

## ボリン酸誘導体を用いたリボヌクレオシドの位置選択的官能基化反応

(東理大) ○大畠 京也・鶴崎 太樹・佐藤 一樹・和田 猛

Regioselective functionalization of ribonucleosides by using borinic acid derivatives (*Tokyo University of Science*) ○Kyoya Ohata, Taiki Tsurusaki, Kazuki Sato, Takeshi Wada

Chemically modified RNAs have attracted attention as an excellent modality of a nucleic acid medicine. However, since a ribonucleoside has two secondary 2' and 3' hydroxy groups which have similar reactivities, regioselective *O*-modifications typically require tedious multiple reactions. On the other hand, it has been recently reported in carbohydrate chemistry, that borinic acid derivatives selectively reacted with 1,2-*cis* diols to form ate complexes and enhanced the nucleophilicity of hydroxy groups. An efficient regioselective functionalization of hydroxy groups was achieved via reactions of the ate complexes with electrophiles. In this study, we apply this reaction to ribonucleoside derivatives to develop a regioselective functionalization method.

**Keywords** : borinic acid derivative; ribonucleoside; regioselective reaction; 2'-*O*-modified

化学修飾 RNA は、優れた核酸医薬のモダリティーとして注目されるが、RNA は 2' 位および 3' 位に反応性の似通った第 2 級水酸基を有しているため、異なる官能基化を行うためには煩雑な多段階反応を経由するか、低位置選択的な反応を行わざるを得ない。一方、近年、糖化学の分野で、ボリン酸誘導体が 1,2-シスジオールと選択的に架橋反応し、水酸基の求核性が極めて高いアート錯体を経由し、これを求電子剤と反応させることで効率的にエクアトリアル水酸基の官能基化が可能であることが報告された。そこで本研究では本反応をリボヌクレオシド誘導体に応用し、位置選択的な官能基化反応を目指した。その検討結果について報告する。

