

『オリゴヌクレオチドのデリバリー戦略』

クリックケミストリー編



二つの分子を簡単に結合することができるクリックケミストリーは、緩和な反応条件や反応効率、簡便さなどから、その汎用性を高く評価されています。また合成オリゴヌクレオチドは、治療薬として主要な構成要素であると捉えられています。

▶デリバリー戦略①

～クリックケミストリー-Huisgen 反応でコンジュゲート～

今回ご紹介するのは、現在見出されている、治療開発におけるクリックケミストリーの有用性が明記されたレビューです。

治療に際し、標的へのデリバリー効率や分解などの大きな壁が立ちはだかっていると言います。一般的に、治療におけるオリゴヌクレオチドを用いたコンジュゲートは、治療剤のデリバリーが効率よくスムーズに行なわれるためにとっても有用であると言います。このレビューでも、オリゴヌクレオチドを用いた治療剤の条件として、①標的に対し効率的な塩基対を確実に形成すること ②安定性および細胞標的特異性を持つこと ③適切なデリバリー担体を見出すこと ④標的特異性をアップさせることが重要であると述べられています。クリックケミストリー技術を用いてオリゴヌクレオチドと他の生体分子とを結合させることによって、このような条件を満たすことができる可能性を示しています。

Astakova, Kira, et al. "Clicking" gene therapeutics: A successful union of chemistry and biomedicine for new solutions." *Molecular pharmaceuticals* (2018).

日本遺伝子研究所では、クリックケミストリー-Huisgen 反应用の修飾オリゴ DNA、RNA 合成を承っております。

CuAAC

- ▶アジド(-N₃)修飾オリゴ DNA・RNA
- ▶アルキン(-C≡CH)修飾オリゴ DNA・RNA
- ▶2'-O-プロパルギル (rA,rG,rC,rU) 修飾オリゴ DNA・RNA
- ▶3'-O-プロパルギル (rA,rG,rC,rU) 修飾オリゴ DNA・RNA
- ▶C8 アルキン (オクタジニル) (dA,dC,dT) 修飾オリゴ DNA・RNA
- ▶エチニル (dA,dU) 修飾オリゴ DNA・RNA
- ▶エチニル dSpacer 修飾オリゴ DNA・RNA

SPAAC

- ▶ジベンゾシクロオクチン(DBCO:dibenzocyclooctyl)修飾オリゴ DNA・RNA
- ▶ビスシクロノニン(BCN:bicyclo[6.1.0]nonyne)修飾オリゴ DNA・RNA

各種ラインナップについて、様々なリンカータイプを取り揃えております。リンカーを明記した詳しい構造をホームページにアップしておりますので、ご参考ください。また、ご希望のリンカーがない場合でも、使用する試薬を変更したり、スペーサー修飾等を用いてカスタムすることで解決できる場合もあります。
是非一度、ご相談ください。

クリックケミストリー修飾について

⇒[詳しくはこちら](#)