

アンチセンスオリゴヌクレオチド



核酸医薬は、さまざまな難治性疾患やがんの治療薬となり得るため、その臨床応用に大きな期待が寄せられています。しかしながら、酵素や免疫機構による代謝および細胞膜透過性の低さなど、多くのケースにおいて実用化へはまだ多くの壁が立ちはだかっていると云えます。そこで注目したいのが、オリゴヌクレオチドの化学修飾やデリバリー技術です。有効性の高い核酸医薬を実用化していくには、これらが非常に重要になってきます。

▶ 今回は、このような課題を打破するための、核酸医薬に関するレビューをご紹介します。このレビューではまず、核酸医薬の可能性を大幅に向上させるための効率的な化学修飾戦略の概要が提示されています。次に、オリゴヌクレオチドのターゲティングやデリバリーテクノロジーが紹介されています。そして最後に、エンドソームからの脱出ステップに焦点を当てています。エンドソーム脱出への分子的理解はとりわけ重要であるとの見解が述べられており、細胞質移行を促進する新しい技術開発につながるだろうとの期待を示しています。

Johannes, Ludger, and Marco Lucchino. "Current challenges in delivery and cytosolic translocation of therapeutic RNAs." *Nucleic acid therapeutics* 28.3 (2018): 178-193.

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
- ・ ホスホロチオエート化 (s オリゴ)
- ・ 2'位修飾挿入 (2'-O-methoxyethyl (2'-MOE)、2'-O-Methyl (2'-OMe)、2'-Fluoro (2'-F) など)
- ・ LNA 修飾
- ・ GalNAc 修飾

核酸医薬にとって重要とされる各種修飾が可能です。

また、レビューでは登場していませんが、コンジュゲート作製にはクリックケミストリーも大変便利です。

siRNA

⇒ [詳細はこちら](#)

アンチセンスオリゴヌクレオチド

⇒ [詳細はこちら](#)

LNA 修飾オリゴヌクレオチド

⇒ [詳細はこちら](#)

GalNAc 修飾オリゴヌクレオチド

⇒ [詳細はこちら](#)

クリックケミストリー

⇒ [詳細はこちら](#)