

【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 6 1 K 31/7088(2006.01)

A 6 1 P 27/02(2006.01)

A 6 1 P 19/08(2006.01)

A 6 1 P 25/04(2006.01)

A 6 1 P 29/02(2006.01)

A 6 1 P 19/10(2006.01)

A 6 1 P 19/02(2006.01)

A 6 1 P 29/00(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 31/7105(2006.01)

A 6 1 K 48/00(2006.01)

A 6 1 K 47/26(2006.01)

A 6 1 K 9/08(2006.01)

C 1 2 N 15/115(2010.01)

10

20

【F I】

A 6 1 K 31/7088

A 6 1 P 27/02 Z N A

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 29/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 K 31/7105

A 6 1 K 48/00

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 9/08

C 1 2 N 15/115 Z

30

【手続補正書】

【提出日】令和 4 年 3 月 23 日(2022.3.23)

【手続補正 1】

40

【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 に結合するアブ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、該アブ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】

前記アブ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) :

$N^1 G G A N^2 A C U A G G G C N^3 U U A A N^4 G U N^5 A C C A G U G U N^6$ (1)

(ここで、 N^1 及び N^6 は、それぞれ独立して任意の 0 から数個の塩基を表し、 N^2 、 N^3 、 N^4 及び N^5 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

10

(i i) 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

(i i) 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。

20

【請求項 4】

前記アプタマーが、下式 (3) :

$N^1 G G A U A C U A G G G C A U U A A U G U U A C C A G U G U A G U C N^{62}$ (3)

(ここで、 N^1 及び N^{62} 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 ~ 60 mg / mL である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の水性液剤。

30

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

【請求項 10】

40

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】

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