

# ピロール・イミダゾール・ポリアミド受託合成

## 少量から大量まで対応

経験豊富なペプチド科学のプロが、独自のノウハウと技術を駆使し、アミノ酸誘導体化したピロールやイミダゾール骨格のペプチド(PIPA)を確実に合成いたします。

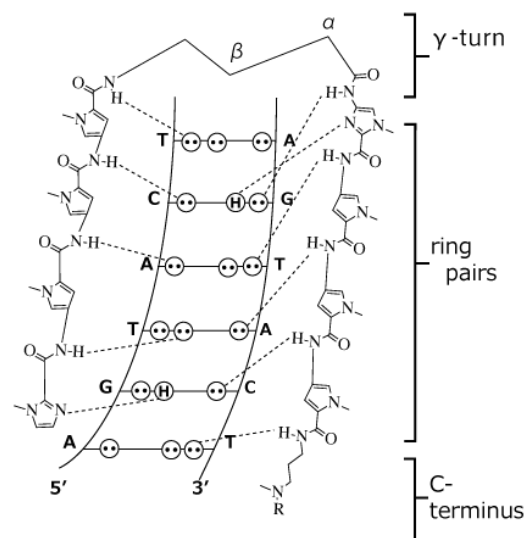
## 技術概要 分子認識の応用 ピロール・イミダゾールからなるポリアミドの新規遺伝子医薬への応用

DNA二重螺旋構造の表面には深浅2種の溝があり、PIPAは浅い方の溝(マイナーグロウブ)に入り込みDNAの各塩基との間で水素結合を介して可逆的に結合する。PIPAは、元々抗生物質より見いだされた低分子有機化合物で、転写因子より強く配列特異的に2本鎖DNAに結合し、標的遺伝子の転写活性を強力に抑制する。核酸分解酵素などに対し耐性で、生体内で安定であり、ベクターやデリバリー試薬なしに細胞の核に取り込まれる。自由に分子設計・化学合成ができる。ハイペップ研究所では分子設計をしたPIPAを受託で化学合成している。PIPAは未だ有効な治療薬のない難治性疾患等に対し、新規な遺伝子転写制御薬として期待されている。

P. B. Dervan et. al., Nature 391 (1998) 468-471;

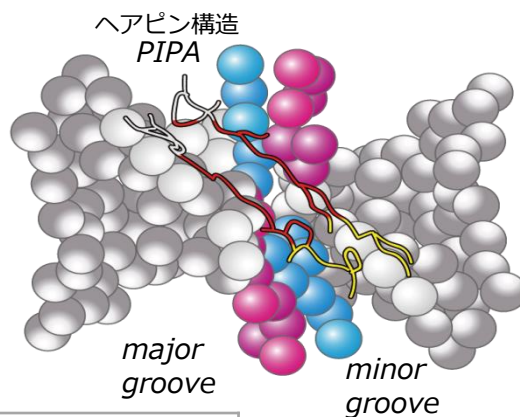
P. B. Dervan and R. W. Burli, Current Opinion in Chemical Biology 3 (1999) 688-693;

P. B. Dervan, Bioorganic & Medicinal Chemistry 9 (2001) 2215-2235.



## 競合技術とPIPAの優れた特長

核酸医薬が開発されているが、これらは生体内で分解され易く、実用化されていない。PIPAは核酸分解酵素によって分解されることなく、生体内で安定である。遺伝子治療薬としては、ペプチド核酸(PNA)が注目されたが、その後、細胞内への移行、毒性の問題等で未だ実用化されていない。siRNAが知られているが、これは遺伝子発現をノックダウンするために副作用が懸念される。PIPAは疾病で上昇した遺伝子転写活性のみを抑制する(病変のみを抑制する)ために副作用の観点で有利と考えられている。



## 合成条件

品質保証データ	逆相HPLC分析および質量分析データ添付
	合成サンプルの量、構造、精製純度により価格は変動します。
納期	10営業日~15営業日(標準合成品の場合) ※ただし特殊試薬使用の場合は試薬入手後
納品形態	凍結乾燥品 / 冷凍宅配、溶解分注品等にも対応します。

## 【オプション】

長鎖ポリアミド、特殊コンジュゲート、タンデム型等は都度見積もりです。価格は配列、修飾場所、純度、合成量によって変動します。別途特急納品にも対応します。

## PIPAに関連する最近の学術論文(ハイペップ研究所)

J. Am. Chem. Soc., 136, 11546-11554, 2014

Peptide Science 2014, A. Ohtaka (ed.) The Japanese Peptide Society (2015) pp 51-54.

Peptide Science 2014, A. Ohtaka (ed.) The Japanese Peptide Society (2015) pp 73-74.