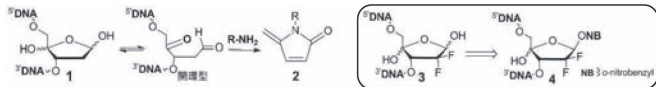


28M-pm18S

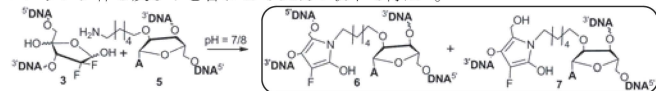
ジフルオロ基により活性化されたジカルボニル DNA によるピロール型アミン修飾反応

○楊 波¹, 麻生 真理子¹, 末宗 洋¹(九大院薬)

【目的】カルボニル基を導入した核酸は核酸塩基と反応し、還元操作を経て安定なクロスリンク体を形成することが報告されている¹⁾。この反応性を利用し、タンパク質や核酸の機能研究への応用が期待できる。当研究室では DNA の酸化損傷体の一つである **1** が中性条件下アミン分子と反応し、ラクタム体 **2** を形成することを見出した²⁾。そこで **1** の構造に化学修飾を行い、高いアミン反応性やクロスリンク形成能を持つ人工核酸創出することとした。今回、糖部 2 位にジフルオロ基を導入した ODN **3** を光分解性保護基 **NB** を導入した ODN **4** への照射により合成し。ODN **3** は還元剤を加えることなく、アミン分子と反応することを明らかにした。



【方法・結果】ODN **3** と **3** のアミン反応点に近接できるアルキルアミノ側鎖をもつ相補鎖 ODN **5** との反応を行った。還元剤を加えずに、pH 7 または 8 の条件下でクロスリンク体 **6** 及び **7** を合わせて 98% の収率で得た³⁾。



【文献】1) M. Manoharan *et al.*, *Org. Lett.*, **1999**, *1*, 311–314. 2) M. Aso *et al.*, *J. Am. Chem. Soc.*, **1999**, *121*, 9023. 3) B. Yang, Aso, M. Aso *et al.*, *Org. Lett.*, in press.