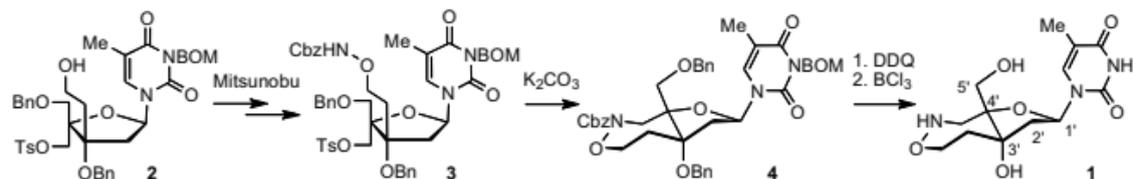


26H-pm07

3- オキサ -4- アザペンチレン架橋構造を有する新しい *trans*-3',4'-BNA の設計と合成
○ 兒玉 哲也¹, 菅谷 建作¹, 馬場 武¹, 今西 武¹, 小比賀 聡¹(¹阪大院薬)

【目的】核酸糖部立体配座を適切に固定化した人工核酸は、相補鎖 DNA や RNA との優れた二重鎖形成能を有する。このことは核酸医薬品や遺伝子診断薬に適用可能な高機能性素材を開発する上で有用な手段となる。我々は相補鎖 DNA との高い結合親和性を有する人工核酸の創製を目指し、核酸糖部立体配座の S 型固定化に関する研究を重ねており、最近、糖部 3',4'位間を架橋した 2'-deoxy-*trans*-3',4'-BNA が DNA と同様の高い DNA 選択性と熱的安定性を兼ね備えた二重鎖形成能を示すことを報告した。¹⁾ 今回、より優れた S 型人工核酸の開発を目指して設計した 3-オキサ-4-アザペンチレン架橋を有する新しい *trans*-3',4'-BNA **1** を合成する。

【実験・結果】チミジンから合成した化合物 **2** は光延反応を経て化合物 **3** へと誘導した。続いて、**3** を DMF 中炭酸カリウムで処理することで分子内 7 員環状求核置換反応に付し、効率的に 3-オキサ-4-アザペンチレン架橋構造を有する *trans*-3',4'-BNA の保護体 **4** を得ることに成功した。最後に、DDQ 処理とそれに続く三塩化ホウ素処理によりすべての保護基を除去することで、目的の *trans*-3',4'-BNA **1** の合成に成功した。²⁾



1) T. Kodama, K. Sugaya, Y. Harada, Y. Mitsuoka, T. Imanishi, and S. Obika, *Heterocycles*, 2009, **77**, in press, 2) T. Kodama, K. Sugaya, T. Baba, T. Imanishi, and S. Obika, *Heterocycles*, 2009, **79**, in press.