

## 2,2,3,3,3-Pentafluoropropylamine

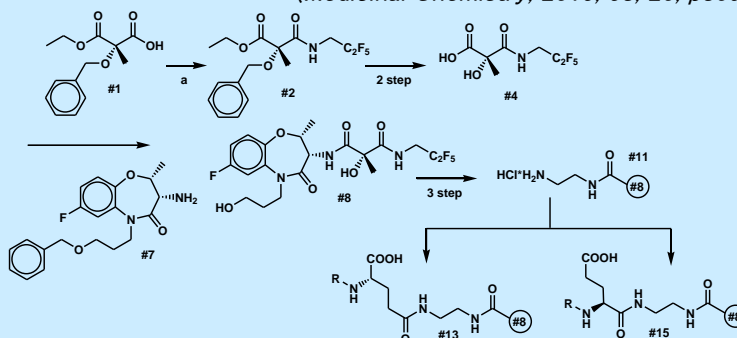
2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピルアミン



Purity	97%
CAS Number	422-03-7
Molecular Formula	C <sub>3</sub> H <sub>4</sub> F <sub>5</sub> N
Molecular Weight	149.06

3. 腎疾患の治療にたんぱく分解酵素で活性化されるノッチングナリング制御が期待されている。細胞膜中のたんぱく分解酵素  $\gamma$ -セクレターゼに結合するプロドラッグを合成。 $\gamma$ -セクレターゼは広く分布している膜活性化酵素なので、肝臓や血清よりも腎臓への比濃縮効果をデザインし、アリストロキア酸で傷ついた腎の炎症鎮静効果を認めた(抗体染色法)。

(*Medicinal Chemistry, 2015, 58, 20, p8097-8109.*)



a; C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, HOBt, EDCI, iPr<sub>2</sub>NEt, in THF, #13a, 15a; R=Ac, #13b, 15b; R=H

表-1;  $\gamma$ -セクレターゼの阻害剤、プロドラッグの IC<sub>50</sub> 値

化合物 No.	機能略号	IC <sub>50</sub> (nM) *1
#8	SecrI (secrease inhibitor)	4.4+/-1.6
#11	Amine-SecrI	45.6+/-10.2
#13a	Ac- $\gamma$ -Glu-SecrI	2882+/-539
#13b	H- $\gamma$ -Glu-SecrI	1087+/-347
#15a	Ac- $\alpha$ -Glu-SecrI	625+/-234
#15b	H- $\alpha$ -Glu-SecrI	258+/-45

\*1; DR215/F2 reporter cell line for Notch activation by  $\gamma$ -secretase

表-2; プロドラッグの臓器間分布

投与化合物	腎臓(ng/g)	肝臓(ng/g)
11+AA	#11; 1836	#11; 1246
	#8; 11	#8; 100
13a	#13a; 11	#13a; 19
	#11; 124	#11; BQL
13a +AA	#13a; 23	#13a; 155
	#11; 84	#11; 39

BQL; 検出限界以下, AA; Aristolonic Acid, kidney poison

### Properties:

Appearance Liquid

Boiling point, °C 49-50