

# 核酸アプタマー

**Aptamers** can specifically bind to the targets ranging from small molecules to complex structures, making them suitable for a myriad of diagnostic and therapeutic applications.

Unique Characteristics ; ★ Like high specificity and binding affinity ★ Low immunogenicity and toxicity ★ Including small size  
★ Ease in synthesis with negligible batch-to-batch variation ★ Flexible structure ★ Good biocompatibility

核酸アプタマーは、オリゴヌクレオチドライブラリーから選択された合成 1 本鎖 DNA または RNA 配列です。その働きは、標的配列とのハイブリダイゼーションによる発現制御ではなく、アプタマー自身の立体構造により標的分子と特異的に結合するという機序に基づいており、抗体と類似していることから比されることも少なくないようです。

今回は、核酸アプタマーに関する 2 つのレビューをご紹介します。

▶アプタマーは、ターゲットとの特異的かつ親和性の高い分子結合が可能な核酸配列で、特定の三次元構造を認識することで標的と相互作用します。抗体と比較して、サイズが小さい、構造が柔軟である、生体適合性が高い、免疫原性が低いなどの利点があり、ユニークな特性が注目されていると述べられています。

ここでは、アプタマーの利点、治療薬や診断薬としての現状、課題と可能性について、最近の進展とともにレビューしています。アプタマーの結合性能と再現性が、臨床応用に向けての重要な課題となっているという現状を踏まえながらも、SARS-CoV-2 などのウイルスに対して、診断や治療、メカニズムの解析にも役立つ貴重なツールとなる可能性を示唆しています。今後、核酸アプタマーが医薬品や研究ツールとして重要な役割を担っていくためには、選択性、安定性、送達、長期的な安全性、再現性の最適化などの複数の課題の克服する必要があるとしています。

Byun, Jonghoe. "Recent Progress and Opportunities for Nucleic Acid Aptamers." *Life* 11.3 (2021): 193.

▶核酸アプタマーは、高い特異性や結合親和性、免疫原性の低さ、低毒性、合成のし易さ、抗体とは異なりバッチ間のばらつきが少ないなどのユニークな特長を持ち、ターゲットとなり得るもののサイズ、構造、種類は、非常に広範にわたると述べられています。さまざまな場面において利用されており、ここでは特に、診断や治療に焦点を当てて記述されています。治療目的の場合には、安定化を図るために修飾を施すことも多くあるとしています。

このレビューでは、アプタマーの選択、安定性・親和性・特異性を高めるための修飾戦略、デリバリーの工夫、アプタマー・ナノ粒子コンジュゲート作製などについてまとめられています。また、アプタマーの有用性が多く説かれていたと同時に、毒性の問題、化学修飾種による弊害、生体内分布、薬物動態などの、制約やデメリットについても言及しています。

新薬が患者の元に届くまでには大規模な研究の余地がまだあるとしながらも、核酸アプタマーの持つ可能性には大きな期待が示されています。抗体ではアクセスできないターゲットでも特異的に結合できること、最終的には細菌やウイルスへの対処法、がんの免疫療法、ターゲットデリバリーなどにつながる可能性があること、ドラッグデリバリーシステムにおける標的特異性と薬物動態プロファイルを向上させるための新たな道を開く可能性があることが示唆されています。

Kulabhusan, Prabir Kumar, Babar Hussain, and Meral Yüce. "Current Perspectives on Aptamers as Diagnostic Tools and Therapeutic Agents." *Pharmaceutics* 12.7 (2020).

## そのオリゴ合成、承ります！

文献のアプリケーションには、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！

レビューで登場した各種修飾合成を承ります。

弊社ホームページをご覧ください。

⇒詳細は[こちら](#)

ホームページに記載のないものでも、一度お問い合わせください。