

【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 1 年 12 月 26 日 (2019.12.26)

【公表番号】特表 2019-500334 (P2019-500334A)

【公表日】平成 31 年 1 月 10 日 (2019.1.10)

【年通号数】公開・登録公報 2019-001

【出願番号】特願 2018-527863 (P2018-527863)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/7088	(2006.01)
A 6 1 K	31/7115	(2006.01)
A 6 1 K	31/712	(2006.01)
A 6 1 K	31/7125	(2006.01)
A 6 1 K	48/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	9/127	(2006.01)
A 6 1 K	47/06	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	13/10	(2006.01)
A 6 1 P	13/08	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
C 1 2 N	15/113	(2010.01)
C 1 2 N	15/88	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/7088	Z N A
A 6 1 K	31/7115	
A 6 1 K	31/712	
A 6 1 K	31/7125	
A 6 1 K	48/00	
A 6 1 K	31/337	
A 6 1 K	9/127	
A 6 1 K	47/06	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	1/16	
C 1 2 N	15/113	Z
C 1 2 N	15/88	Z

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 11 月 14 日 (2019.11.14)

【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】

オリゴヌクレオチドが、

- (a) T C C C A T G G C C A G G A G G G T T G (配列番号 1) ;
- (b) G T C C C G G A A G A C G C T C A G G T (配列番号 2) ;
- (c) A A G G A C G C A G C C A C C A T G C C (配列番号 3) ;
- (d) T T G G C G T A G C T C A C C A C G A A (配列番号 4) ;
- (e) A G A T G C A G A A G A C C A C G A G G (配列番号 5) ;
- (f) C C A C T C T G G A A T G A C A C G G T (配列番号 6) ;
- (g) G T A G G A G A A G C C A G T G A T G A C (配列番号 7) ;
- (h) A G C A T G G C C A G C A G G A T G G A (配列番号 8) ;
- (i) G G C T G G A A G T T G A G T G C C A A (配列番号 9) ;
- (j) C A T G C C G T A G G A G A T G C C A A (配列番号 10) ;
- (k) C T C A G G C T G T G G C T C T T T G G (配列番号 11) ;
- (l) T A G C G G T T C A G C A T G A T G A (配列番号 12) ;
- (m) A G C A C G G C C C A G C C C C A G C C (配列番号 13) ;
- (n) G A G C T C C T T G A A G A A G A C A C T (配列番号 14) ;
- (o) C A G G A T G G A G G A G A T C C A G G (配列番号 15) ;
- (p) A G A C C C C C C A C A A G C A T G A C (配列番号 16) ;
- (q) G A A G T T G A G T G C C A A A C C C A A (配列番号 17) ;
- (r) C C C G T T G G C C A T G G G G C G C C (配列番号 18) ;
- (s) G C C A G C C C G T T G G C C A T G G G (配列番号 19) ;
- (t) A G G A A G A C A G G G C T A C C T G C (配列番号 20) ;
- (u) G C A C A C A G G A A G A C A G G G C T (配列番号 21) ;
- (v) C A G G G C A C A C A G G A A G A C A G (配列番号 22) ;
- (w) C A G C A G T T G A G C A G C A G G C C (配列番号 23) ;
- (x) A T G G C C A G G A G G G T T G (配列番号 46) ;
- (y) C A T G G C C A G G A G G G T T (配列番号 47) ;
- (z) C C A T G G C C A G G A G G G T (配列番号 48) ; および
- (a a) C C C A T G G C C A G G A G G G (配列番号 49)

から選択される配列を有する、アンチセンスオリゴヌクレオチド (A S O)。

【請求項 2】

A S O が改変ヌクレオシド間結合をさらに含む、請求項 1 に記載の A S O。

【請求項 3】

前記改変ヌクレオシド間結合が、ペプチド-核酸結合、モルホリノ結合、N 3' ~ P 5' ホスホロアミデート結合、メチルホスホネート結合またはホスホロチオエート結合である、請求項 2 に記載の A S O。

【請求項 4】

A S O が改変糖部分をさらに含む、請求項 1 に記載の A S O。

【請求項 5】

前記改変糖部分が 2' - O - アルキルオリゴリボヌクレオチドである、請求項 4 に記載の A S O。

【請求項 6】

A S O が 2' M O E ギャップマー改変を有する、請求項 1 に記載の A S O。

【請求項 7】

A S O が改変核酸塩基をさらに含む、請求項 1 に記載の A S O。

【請求項 8】

前記改変核酸塩基が 5-メチルピリミジンまたは 5-プロピニルピリミジンである、請求項 7 に記載の A S O。

【請求項 9】

がんの治療において使用するための、請求項 1 から 8 のいずれか 1 項に記載の A S O。

【請求項 10】

がんを治療するための医薬組成物であって、（a）配列番号 1～23 および配列番号 46～49 のうち 1 つまたは複数から選択される配列を有するアンチセンスオリゴヌクレオチド（A S O）、ならびに（b）薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 11】

A S O が改変ヌクレオシド間結合をさらに含む、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記改変ヌクレオシド間結合が、ペプチド-核酸結合、モルホリノ結合、N 3'～P 5' ホスホロアミデート結合、メチルホスホネート結合またはホスホロチオエート結合である、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

A S O が改変糖部分をさらに含む、請求項 10 または 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記改変糖部分が 2'-O-アルキルオリゴリボヌクレオチドである、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

A S O が 2' M O E ギャップマー改変を有する、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

A S O が改変核酸塩基をさらに含む、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記改変核酸塩基が 5-メチルピリミジンまたは 5-プロピニルピリミジンである、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

a. 配列番号 1～23 および配列番号 46～49 のうち 1 つまたは複数から選択される配列を有する A S O、ならびに

b. がんの治療のための説明書を含む商用パッケージ。

【請求項 19】

前記がんが、前立腺がん、腎細胞癌、乳がん、子宮頸がん、肝がん、膀胱がん、および小細胞肺がんのうち 1 つまたは複数から選択される、請求項 18 に記載の商用パッケージ。

【請求項 20】

前記前立腺がんが去勢抵抗性前立腺がん（C R P C）である、請求項 19 に記載の商用パッケージ。

【請求項 21】

（a）配列番号 1～23 および配列番号 46～49 のうち 1 つまたは複数から選択される配列を有するアンチセンスオリゴヌクレオチド（A S O）、ならびに（b）ドセタキセルを含む、組合せ療法。

【請求項 22】

組成物が、（a）請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載のアンチセンスオリゴヌクレオチド（A S O）；および（b）薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 23】

前記がんが、前立腺がん、腎細胞癌、乳がん、子宮頸がん、肝がん、膀胱がん、および小細胞肺がんのうち 1 つまたは複数から選択される、請求項 10 から 17 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記前立腺がんが去勢抵抗性前立腺がん（CRPC）である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

医薬組成物がさらに脂質粒子またはリボソームを含む請求項 10 から 17 および 22 から 24 のいずれか一項に記載の医薬組成物。