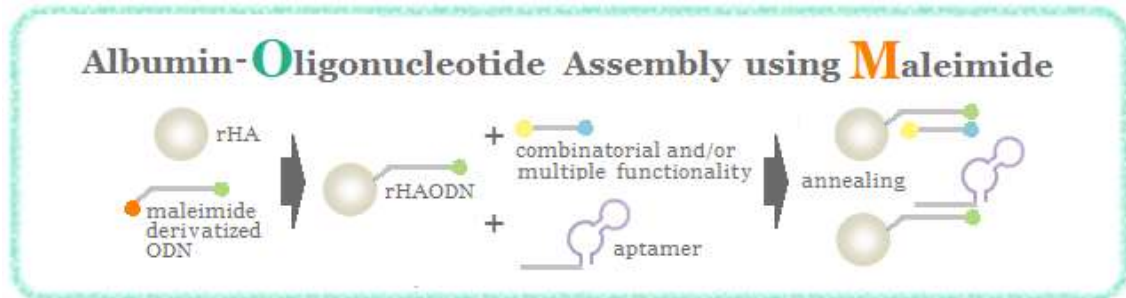


『オリゴヌクレオチドのデリバリー戦略』

『マレイミド-オリゴヌクレオチド』を用いたタンパク質修飾 編



マレイミド基は、チオール基 (-SH) との求核付加（マイケル付加）による結合を目的とした活性基の一つで、結合リンカーとして広く用いられています。

従来行われてきたオリゴヌクレオチドへのマレイミド基付加反応は二官能性試薬を用いる方法でした。この方法は長時間を要し、反応効率もさほど高くありません。日本遺伝子研究所では、保護されたマレイミド誘導体をオリゴヌクレオチド固相合成中に結合させるため、一般的な方法におけるマレイミド結合の欠点を補うことができます。

▶デリバリー戦略⑦

～マレイミド-オリゴヌクレオチドを用いてアルブミン修飾～

今回は、マレイミド修飾したオリゴヌクレオチドとアルブミンとコンジュゲートさせるというDDS アプローチに関する文献をご紹介します。血清中に最も多く含まれるヒト血清アルブミンは長期血液循環特性を持つため、薬物半減期を延長させるためのデリバリーツールとして有用であると言えます。

34 位のアルブミンシステイン (cys34) に存在する遊離チオールにマレイミド修飾したオリゴヌクレオチドをコンジュゲートし、その後相補鎖をアニールさせて二本鎖としています。この方法を採用するとき、アニール前のオリゴヌクレオチド末端は3か所がフリーの状態になるので、ここに核酸アプタマーや狙った官能基をロードさせることもできます。そうすることで目的とする機能を追加することができるので、多様性のあるフレームワークとして極めて有望であると筆者は捉えています。

Kuhlmann, Matthias, et al. "An albumin-oligonucleotide assembly for potential combinatorial drug delivery and half-life extension applications." *Molecular Therapy-Nucleic Acids* 9 (2017): 284-293.

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！

オリゴヌクレオチドの 5'末端へマレイミド修飾を承ります。マレイミド基が保護された状態が最も安定なため、この状態でのお受け取りとなります（乾燥品での納品）。この場合、ご使用の直前に保護基を除去してご使用ください。

マレイミド修飾オリゴヌクレオチド

⇒[詳細はこちら](#)