

## PivOM RNAアミダイト

2'-O-PivOM-5'-O-DMT-Adenosine (N-PAC) 3'-CEP

2'-O-PivOM-5'-O-DMT-Cytidine (N-Ac) 3'-CEP

2'-O-PivOM-5'-O-DMT-Guanosine (N-ipr-PAC) 3'-CEP

2'-O-PivOM-5'-O-DMT-Uridine 3'-CEP

### ハイスループットRNA合成のための2'-ピバロイルオキシメチル (PivOM)アミダイト：

ChemGenesでは、マイルドな条件で脱保護が可能な、RNA合成用の高品質の2'-O-PivOM-RNAアミダイト<sup>1-3</sup>を取り揃えています。これらは、ハイスループットにも適しています。治療薬用のオリゴヌクレオチドの生産のために少量からパルク（1グラム、10グラム、100グラム）まで高純度（図1、図2）のPivOMアミダイトをご提供いたします。

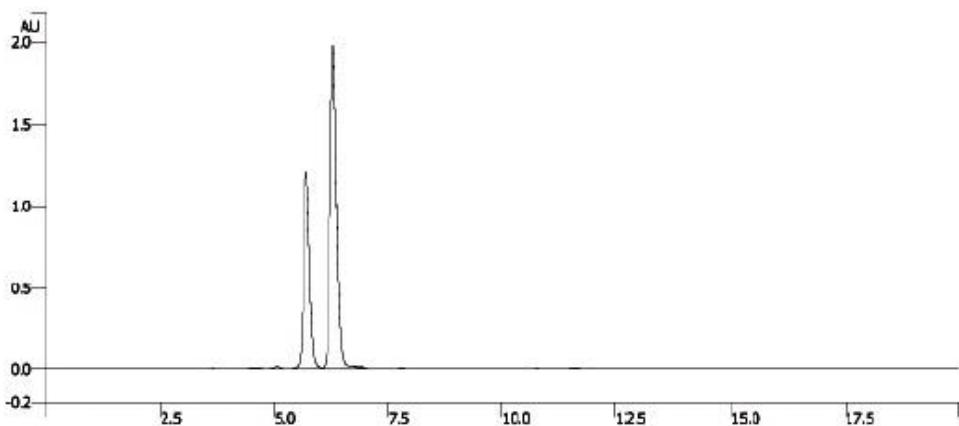


図1： 2'-O-PivOM-アデノシン (N-PAC)-5'-O-DMT-3'-アミダイトのHPLC; 純度: 98.74%.

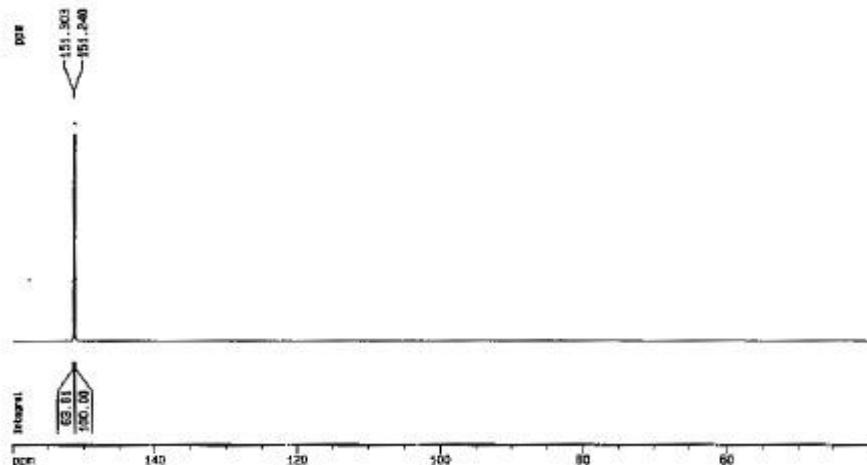


図2： 2'-O-PivOM-アデノシン (N-PAC)-5'-O-DMT-3'-アミダイトの<sup>31</sup>P-NMR; 純度: 100%.

