

(19) 日本国特許庁(JP)

再公表特許(A1)

(11) 国際公開番号

W02009/113579

発行日 平成23年7月21日 (2011. 7. 21)

(43) 国際公開日 平成21年9月17日 (2009. 9. 17)

| (51) Int.Cl. | F I | テーマコード (参考) |
|-------------------------------------|-----------------------|-------------|
| C 1 2 N 15/09 (2006.01) | C 1 2 N 15/00 Z N A A | 4 B O 2 4 |
| C 1 2 N 15/113 (2010.01) | C 1 2 N 15/00 G | 4 C O 8 4 |
| A 6 1 K 48/00 (2006.01) | A 6 1 K 48/00 | 4 C O 8 6 |
| A 6 1 P 35/00 (2006.01) | A 6 1 P 35/00 | |
| A 6 1 P 43/00 (2006.01) | A 6 1 P 43/00 1 O 5 | |
| 審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 38 頁) 最終頁に続く | | |

| | |
|---|---|
| 出願番号 特願2010-502851 (P2010-502851) | (71) 出願人 504013775 学校法人 埼玉医科大学 埼玉県入間郡毛呂山町毛呂本郷38 |
| (21) 国際出願番号 PCT/JP2009/054673 | |
| (22) 国際出願日 平成21年3月11日 (2009. 3. 11) | |
| (31) 優先権主張番号 特願2008-60757 (P2008-60757) | (71) 出願人 307020349 株式会社RNAi 東京都文京区本郷4-1-4 コスモス本郷ビル10階 |
| (32) 優先日 平成20年3月11日 (2008. 3. 11) | |
| (33) 優先権主張国 日本国 (JP) | |
| | (74) 代理人 100107515 弁理士 廣田 浩一 |
| | (74) 代理人 100107733 弁理士 流 良広 |
| | (74) 代理人 100115347 弁理士 松田 奈緒子 |
| | (74) 代理人 100136858 弁理士 池田 浩 |
| | 最終頁に続く |

(54) 【発明の名称】 癌の予防乃至治療に好適な二本鎖核酸分子、癌細胞増殖抑制剤、並びに医薬

(57) 【要約】

A P P 遺伝子及び E B A G 9 遺伝子の少なくともいずれかを標的として、これらの遺伝子の発現を抑制することにより、前立腺癌、膀胱癌、肺癌、大腸癌、肝癌、子宮癌、乳癌、皮膚癌、及び腎癌の癌細胞の増殖を効果的に抑制することが可能な s i R N A 等の二本鎖核酸分子、前記二本鎖核酸分子を含む癌細胞増殖抑制剤、及び前記癌細胞増殖抑制剤を含む医薬を提供することを目的とする。

(a) 配列番号 : 1 ~ 配列番号 : 2 1 のいずれかの標的配列に対応するヌクレオチド配列を有するセンス鎖と、(b) 前記 (a) のセンス鎖に相補的なヌクレオチド配列を有するアンチセンス鎖とを含む、A P P 遺伝子及び E B A G 9 遺伝子の少なくともいずれかの発現を抑制するための二本鎖核酸分子 ; 前記二本鎖核酸分子を含む、前立腺癌、膀胱癌、肺癌、大腸癌、肝癌、子宮癌、乳癌、皮膚癌、及び腎癌の少なくともいずれかに対する癌細胞増殖抑制剤 ; 並びに、前記癌細胞増殖抑制剤を含む、前立腺癌、膀胱癌、肺癌、大腸癌、肝癌、子宮癌、乳癌、皮膚癌、及び腎癌の少なくともいずれかに対する医薬を提供する。

【特許請求の範囲】**【請求項 1】**

A P P 遺伝子及び E B A G 9 遺伝子の少なくともいずれかの発現を抑制するための二本鎖核酸分子であって、

(a) 配列番号 : 1 ~ 配列番号 : 2 1 のいずれかの標的配列に対応するヌクレオチド配列を有するセンス鎖と、

(b) 前記 (a) のセンス鎖に相補的なヌクレオチド配列を有するアンチセンス鎖と、を含むことを特徴とする二本鎖核酸分子。

【請求項 2】

センス鎖が、配列番号 : 1、配列番号 : 2、配列番号 : 1 5 のいずれかの標的配列に対応するヌクレオチド配列を有するセンス鎖である請求項 1 に記載の二本鎖核酸分子。 10

【請求項 3】

センス鎖が、配列番号 : 2、及び、配列番号 : 1 5 のいずれかの標的配列に対応するヌクレオチド配列を有するセンス鎖である請求項 2 に記載の二本鎖核酸分子。

【請求項 4】

二本鎖 R N A 及び二本鎖 R N A - D N A キメラの少なくともいずれかである請求項 1 から 3 のいずれかに記載の二本鎖核酸分子。

【請求項 5】

二本鎖 R N A が、 s i R N A である請求項 4 に記載の二本鎖核酸分子。

【請求項 6】

請求項 1 から 5 のいずれかに記載の二本鎖核酸分子をコードするヌクレオチド配列を含むことを特徴とする D N A 。 20

【請求項 7】

請求項 6 に記載の D N A を含むことを特徴とするベクター。

【請求項 8】

前立腺癌細胞、膀胱癌細胞、肺癌細胞、大腸癌細胞、肝癌細胞、子宮癌細胞、乳癌細胞、皮膚癌細胞、及び腎癌細胞の少なくともいずれかの増殖を抑制するための癌細胞増殖抑制剤であって、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の二本鎖核酸分子、請求項 6 に記載の D N A、及び、請求項 7 に記載のベクターの少なくともいずれかを含むことを特徴とする癌細胞増殖抑制剤。 30

【請求項 9】

前立腺癌、膀胱癌、肺癌、大腸癌、肝癌、子宮癌、乳癌、皮膚癌、及び腎癌の少なくともいずれかを予防乃至治療するための医薬であって、請求項 8 に記載の癌細胞増殖抑制剤を含むことを特徴とする医薬。

【発明の詳細な説明】**【技術分野】****【0001】**

本発明は、前立腺癌、膀胱癌、肺癌、大腸癌、肝癌、子宮癌、乳癌、皮膚癌、及び腎癌の予防乃至治療に好適な、 s i R N A 等の二本鎖核酸分子、前記二本鎖核酸分子を含む癌細胞増殖抑制剤、並びに、前記癌細胞増殖抑制剤を含む医薬に関する。 40

【背景技術】**【0002】**

前立腺癌は、男性に特異的ながんであり、我が国においては、特に近年、増加傾向が著しいことが報告されている。前立腺癌は、男性ホルモン（アンドロゲン）と深い関係があることが知られている。

また、膀胱癌は、前立腺癌と同じく増加傾向にあり、特に、女性に比べて男性において多く発症することが特徴として知られている。

従来、これらの泌尿器系のがんに対し、外科的に臓器を摘出する治療方法が行われている。前立腺癌に対しては、抗アンドロゲン製剤を投与する治療方法が行われている。しかしながら、臓器を摘出する治療方法では、患者の Q O L が著しく低下してしまうことが問 50

