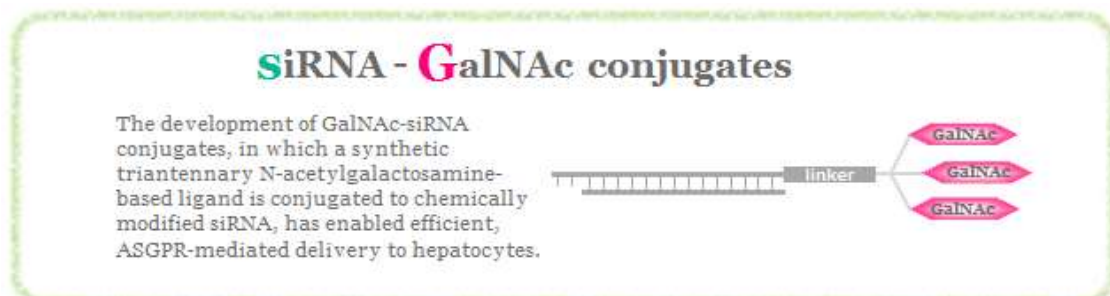


『オリゴヌクレオチドのデリバリー戦略』

GalNAc-siRNA-コンジュゲート 編



肝細胞は、アシアロ糖タンパク質受容体（ASGPR）とよばれるガラクトースを強く認識するレセプターを持つことが知られています。ASGPRは、タンパククリアランスに関わる受容体です。N-アセチルガラクトサミン（GalNAc）はガラクトースから誘導された単糖類なので、ASGPRと結合します。そのため、GalNAcとオリゴヌクレオチドとのコンジュゲートもASGPRから肝細胞へ取り込まれていきます。このシステムを利用した核酸医薬品は、今も数多く開発されています。

▶デリバリー戦略⑤

～GalNAc-siRNA-コンジュゲートで肝細胞へ～

N-アセチルガラクトサミン（GalNAc）をアシアロ糖タンパク質受容体（ASGPR）が肝細胞へ取り込むことを利用した、GalNAc-siRNA-コンジュゲートについて述べられた文献をご紹介します。このコンジュゲートは効率よく肝細胞に運ばれASGPRに取り込まれるのですが、例えばASGPRの発現が減少するような疾患であっても、肝臓をターゲットとしたGalNAc-siRNA-コンジュゲートが有効に作用し、その効力は損なわれないということが報告されています。

ASGPR発現は、肝硬変や癌などの肝疾患と診断された場合の肝機能の低下と臨床的に関連すると考えられているため、この文献により提示された結果は、とても有意義であると言えます。また文献では、さらに幅広く応用できる可能性をも有しているとの見解を示しています。

Willoughby, Jennifer LS, et al. "Evaluation of GalNAc-siRNA Conjugate Activity in Pre-clinical Animal Models with Reduced Asialoglycoprotein Receptor Expression." *Molecular Therapy* 26.1 (2018): 105-114.

そのオリゴ合成、承ります！

文献のアプリケーション応用には、日本遺伝子研究所のオリゴヌクレオチドをお勧めします！

siRNAの合成を承ります。脱保護し、アニーリング済みの2本鎖の状態でお届けします。また、siRNAへのGalNAc修飾をはじめとした各種修飾も可能です。GalNAcの場合は、末端への複数個修飾もできます。

siRNA

⇒[詳細はこちら](#)

GalNAc修飾オリゴヌクレオチド

⇒[詳細はこちら](#)