これらのアミダイトは、非常に高いカプリング効率のため、高い収率と高い純度でRNAを合成することができます。（図3、4）

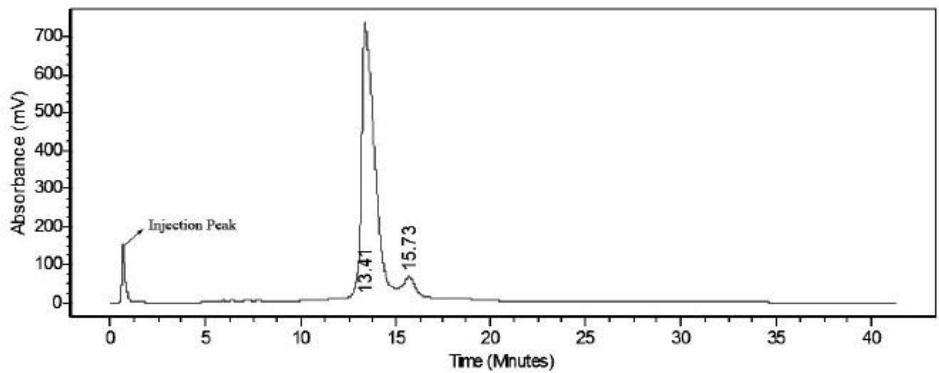


図3： PivOMアミダイトを用いて合成し、IE HPLCで精製した22-merの合成RNAのIE HPLC分析結果（純度は91.6%）

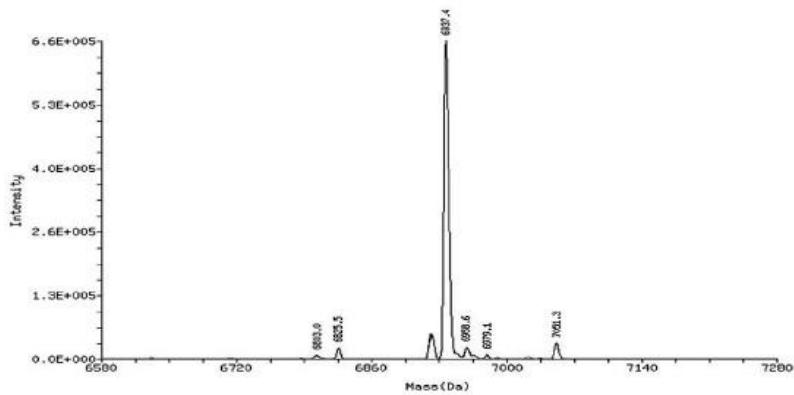


図4： PivOMアミダイトを用いて合成し、IE HPLCで精製した22-merの合成RNAのIE HPLC分析結果

理論値6937.2に対して、実測値6937.4

#### PivOM基の利点<sup>1-3</sup>：

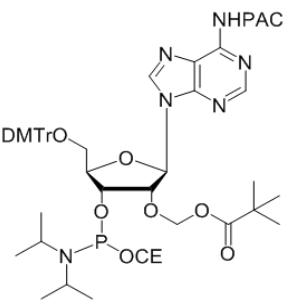
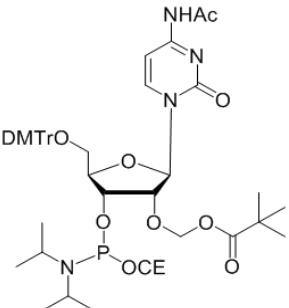
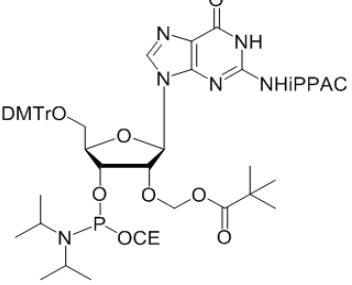
- ・ 2'-O-PivOM-RNAアミダイトは、アセトニトリル中で、また固相合成で安定です。
- ・ 2'-O-PivOM基のアセタールスペーサーは、オリゴヌクレオチドの合成中、隣接するアミダイトのエステル基の立体障害を最小限に抑えます。したがって、優れたカップリング効率を示します。
- ・ 穏やかな条件で脱保護できる保護基で保護された塩基、リン酸のシアノエチル基、塩基性で切断できるリンカーとの併用により、PivOM基は、DNAと同様に脱保護を行うことができます。
- ・ 塩基性で容易に除去できるPivOM基の利点は、一般的な塩基性脱保護条件で簡単に脱保護ができ、固体支持担体からの切り離しも行える点です。
- ・ PivOMアミダイトを用いて合成したRNAは、別の脱保護ステップも面倒な脱塩処理なども必要ありません。
- ・ PivOMアミダイトを用いたRNA合成は、長いカップリング時間を除いて基本的には標準的なRNA合成と同じ条件下で行われます。また、プリン塩基のトランスアセチレーションを避けるために、フェノキシ酢酸無水物をキャッピングに使用します。
- ・ PivOMアミダイトを使用したRNA合成は、DNA合成と同じくらいに便利で効率よく行うことができます。

## References:

1. Debart, F.; Vasseur, J.-J.; Lavergne, T. "Process for the solid phase synthesis of RNA" PCT Int. Appl. 2009, WO 2009144418 A1.
2. Lavergne, T.; Janin, M.; Dupouy, C.; Vasseur, J. -J.; Debart, F. "Chemical Synthesis of RNA with Base-Labile 2'-O-(Pivaloyloxymethyl)-Protected Ribonucleoside Phosphoramidites" Curr. Pro. in Nucle. Acid Chem. Unit Number: Unit 3.19, December, 2010.
3. Lavergne, T.; Bertrand, J.-R., Vasseur, J.-J.; Debart, F. "A base-labile group for 2'-OH protection of ribonucleosides: A major challenge for RNA synthesis" Chem. Eur. J. 2008, 14, 9135-9138.

## Licensing & Trademarks:

ChemGenes Corp. holds worldwide license Patent #2009144418, DEBART Francoise, VASSEUR Jean-Jacques, LAVERGNE Thomas, MONTPELLIER, France.

品名	商品コード	容量	概要	構造式
2'-O-PivOM-5'-O-DMT-Adenosine (N-PAC) 3'-CEP	ANP-3216	250 mg 500 mg 1 g 2 g 10 g	FW 1018.10  輸送上の注意 高温多湿に注意。速やかな輸送が好ましい。	
2'-O-PivOM-5'-O-DMT-Cytidine (N-Ac) 3'-CEP	ANP-3217	1 g 5 g 10 g 100 g	FW 901.98  輸送上の注意 高温多湿に注意。速やかな輸送が好ましい。	
2'-O-PivOM-5'-O-DMT-Guanosine (N-ipr-PAC) 3'-CEP	ANP-3218	250 mg 500 mg 1 g 2 g 10 g	FW 1076.18  輸送上の注意 高温多湿に注意。速やかな輸送が好ましい。	
2'-O-PivOM-5'-O-DMT-Uridine 3'-CEP	ANP-3219	250 mg 500 mg 1 g 2 g 10 g	FW 860.93  輸送上の注意 高温多湿に注意。速やかな輸送が好ましい。	