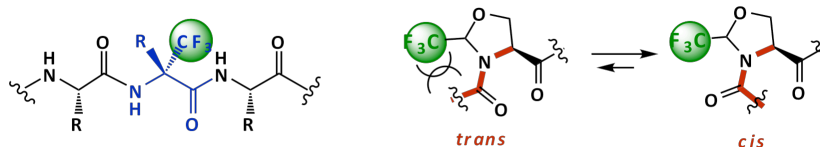
Mercredi, 5 novembre 2014

TITRE

## Des aminoacides fluorés chiraux aux peptides fluorés : Synthèse et applications biologiques

RÉSUMÉ

L'incorporation d'acides aminés non naturels fluorés dans des peptides est susceptible de moduler de façon significative leurs propriétés physico-chimiques et biologiques (hydrophobie, contrôle de la conformation, résistance aux protéases...). Afin d'accéder à ces types de peptides originaux, nous avons développé des méthodes synthétiques efficaces, à partir d'oxazolidines fluorées (Fox), pour la préparation d' $\alpha$ - et de  $\beta$ -aminoacides trifluorométhylés sous forme énantiopure (CF<sub>3</sub>-alanine, allylglycine, sérine, proline, acide aspartique, acide pyroglutamique)<sup>1</sup>. Malgré la forte désactivation de l'atome d'azote des  $\alpha$ -aminoacides  $\alpha$ -trifluorométhylés ( $\alpha$ -TfmAAs) nous avons réussi à incorporer ces aminoacides dans des chaînes peptidiques.<sup>2</sup> Quelques applications biologiques de ces peptides seront présentées (peptides analgésiques, peptides antimicrobiens...).<sup>3</sup> Les oxazolidines trifluorométhylées dérivées de la sérine constituent, par ailleurs, des pseudoprolines stables qui, une fois incorporées dans des peptides permettent de contrôler leur conformation.<sup>4</sup>



- (1) *J. Org. Chem.* **2006**, 71, 7075-7078. *Org. Lett.* **2006**, 8, 6123-6126. *J. Org. Chem.* **2006**, 71, 2159-2162. *Tetrahedron : Asymmetry* **2011**, 22, 309-314. *J. Fluorine Chem.* **2008**, 129, 1104-1109. *Org. Lett.* **2009**, 11, 209-212.  
 (2) *Eur. J. Org. Chem.* **2009**, 33, 5717-5724.  
 (3) *Eur. J. Med. Chem.* **2013**, 62, 122-129.  
 (4) *J. Org. Chem.* **2010**, 75, 4135-4145. *J. Phys. Chem. B* **2012**, 116, 4069-4079. *New J. Chem.* **2013**, 37, 1336-1342. *J. Org. Chem.* **2013**, 78, 10144-10153.

La conférence aura lieu à 11h au VCH-3850 du Pav. A.-Vachon  
 Cordiale invitation à toutes et à tous !

Hôte : Prof. Jean-François Paquin  
 Tél.: 418 656-11430 - Courriel : jean-francois.paquin@chm.ulaval.ca  
 Responsable des conférences A-2014 : Prof. John Boukouvalas  
 Tél.: 418 656-5473 - Courriel : john.boukouvalas@chm.ulaval.ca



UNIVERSITÉ  
**LAVAL**

Faculté des sciences et de génie  
 Département de chimie