

【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 1 部門第 1 区分

【発行日】平成24年7月12日 (2012.7.12)

【公表番号】特表2011-524745(P2011-524745A)

【公表日】平成23年9月8日 (2011.9.8)

【年通号数】公開・登録公報2011-036

【出願番号】特願2011-512892(P2011-512892)

【国際特許分類】

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

C 1 2 Q 1/68 (2006.01)

C 1 2 N 15/113 (2010.01)

A 6 1 K 48/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/7088 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/7105 (2006.01)

G 0 1 N 33/68 (2006.01)

G 0 1 N 33/50 (2006.01)

G 0 1 N 33/15 (2006.01)

【 F I 】

C 1 2 N 15/00 Z N A A

C 1 2 Q 1/68 Z

C 1 2 N 15/00 G

A 6 1 K 48/00

A 6 1 K 31/7088

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 11/00

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 K 39/395 E

A 6 1 K 39/395 T  
 A 6 1 K 31/7105  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 G 0 1 N 33/68  
 G 0 1 N 33/50 Z  
 G 0 1 N 33/15 Z

## 【手続補正書】

【提出日】平成24年5月21日(2012.5.21)

## 【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

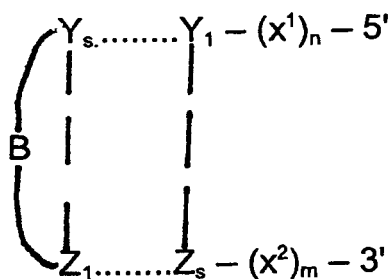
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

配列

【化 1】



[ 式中、Y 及び Z はヌクレオチド又はヌクレオチドアナログ構成ブロックを示す、  
 その際、それぞれの Y 及び Z は相互に一緒に塩基対、特にワトソン - クリック塩基対を形成し、X<sup>1</sup> 及び X<sup>2</sup> は独立してポリ（アルキレングリコール）単位を含む基から選択される、

n 及び m は独立して 0 又は 1 を示し、その際 n 及び m の少なくとも 1 つは 1 である、  
 s は 1 ~ 20、有利には 5 ~ 18 の整数である、かつ

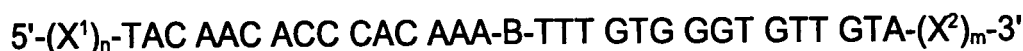
B は架橋基である ]

を含む単鎖オリゴヌクレオチド分子。

【請求項 2】

配列

【化 2】



[ 式中、A、C、T 及び G はヌクレオチド又はヌクレオチドアナログ構成ブロックを示す、

X<sup>1</sup> 及び X<sup>2</sup> は独立してポリ（アルキレングリコール）単位を含む基から選択される、  
 n 及び m は独立して 0 又は 1 を示し、その際 n 及び m の少なくとも 1 つは 1 である、かつ  
 B は架橋基を示す ]

を含む請求項 1 記載の単鎖オリゴヌクレオチド分子。

【請求項 3】

ヌクレオチド又はヌクレオチドアナログが、デオキシリボヌクレオチド構成ブロック、  
 修飾したデオキシリボヌクレオチド構成ブロック、リボヌクレオチド構成ブロック、修飾

したリボヌクレオチド構成ブロック、ヌクレオチドアナログ構成ブロック、特にPNA、LNA、O-メチルRNA、又はモルホリノ構成ブロック又はこの組み合わせから選択される請求項1又は2記載のオリゴヌクレオチド分子。

【請求項4】

X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>が、200～100000Daの範囲内にある分子量を有する線状又は分枝鎖状のポリ(エチレングリコール)単位を含む基から選択される請求項1から3までのいずれか1項記載のオリゴヌクレオチド分子。

【請求項5】

Bが、相補ヌクレオチド又はヌクレオチドアナログ構成ブロックを連結でき、かつ、塩基対の形成を支持できる20個までの構成ブロックのスペーサー配列である請求項1から4までのいずれか1項記載のオリゴヌクレオチド分子。

【請求項6】

Bが、

(i)少なくとも3つの対となっていないヌクレオチド又はヌクレオチドアナログ構成ブロックのヌクレオチド性スペーサー配列、又は

(ii)非ヌクレオチド性スペーサー配列、例えば少なくとも5つのエチレングリコール単位のポリ(エチレングリコール)スペーサー配列

を含む結合基である請求項1から5までのいずれか1項記載のオリゴヌクレオチド分子。

【請求項7】

PWWPDメインタンパク質、例えばHDGF、HRP-1、HRP-2、HRP-3、HRP-4及び/又はLEDGF、特にHRP-3及び/又はHDGFを阻害するための請求項1から6までのいずれか1項記載のオリゴヌクレオチド分子。

【請求項8】

PWWPDメインタンパク質に少なくとも10μM、有利には少なくとも100μM、特に有利には少なくとも1000μMの親和性で結合する請求項1から7までのいずれか1項記載のオリゴヌクレオチド分子。

【請求項9】

医薬における使用のための、特に血管形成に関連した疾病、例えば癌、例えば神経芽腫、メラノーマ、結腸直腸癌、膀胱癌、胃癌、肝細胞癌及び肺癌の診断及び治療における使用のための、請求項1から8までのいずれか1項記載のオリゴヌクレオチド分子。

【請求項10】

更なる療法、例えば放射線、手術及び/又は更なる医薬の投与と組み合わせた使用のための請求項9記載のオリゴヌクレオチド分子。

【請求項11】

薬剤スクリーニングにおける使用のための請求項1から8までのいずれか1項記載のオリゴヌクレオチド分子。

【請求項12】

医薬における使用のための、特に過剰増殖状態又は疾病の診断及び治療における使用のための、HRP-3ポリペプチド、特に哺乳類のHRP-3、又は、これをコードする核酸分子。

【請求項13】

医薬における使用のための、特に血管形成の阻害のための剤としての使用のための、又は血管形成に関連した状態又は疾病の診断及び治療における使用のためのHRP-3アンタゴニスト。

【請求項14】

抗体、抗体断片、アンチセンス分子、リボザイム、RNAi剤又はアプタマーである請求項17記載の化合物。