

【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27年7月2日 (2015.7.2)

【公表番号】特表2014-516977(P2014-516977A)

【公表日】平成26年7月17日 (2014.7.17)

【年通号数】公開・登録公報2014-038

【出願番号】特願2014-513133(P2014-513133)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/713 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 48/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/4706 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/713

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 48/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 5/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 1/16

A 6 1 K 31/4706

C 1 2 N 15/00 Z N A A

【手続補正書】

【提出日】平成27年5月8日 (2015.5.8)

【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】

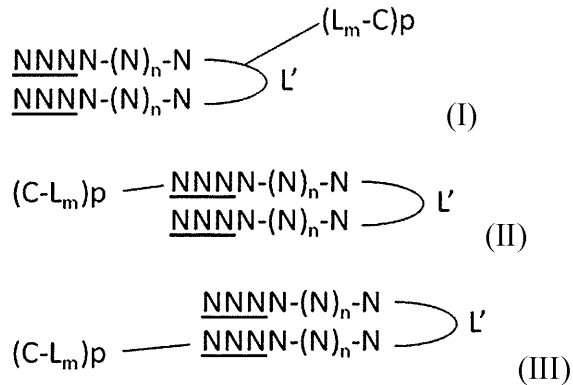
【請求項 1】

温熱処置と組み合わせてガンを処置するための医薬の調製のための核酸分子の使用であって、少なくとも 1 つの自由末端と、ヒトゲノムの遺伝子と 60 % 未満の配列同一性を有する 24 ~ 200 bp の DNA 二本鎖部分とを有する、核酸分子の使用。

【請求項 2】

核酸分子が、下記式：

【化 1 3】

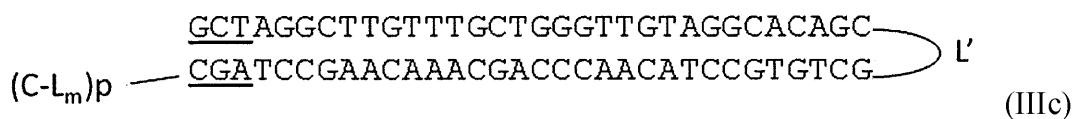
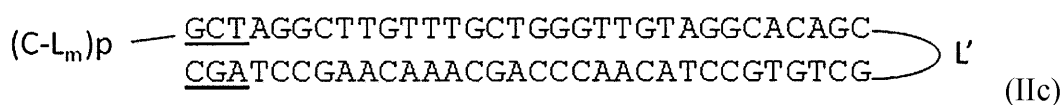
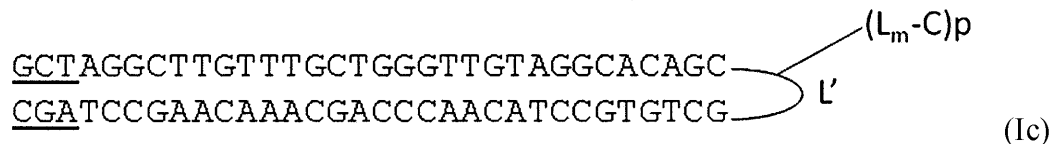
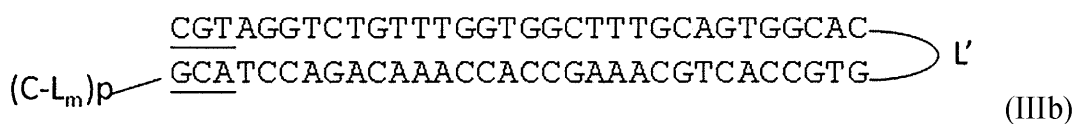
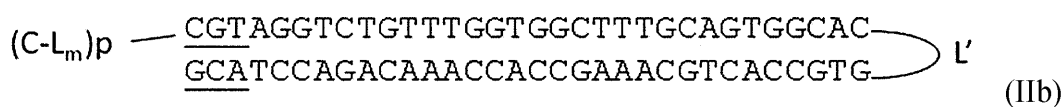
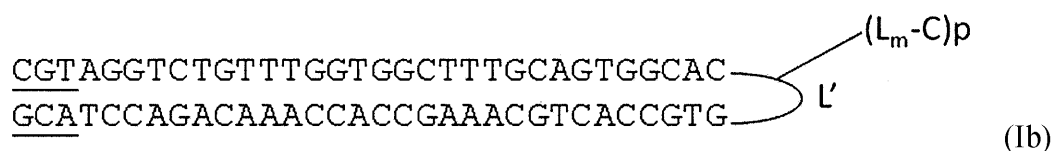
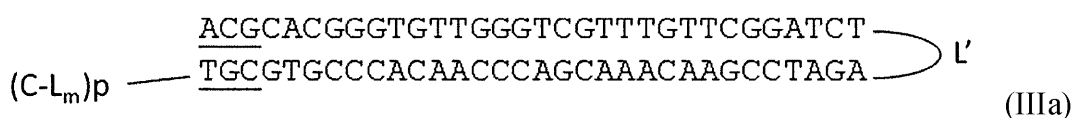
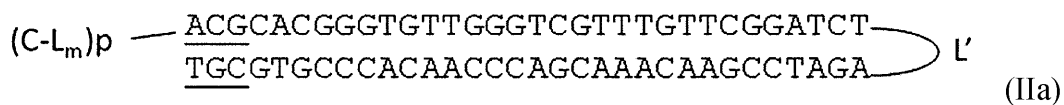
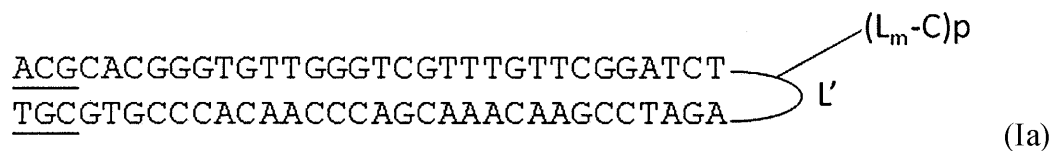


