

共催 日本薬物動態学会 第37回年会 横浜
積水メディカル株式会社



ランチョンセミナーのご案内

ランチョンセミナー8

2022年 **11月9日(水)** 11:45~12:45

会場：**D会場（4階411+412会議室）**

「アンチセンス核酸創薬における化学修飾の重要性と薬物動態への影響」

Importance of chemical modifications and its effect in
pharmacokinetics of antisense oligonucleotides

梅本 忠士 先生
ルクサナバイオテク株式会社

「積水メディカルにおける核酸薬物動態評価への取り組み」

Sekisui Medical's approach for pharmacokinetic evaluation of
oligonucleotide drugs

伊藤 諭史
積水メディカル株式会社

- チケット配布：11月9日（当日） 8:30～
パシフィコ横浜 会議センター 3階ホワイエ
（なくなり次第、配布終了）

積水メディカル株式会社
創薬支援営業所

〒103-0027 東京都中央区日本橋2-1-3 アーバンネット
日本橋二丁目ビル
TEL：03 (3271) 5634
E-mail:toiawaseyakudo@sekisui.com

・アンチセンス核酸創薬における化学修飾の重要性と薬物動態への影響

世界で承認された核酸医薬品は2022年10月の時点で16品目に到達した。承認された核酸医薬品のうち、アンチセンス核酸やsiRNAは、抗体や低分子では成しえない作用機序により薬効を示すため、新たなモダリティとして期待されている。一方、核酸医薬品の分子量は、低分子化合物と比較し大きいにもかかわらず、細胞内のRNAを標的とする必要があるため、細胞内送達や、臓器分布など課題も多く、化学修飾による課題解決が期待されている。本発表では、ルクサナバイオテックが保有するAmNA (Amido-Bridged Nucleic Acid)、GuNA (Guanidine-Bridged Nucleic Acid)、scpBNA (spirocyclopropylene Bridged Nucleic Acid)、5'-CP (5'-Cyclopropylene DNA)などの化学修飾をアンチセンス核酸に導入した創薬応用事例や、薬物動態に与える影響、毒性低減事例等をご紹介します、ディスカッションさせていただきます。

・積水メディカルにおける核酸薬物動態評価への取り組み

核酸医薬品は従来の低分子医薬品では狙えない、mRNAなどの細胞内標的分子を創薬ターゲットにする事ができ、近年開発が盛んになってきている。積水メディカルでは、お客様の核酸医薬品開発を支援するために、当社独自技術である高感度核酸分析技術（PALSAR法[※]）を始めとして、様々な取り組みを実施してきた。本発表では核酸医薬品の薬物動態評価に焦点を当て、AmNA (Amido-Bridged Nucleic Acid) を始めとした架橋型人工核酸などの化学修飾を導入した核酸投与における代謝物分析評価に関する取り組み、さらには生体内分布試験で使用される標識核酸に対して、これまでの標識技術の課題を克服した迅速で低コストな新規核酸標識技術^{※※}とそれを使用した生体内分布試験の実例を紹介する。

※PALSAR: Probe Alternation Link Self-Assembly Reaction

※※RINATイメージング社の技術