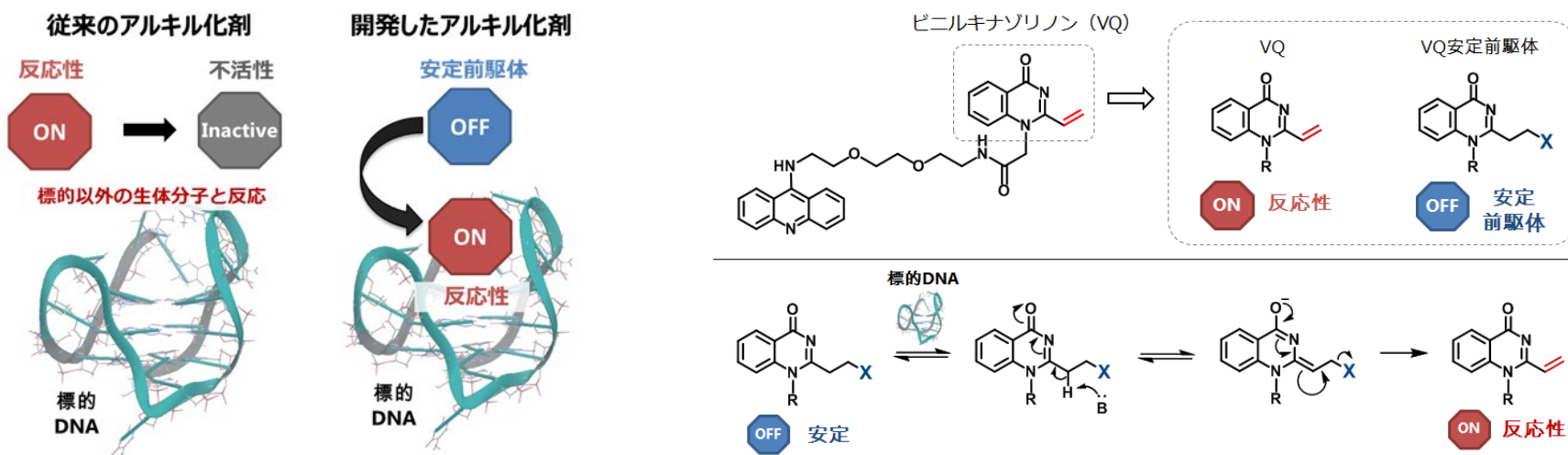


# 核酸高次構造を標的にした反応性OFF-ON型アルキル化剤の開発

(東北大・多元研) 鬼塚和光・Madoka E. Hazemi・佐藤憲大・辻 巖一郎・石川竣也・  
小澤眞美子・丹野宏亮・山田 研・永次 史

## Reactive OFF-ON type alkylating agents for higher-ordered structures of nucleic acids

Kazumitsu Onizuka, Madoka E. Hazemi, Norihiro Sato, Gen-ichiro Tsuji, Shunya Ishikawa,  
Mamiko Ozawa, Kousuke Tanno, Ken Yamada and Fumi Nagatsugi



本研究では、核酸高次構造選択的な化学修飾を目指し、通常は安定なOFFの状態が存在し、標的と結合したときに活性がONになり反応する反応性OFF-ON型核酸アルキル化剤の開発を試みた。その結果、一本鎖や二本鎖構造とは反応せず、G-4重鎖構造、T-Tミスマッチ構造、塩基欠損部位選択的に反応するアルキル化剤 (VQ) の開発に成功した。We attempted the reactive OFF-ON type alkylating agents, vinyl-quinazolinone (VQ) precursors. The stable VQ precursors conjugated with aminoacridine, which bind to the G-4 DNA, selectively reacted with a T base on the G-4 DNA in contrast to the single- and doublestrand DNA. Additionally, the VQ precursor reacted with the T or U base in the AP-site, G-4 RNA and T-T mismatch structures.