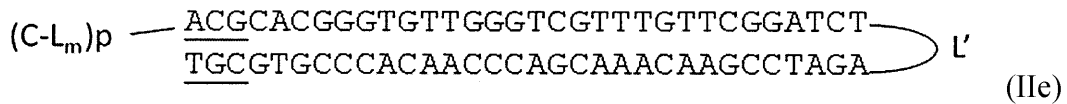
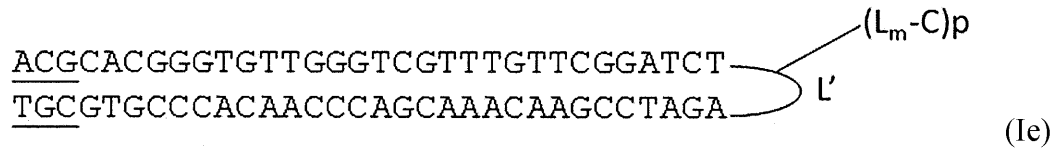
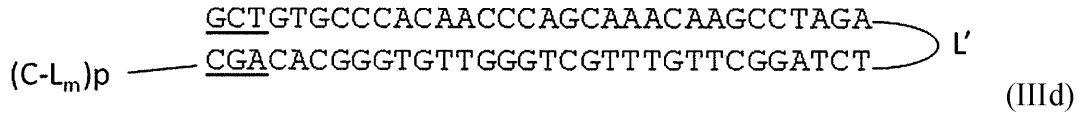
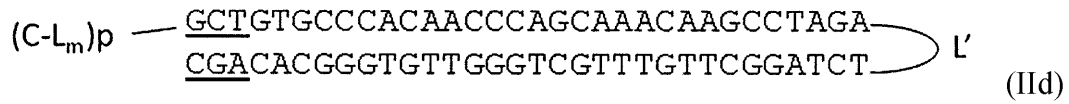
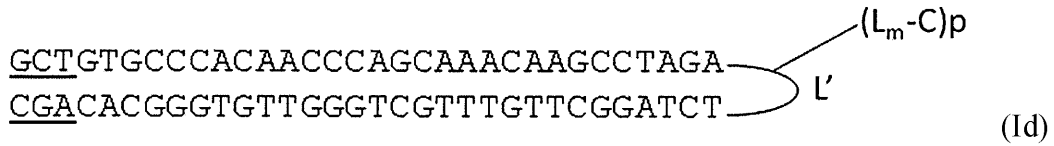
(式中、Nは、デオキシヌクレオチドであり、nは、15 ~ 195の整数であり、下線部のNは、改変ホスホジエステル骨格を有するか、又は有しないヌクレオチドを指し、L'は、リンカーであり、Cは、脂溶性分子又は細胞レセプターをターゲティングしてレセプター介在性エンドサイトーシスを可能にするリガンドから選択されるエンドサイトーシスを促進する分子であり、Lは、リンカーであり、m及びpは独立して、0又は1の整数である)の1つを有する、請求項1に記載の使用。

【請求項 3】

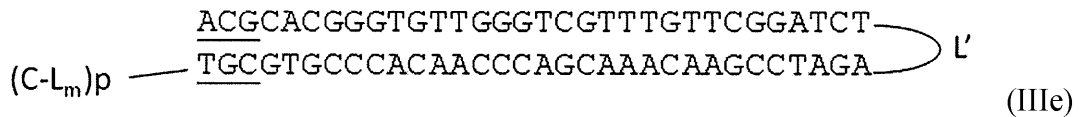
核酸分子が、下記式：

【化 1 4】





及び、



(式中、下線部のヌクレオチドは、ホスホリチオエート又はメチルホスホネート骨格を有するヌクレオチドを指し、連結された $L'$ は、ヘキサエチレングリコール、テトラデオキシチミジレート(T4)及び2,19-ビス(ホスホル)-8-ヒドラザ-1-ヒドロキシ-4-オキサ-9-オキソ-ノナデカンからなる群より選択され； $m$ は、1であり、 $L$ は、カルボキサミドオリゴエチレングリコールであり、 $C$ は、単鎖又は二本鎖脂肪酸、例えばオクタデシル及びジオレオイル、コレステロール、トコフェロール、葉酸、糖、例えばガラクトース及びマンノース及びそれらのオリゴ糖、ペプチド、例えばRGD及びボンベシン並びにタンパク質、例えばインテグリンからなる群より選択され、好ましくは、コレステロールである)の1つを有する、請求項1又は2に記載の使用。

