

【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】平成25年7月4日 (2013.7.4)

【公表番号】特表2012-527444(P2012-527444A)

【公表日】平成24年11月8日 (2012.11.8)

【年通号数】公開・登録公報2012-046

【出願番号】特願2012-511367(P2012-511367)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7105 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/7125 (2006.01)

A 6 1 K 31/712 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 48/00 (2006.01)

G 0 1 N 33/66 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

C 1 2 N 15/113 (2010.01)

C 1 2 Q 1/68 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7105 Z N A

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/7125

A 6 1 K 31/712

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 9/12

A 6 1 K 48/00

G 0 1 N 33/66 A

C 1 2 N 15/00 A

C 1 2 N 15/00 G

C 1 2 Q 1/68 A

【手続補正書】

【提出日】平成25年5月16日 (2013.5.16)

【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】

m i R - 1 0 3 および / または m i R - 1 0 7 の核酸塩基配列と少なくとも 9 0 % 相補的な核酸塩基配列を有する修飾オリゴヌクレオチドを含む化合物であって、

( i ) 被験者における、少なくとも1つの代謝障害、および/もしくは、代謝障害に関連する少なくとも1つの症状を治療すること、または、

( i i ) 被験者における、少なくとも1つの代謝障害、および/もしくは、代謝障害に関連する少なくとも1つの症状の開始を防止するかまたは遅延すること、  
における使用のためであり、

前記 m i R - 1 0 3 の核酸塩基配列は配列番号 1 であり、前記 m i R - 1 0 7 の核酸塩基配列は配列番号 2 である、化合物。

**【請求項 2】**

前記少なくとも1つの代謝障害は、糖尿病前症、糖尿病、代謝性症候群、肥満症、糖尿病性異脂肪血症、高脂血症、高血圧症、高トリグリセリド血症、高脂肪酸血症、高コレステロール血症、および高インスリン血症から選択される、ならびに/または、前記代謝障害に関連する少なくとも1つの症状が、血糖値上昇、糖新生亢進、インスリン抵抗性、糖耐性減損、および過剰な体脂肪から選択される、請求項 1 記載の化合物。

**【請求項 3】**

前記治療は、

( i ) 被験者における血糖値を低減すること、または、

( i i ) 被験者における血糖値上昇の開始を防止するかまたは遅延すること、  
を含む、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

**【請求項 4】**

前記治療は、

( i ) 被験者におけるインスリン感受性を改善すること、または、

( i i ) インスリン抵抗性の開始を防止するかまたは遅延すること、  
を含む、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

**【請求項 5】**

前記治療は、被験者における糖耐性を改善することを含む、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

**【請求項 6】**

前記治療は、被験者における糖新生を低減することを含む、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

**【請求項 7】**

前記治療は、被験者における脂肪細胞分化を増大することを含む、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

**【請求項 8】**

前記修飾オリゴヌクレオチドは、12～30 連結ヌクレオシドからなる、請求項 1～7 のいずれかに記載の化合物。

**【請求項 9】**

前記修飾オリゴヌクレオチドは、7～12 連結ヌクレオシドからなる、請求項 1～7 のいずれかに記載の化合物。

**【請求項 10】**

前記修飾オリゴヌクレオチドの前記核酸塩基配列は、

( i ) 前記 m i R - 1 0 3 の核酸塩基配列と少なくとも95%または100%相補的である、および/または、

( i i ) 前記 m i R - 1 0 7 の核酸塩基配列と少なくとも95%または100%相補的である、  
請求項 1～9 のいずれかに記載の化合物。

**【請求項 11】**

前記修飾オリゴヌクレオチドは、少なくとも1つの修飾糖を含む、請求項 1～10 のいずれかに記載の化合物。

**【請求項 12】**

前記修飾糖は、それぞれ、2'-O-メトキシエチル糖、2'-フルオロ糖、2'-O

- メチル糖および二環式糖部分から独立して選択される請求項 1 1 記載の化合物。

【請求項 1 3】

前記修飾オリゴヌクレオチドは、少なくとも 1 つの修飾ヌクレオシド間結合を含む、請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 4】

前記オリゴヌクレオチドの前記ヌクレオシド間結合は、それぞれ、修飾ヌクレオシド間結合である、請求項 1 3 記載の化合物。

【請求項 1 5】

前記修飾ヌクレオシド間結合は、ホスホロチオエートヌクレオシド間結合である、請求項 1 3 または 1 4 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

治療を必要とする被験者の同定方法であって、

前記被験者から得られる試料中のマイクロRNAの量を対照試料中のマイクロRNAの量と比較すること（この場合、前記マイクロRNAはmiR - 103またはmiR - 107であり、そして前記被験者から得られる試料中のより多い量のマイクロRNAは、前記被験者がmiRNA - 103 / 107と相補的な修飾オリゴヌクレオチドを含む化合物による治療を必要とする、ということを示す）  
を包含する方法。