

核酸药物用DDS纳米颗粒RION

~具有高肿瘤积累性的无纳米载体核酸药物用DDS~

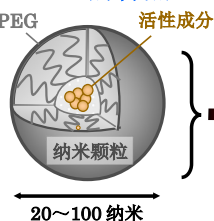
发明要点

- 通过化学修饰核酸的有义链，核酸本身形成纳米颗粒
- 通过将核酸本身制造纳米颗粒，实现了无纳米载体的药物递送系统 (DDS) **具有高肿瘤积累性的DDS技术** (对提高疗效的贡献!)

[参考] 现有纳米载体的缺点和纳米颗粒RION的特点

◎ 现有纳米载体 (脂质纳米颗粒等)

- 肝脏中的高积聚 (> 90%)
- 低血液稳定性 (< 15分钟)
- 低活性成分负载 (< 5%)
- 由载体 (活性成分以外的成分) 引起的副作用



◎ 纳米颗粒RION

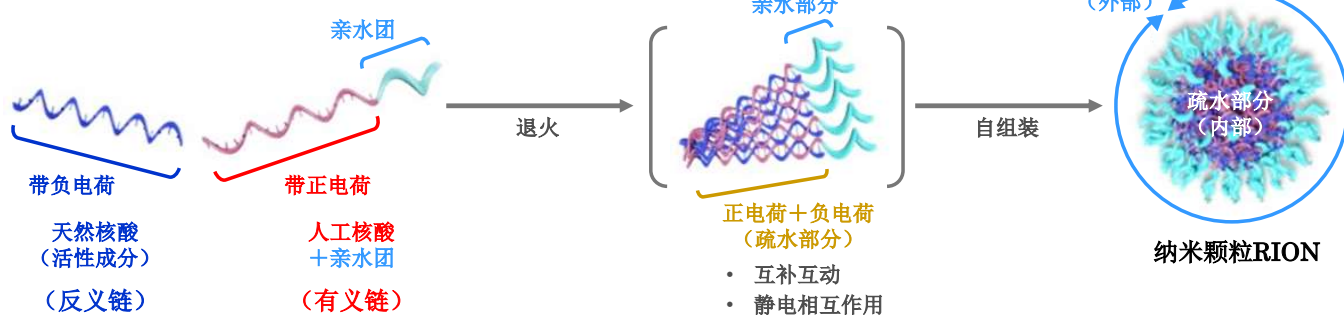
- 高肿瘤积聚 (未检测到肝脏中的积聚)
- 高血液稳定性 (> 2小时)
- 高活性成分负载 (仅由核酸组成)
- 核酸本身形成纳米颗粒 (没有载体)

发明概要

通过化学修饰核酸的有义链使其带正电，并将亲水团引入有义链，核酸退火并自组装。

→ 纳米颗粒RION由向内的疏水部分和向外的亲水部分形成。

[纳米颗粒RION形成机制]

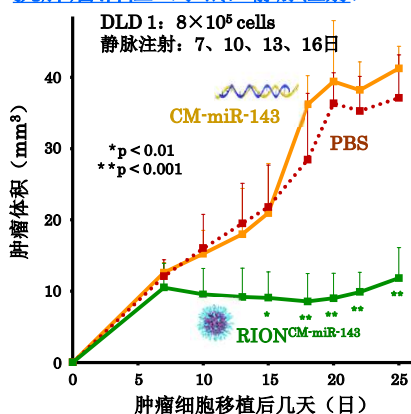


与常规技术的比较和优势性

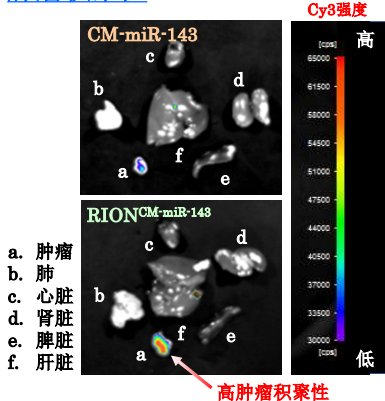
[纳米颗粒RION的药效]

基于抑制肿瘤细胞中的RAS信号通路的化学修饰体microRNA-143 (CM-miR-143) 制造的“RION^{CM-miR-143}”的试验

抗肿瘤活性 (小鼠, 静脉注射)



肿瘤积聚性



与脂质纳米颗粒 (常规技术) 的比较

	RION	脂质纳米颗粒 ¹⁾
血液稳定性 ²⁾ (半衰期, 静脉注射)	2.4小时	< 15分钟
肝脏积聚性 ²⁾ (24小时)	未检测	91.4%
活性成分含量 (重量%/颗粒)	16.8%	4.0%

1) Onpattro®静脉滴注
2) Journal of Controlled Release, 235, 236-244 (2016)

RION^{CM-miR-143}具有很高抗肿瘤活性和肿瘤积聚性，与常规药物相比具有优越的血液稳定性和很高活性成分含量。

预期用途

◎ 对新的核酸药物 (癌症, 神经系统疾病, 免疫疾病等) 用DDS的应用

发明人:

宫本 宽子
(爱知工业大学·讲师)

可授权的专利

发明名称: 人工核酸和使用其递送核酸的方法
联系地址: 科学技术振兴机构 知识产权管理推进部
电子号码) +81-3-5214-8486
电子邮件) license@jst.go.jp
URL) www.jst.go.jp/chizai/