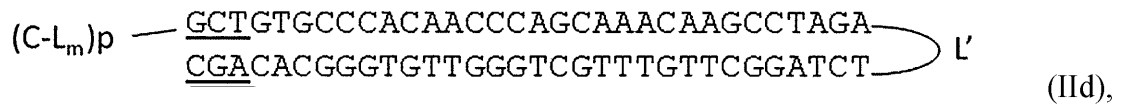
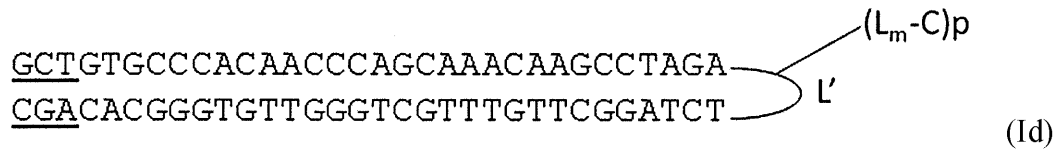
【請求項4】

エンドサイトーシスを促進する分子がコレステロールである、請求項1～3のいずれか一項に記載の使用。

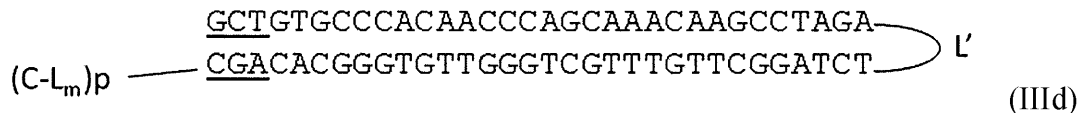
【請求項5】

核酸分子が、

## 【化 1 5】



及び

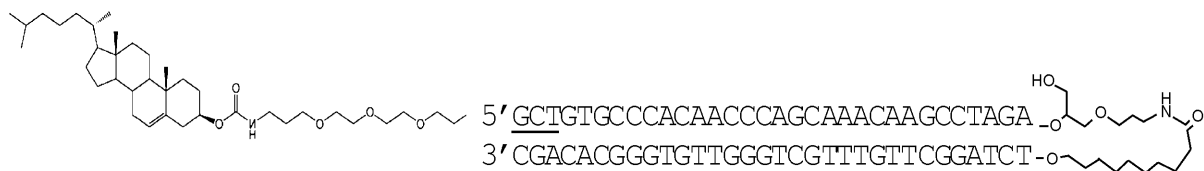


からなる群より選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 6】

核酸分子が、

## 【化 1 6】



である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 7】

温熱処置が、少なくとも 4 1、好ましくは少なくとも 4 2 の温度を含む、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 8】

温熱処置が、マイクロ波 (RFA)、超音波、赤外線、ナノ粒子若しくはナノチューブ、誘導加熱、磁気温熱療法、予熱された液体、例えば血液の灌流若しくは注入、腹腔内の液流の加熱又は直接加熱によって実施される、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 9】

ガンが、好ましくは、肉腫、メラノーマ、並びに頭頸部、腎臓、卵巣、脾臓、前立腺、甲状腺、肺、食道、乳房、膀胱、結腸直腸、肝臓、頸部のガン、並びに子宮内膜ガン及び腹膜ガン、より好ましくは肝臓ガン及び腹膜ガンから選択される固形ガンである、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 10】

p が 1 であり、エンドソーム溶解剤、好ましくはキノリンエンドソーム溶解剤、より好ましくはクロロキン又はヒドロキシクロロキンと組み合わせて使用される、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 11】

核酸分子が、放射線療法及び / 又は抗腫瘍化学療法と組み合わせて使用される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 12】

抗腫瘍化学療法が、直接的又は間接的な DNA 損傷抗腫瘍剤による処置である、請求項 11 に記載の使用。

## 【請求項 13】

DNA 損傷抗腫瘍剤が、トポイソメラーゼ I 又は II の阻害剤、DNA 架橋剤、DNA アルキル化剤、代謝拮抗剤及び有糸分裂紡錘体の阻害剤からなる群より選択される、請求項 12 に記載の使用。

## 【請求項 14】

核酸分子が、放射線療法及び / 又は抗腫瘍化学療法と組み合わせて使用されない、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 15】

核酸分子が、放射線療法及び / 又は DNA 損傷抗腫瘍剤による抗腫瘍化学療法と組み合わせて使用されない、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の使用。