

28P-pm386

リボースと C4- イミダゾール間に C1 スペーサーを持つホスホロアミダイトの合成研究

○藤井 健介¹, 荒木 理佐¹, 春沢 信哉¹ (¹大阪薬大)

【目的】

リボザイムは酵素に匹敵する触媒作用を持つが、その反応機構の詳細はほとんど解明されていない。自己切断型リボザイムの中で唯一 X 線構造解析のされていない VS リボザイムの切断-連結反応は、A756 と G638 の相互作用であることが最近報告された。我々は、イミダゾールが酸-塩基触媒であることに着目し、イミダゾールホスホロアミダイト **3a** (n=0) を用いて VS リボザイムの G638 をイミダゾールで置換したが、弱い切断活性しか示さなかった。一方、C₂-スペーサーをもつ **3b** (n=2) から合成したイミダゾール改変体では切断速度が 15 倍増加した。これは、メチレンスペーサーの調節でより効果的な RNA プロブの創製を可能にする重要な知見であった。そこで今回一連の ribose-(CH₂)_n-Im タイプのアミダイトを合成研究する中で C₁-スペーサーをもつ **3c** (n=1) の合成を検討した。

【実験・結果】

今回、アルデヒド **1** と TosMIC との反応で得られたイミダゾール中間体 **2** からメチレンスペーサーをもつ **3c** (n=1) の合成研究を行った。

