

【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19年5月17日(2007.5.17)

【公表番号】特表2002-539265(P2002-539265A)

【公表日】平成14年11月19日(2002.11.19)

【出願番号】特願2000-606246(P2000-606246)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/711 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/48

A 6 1 K 31/711

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月19日(2007.3.19)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】配列AACGTTATの非メチル化オクタマーCGモチーフを少なくとも1つ含んでなる安定化オリゴヌクレオチドを少なくとも1つ含んでなる抗腫瘍薬。

【請求項2】安定化オリゴヌクレオチドが、SEQ ID NO: 9、10、16、21、31、33、34、35および37の配列からなる群から選択されることを特徴とする請求項1に記載の抗腫瘍薬。

【請求項3】非メチル化オクタマーCGモチーフのシトシンの少なくとも1つが、改変したシトシンと置換されていることを特徴とする請求項1または2のいずれかに記載の抗腫瘍薬。

【請求項4】安定化オリゴヌクレオチドが、ホスホロチオエート、ホスホジチオエート、ホスホジエステル-ホスホロチオエート混合オリゴヌクレオチド、メチルホスホネート及び少なくとも1つの末端が安定化されているオリゴヌクレオチドからなる群から選択されることを特徴とする請求項1～3のいずれか1つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項5】安定化オリゴヌクレオチドが、二本鎖または二本鎖であることを特徴とする請求項1～4のいずれか1つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項6】安定化オリゴヌクレオチドが、少なくとも8つのヌクレオチド、好ましくは20～100のヌクレオチドを含んでなることを特徴とする請求項1～5のいずれか1つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項7】安定化オリゴヌクレオチドが、腫瘍親和性を高めることができ可能な分子に共有結合、イオン結合または弱い結合によって結合されることを特徴とする請求項1～6のいずれか1つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項8】癌の性質および退形成の程度にかかわらず、ヒトの癌治療を目的とする請求項1～7のいずれか1つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項9】癌が、中枢神経系および末梢神経系の癌からなる群から選択されることを特徴とする請求項8に記載の抗腫瘍薬。

【請求項10】癌が、星状細胞腫、膠芽腫、髓芽腫、神経芽腫、黒色腫および癌腫からなる群から選択されることを特徴とする請求項8に記載の抗腫瘍薬。

【請求項 1 1】腫瘍内に投与されることを特徴とする請求項 8 ~ 1 0 のいずれか 1 つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項 1 2】少なくとも腫瘍塊の一部で、腫瘍 1 g に対して 10 ~ 1000  $\mu$ g の用量になるように投与されることを特徴とする請求項 1 1 に記載の抗腫瘍薬。

【請求項 1 3】静脈内、腹腔内、局所、経皮、皮下、動脈内、肺、鼻咽腔、または経口の経路からなる群から選択される経路によって投与されることを特徴とする請求項 8 ~ 1 0 のいずれか 1 つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項 1 4】腫瘍部位において有効用量の達成を容易にする物理的手段により投与されるかまたは腫瘍部位において有効用量の達成を容易にする化学的手段との組合せで投与されることを特徴とする請求項 8 ~ 1 3 のいずれか 1 つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項 1 5】医薬的に許容される形態で投与されることを特徴とする請求項 8 ~ 1 4 のいずれか 1 つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項 1 6】安定化オリゴヌクレオチドが、免疫系の細胞、免疫学的アジュvant、サイトカイン、抗腫瘍抗体、腫瘍抽出物、腫瘍抗原あるいは通常の腫瘍細胞、照射された腫瘍細胞または遺伝子的に改変された腫瘍細胞と組み合わされることを特徴とする請求項 8 ~ 1 5 のいずれか 1 つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項 1 7】安定化オリゴヌクレオチドが、隣接するかまたは他の様式で、配列 AACGTTAT の非メチル化オクタマー - CG モチーフを複数含んでなることを特徴とする請求項 1 ~ 1 6 のいずれか 1 つに記載の抗腫瘍薬。

【請求項 1 8】安定化オリゴヌクレオチドが配列 AACGTTAT の非メチル化オクタマー - CG モチーフを 2 つまたは 3 つ含んでなることを特徴とする請求項 1 7 に記載の抗腫瘍薬。

【請求項 1 9】配列 AACGTTAT の非メチル化オクタマー - CG モチーフを少なくとも 1 つ含んでなる 20 ~ 1000 のヌクレオチドまたは塩基対からなるオリゴヌクレオチド。

【請求項 2 0】SEQ ID NO: 9、10、16、21、31、33、34、35 および 37 の配列からなる群から選択される請求項 1 9 に記載のオリゴヌクレオチド。

【請求項 2 1】一本鎖または二本鎖である請求項 1 9 または 2 0 のいずれかに記載のオリゴヌクレオチド。

【請求項 2 2】安定化されている請求項 1 9 ~ 2 1 のいずれか 1 つに記載のオリゴヌクレオチド。

【請求項 2 3】ホスホロチオエート、ホスホジチオエート、ホスホジエステル - ホスホロチオエート混合物、メチルホスホネートおよび 3' または 5' 末端での安定化からなる群から選択される改変主鎖により安定化されている請求項 2 2 に記載のオリゴヌクレオチド。