

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和4年3月31日(2022.3.31)

【国際公開番号】WO2020/004607

【出願番号】特願2020-527674(P2020-527674)

【国際特許分類】

A 61K 31/7088(2006.01)

A 61P 27/02(2006.01)

A 61P 19/08(2006.01)

A 61P 25/04(2006.01)

A 61P 29/02(2006.01)

A 61P 19/10(2006.01)

A 61P 19/02(2006.01)

A 61P 29/00(2006.01)

A 61P 43/00(2006.01)

A 61K 31/7105(2006.01)

A 61K 48/00(2006.01)

A 61K 47/26(2006.01)

A 61K 9/08(2006.01)

C 12N 15/115(2010.01)

10

20

30

40

【F I】

A 61K 31/7088

A 61P 27/02 Z N A

A 61P 19/08

A 61P 25/04

A 61P 29/02

A 61P 19/10

A 61P 19/02

A 61P 29/00 101

A 61P 43/00 105

A 61K 31/7105

A 61K 48/00

A 61K 47/26

A 61K 9/08

C 12N 15/115 Z

【手続補正書】

【提出日】令和4年3月23日(2022.3.23)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

F G F 2に結合するアプタマー又はその塩と、非電解質である浸透圧調整剤とを含有してなる、該アプタマー又はその塩が長期間安定である水性液剤。

【請求項2】

前記アプタマー又はその塩以外に、実質的に電解質を含有しない、請求項1に記載の水性

50

液剤。

【請求項 3】

前記アプタマーが、下式(1)：

N₁G G A N₂A C U A G G G C N₃U U A A N₄G U N₅A C C A G U G U N₆ (1)

(ここで、N₁及びN₆は、それぞれ独立して任意の0から数個の塩基を表し、N₂、N₃、N₄及びN₅は、独立して任意の一個の塩基を表す)

で表わされるヌクレオチド配列(但し、ウラシルはチミンであってもよい)を含むアプタマーであって、以下の(a)又は(b)：

(a)該アプタマーに含まれるヌクレオチドにおいて、

(i)各ピリミジンヌクレオチドのリボースの2'位がフッ素原子であり

(ii)各プリンヌクレオチドのリボースの2'位がヒドロキシ基である；

(b)該(a)のアプタマーにおいて、

(i)各ピリミジンヌクレオチドのリボースの2'位のフッ素原子が、それぞれ独立して、無置換であるか、水素原子、ヒドロキシ基及びメトキシ基からなる群より選ばれる原子又は基で置換されており

(ii)各プリンヌクレオチドのリボースの2'位のヒドロキシ基が、それぞれ独立して、無置換であるか、水素原子、メトキシ基及びフッ素原子からなる群より選ばれる原子又は基で置換されている；

のいずれかである、請求項1又は2に記載の水性液剤。

【請求項 4】

前記アプタマーが、下式(3)：

N₁G G A U A C U A G G G C A U U A A U G U U A C C A G U G U A G U C N₆ 2 (3)

(ここで、N₁及びN₆は、それぞれ独立して任意の0から数個の塩基を表す)

で表わされるヌクレオチド配列を含む、請求項1又は2に記載の水性液剤。

【請求項 5】

前記アプタマーが、配列番号3、8、9、10又は12で表わされるいずれかのヌクレオチド配列を含む、請求項1又は2に記載の水性液剤。

【請求項 6】

アプタマーの濃度が1～60mg/mLである、請求項1～5のいずれか一項に記載の水性液剤。

【請求項 7】

浸透圧調整剤の配合割合が、水性液剤全体の2～7.5%(w/v)である、請求項1～6のいずれか一項に記載の水性液剤。

【請求項 8】

浸透圧調整剤がマンニトールである、請求項1～7のいずれか一項に記載の水性液剤。

【請求項 9】

アプタマー1mgに対して、マンニトールを1～50mgの割合で含有する、請求項8に記載の水性液剤。

【請求項 10】

5 以下で保存される、請求項1～9のいずれか一項に記載の水性液剤。

【請求項 11】

4 で3か月保存後の単量体アプタマーの割合が80%以上である、請求項1～10のいずれか一項に記載の水性液剤。

【請求項 12】

注射剤である、請求項1～11のいずれか一項に記載の水性液剤。

【請求項 13】

血管新生を伴う疾患、骨・軟骨疾患又は疼痛の予防又は治療用である、請求項1～12のいずれか一項に記載の水性液剤。

【請求項 14】

10

20

30

40

50

血管新生を伴う疾患、骨・軟骨疾患又は疼痛の予防又は治療における使用のための、請求項1～12のいずれか一項に記載の水性液剤。

10

20

30

40

50