

# 架橋性 PNA オリゴマーの合成 Synthesis of cross-linking PNA oligomers

石澤悠樹・佐々木要・萩原伸也・永次 史(東北大多元研)

近年、遺伝子発現を制御するためにオリゴヌクレオチド (ODN) を用いる方法が盛んに研究されている。特に標的となる塩基と共有結合を形成する機能性核酸を導入したODNはその高い配列

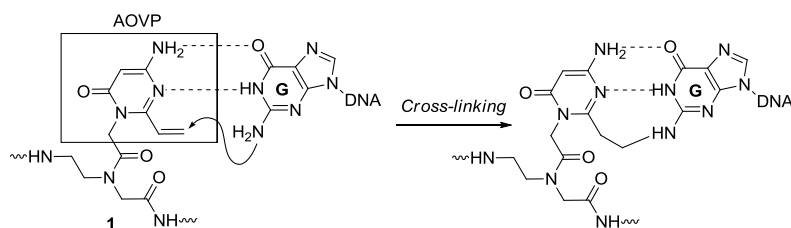
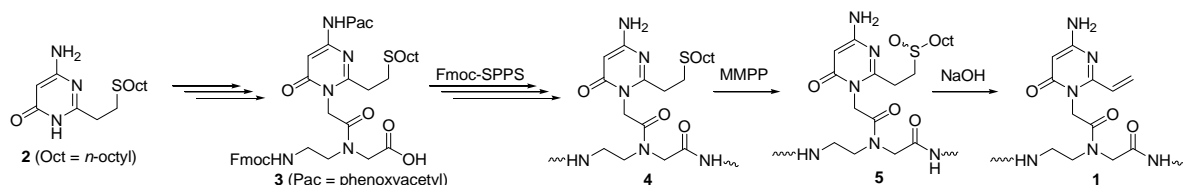


Fig. 1. クロスリンク反応の模式図

選択性から効果的に標的塩基とクロスリンク反応を行うことができ遺伝子発現制御が可能と期待されている。本研究室ではこれまでに反応点同士が近接することで光などの外部刺激なしにクロスリンク反応が進行する機能性核酸を報告している<sup>1</sup>。

本研究では、グアニン選択的架橋反応が期待される 4-アミノ-6-オキソ-2-ビニルピリミジン (AOVP) を導入したペプチド核酸 (PNA) オリゴマー (1) を設計した (Fig. 1)。骨格が 2-アミノエチルグリシンである PNA は、i) DNA あるいは RNA と非常に安定な錯体を形成し、ii) 生体環境において安定であり、iii) 合成が簡便で、iv) DNA 二重鎖にインバージョンするという特徴を有するため、アンチジーン、アンチセンス法への適用が可能と期待されている。これまでに、ピリミジン塩基 (2)<sup>2</sup> を PNA モノマー (3) へと誘導し、Fmoc 固相合成法により PNA オリゴマー (4) の合成に成功した。さらに酸化、引き続き塩基処理によりビニル体 (1) を合成した (Scheme 1)。現在合成した架橋性 PNA オリゴマー 1 の反応性および選択性について検討しており、その結果についても合わせて報告する。



Scheme 1. 固相法による PNA オリゴマーの合成およびビニル基の再生

## <参考文献>

- 1) For a recent review, see; Nagatsugi, F. Sasaki, S. *Bull. Chem. Soc. Jpn.* **2010**, 83, 744-755.
- 2) Hattori, K.; Hirohama, T.; Imoto, S.; Kusano, S.; Nagatsugi, F. *Chem. Commun.* **2009**, 42, 6463-6465.

## 発表者紹介

氏名 石澤 悠樹 (いしざわ ゆうき)  
所属 東北大学大学院理学研究科化学専攻  
学年 修士課程 2 年  
研究室 生命機能分子合成化学研究分野 (永次研究室)

