

トリアゾール連結型人工核酸

生体内安定性、オフターゲット効果、細胞取込効率が改善された人工核酸医薬の開発に資する新規化合物

概要

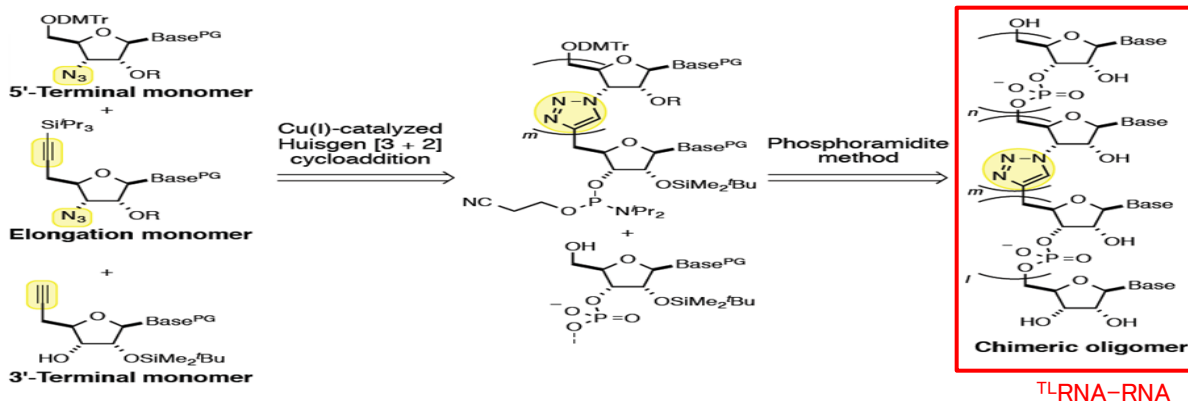
RNA干渉法は数十塩基対程度の短鎖RNA (siRNA など)を用いて標的遺伝子の発現を抑制する技術であるが、天然型RNAの不安定性、オフターゲット効果、及び細胞への取り込み効率の低さが課題となっている。本発明は、上記課題を解決できる新規RNA誘導體として天然型RNAのリン酸ジエステル結合をトリアゾール環を介する結合に置き換えたキメラ型オリゴヌクレオチド (TLRNA-RNA)とその製造方法を提供する。

効果

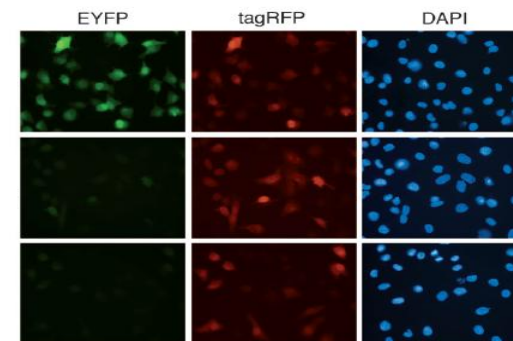
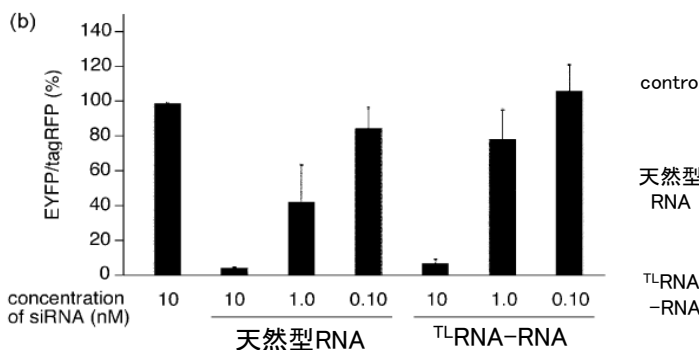
TLRNA-RNAは以下の特長を有する。

- リン酸ジエステル結合を有さないためヌクレアーゼによる分解が生じ難い。
- 静電相互作用が低く脂溶性が高いトリアゾール環を有するため、細胞膜透過性及び相補鎖に対する結合能力が高い。
- 独自に合成した原料化合物を用いることにより、市販の核酸自動合成装置で任意の塩基配列をもつTLRNA-RNAを合成できる。
- 天然型RNAに匹敵するRNA干渉効果を有する。

TLRNA-RNAの構造及び製造方法



TLRNA-RNAのsiRNAとしての有用性



連絡先

株式会社 東北テクノアーチ
TEL 022-222-3049 FAX 022-222-3419
問い合わせは[こちら](#)からお願いします。

特許データシート

特許番号: 特許第5594722号、WO/2015/137121
発明者: 磯部寛之、藤野智子ら