

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-525922(P2004-525922A)

【公表日】平成 16 年 8 月 26 日 (2004.8.26)

【年通号数】公開・登録公報 2004-033

【出願番号】特願 2002-573034(P2002-573034)

【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 38/00

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00

// C 0 7 K 7/06

【F I】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 K 7/06 Z N A

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 3 月 10 日 (2005.3.10)

【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】

以下の成分：

・ ボツリヌス毒素、ブチリカム毒素、破傷風毒素またはその変異体の軽鎖またはそのフラグメントを含んでなる軽鎖成分；

・ ボツリヌス毒素、ブチリカム毒素、破傷風毒素またはその変異体の重鎖または改変重鎖を含んでなる移行成分；および

・ G n R H 受容体に選択的に結合する標的化成分；
を含んでなる薬剤。

【請求項 2】

軽鎖成分が、細胞からのホルモンの放出を減少させる請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 3】

軽鎖成分が、ボツリヌス毒素 A、B、C₁、D、E、F、G 型またはその変異体の軽鎖またはそのフラグメントを含んでなる請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 4】

軽鎖成分が、ボツリヌス毒素 A 型の軽鎖を含んでなる請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 5】

移行成分が、細胞質への少なくとも軽鎖成分の移行を促進する請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 6】

移行成分が、ボツリヌス毒素 A、B、C₁、D、E、F、G 型またはその変異体の重鎖または改変重鎖を含んでなる請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 7】

移行成分が、ボツリヌス毒素 A 型の重鎖または改変重鎖を含んでなる請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 8】

改変重鎖が、重鎖の少なくともアミノ末端フラグメントを含んでなる請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 9】

標的化成分が、アミノ酸成分を含んでなる請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 10】

アミノ酸成分が、GnRH 受容体に選択的に結合する抗体の可変領域を含んでなる請求項 9 に記載の薬剤。

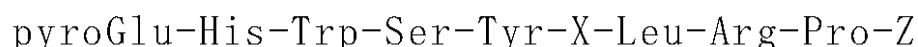
【請求項 11】

アミノ酸成分が、ペプチドを含んでなる請求項 9 に記載の薬剤。

【請求項 12】

ペプチドが、配列：

【化 1】



[配列中、X は、グリシン、リシン、D-リシン、オルニチン、D-オルニチン、グルタミン酸、D-グルタミン酸、アスパラギン酸、D-アスパラギン酸、システイン、D-システイン、チロシンおよび D-チロシンからなる群から選択されるアミノ酸であり；

Z は、Gly-NH₂、エチルアミドおよび Aza-Gly-NH₂ からなる群から選択される置換基である]

を含んでなる請求項 11 に記載の薬剤。

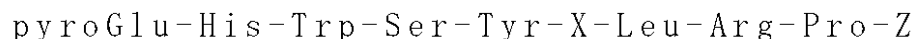
【請求項 13】

X が D-Lys であり、Z がエチルアミドである請求項 12 に記載の薬剤。

【請求項 14】

ペプチドが、アミノ酸配列：

【化 2】



[配列中、X は、グリシン、リシン、D-リシン、オルニチン、D-オルニチン、グルタミン酸、D-グルタミン酸、アスパラギン酸、D-アスパラギン酸、システイン、D-システイン、チロシンおよび D-チロシンからなる群から選択されるアミノ酸であり；

Z は、Gly-NH₂、エチルアミドおよび Aza-Gly-NH₂ からなる群から選択される置換基である]

の少なくとも 5 個の連続アミノ酸を含んでなる請求項 11 に記載の薬剤。

【請求項 15】

ペプチドが、アミノ酸配列の少なくとも 6 個の連続アミノ酸を含んでなる請求項 14 に記載の薬剤。

【請求項 16】

ペプチドが、アミノ酸配列の少なくとも 7 個の連続アミノ酸を含んでなる請求項 14 に記載の薬剤。

【請求項 17】

ペプチドが、アミノ酸配列の少なくとも 8 個の連続アミノ酸を含んでなる請求項 14 に記載の薬剤。

【請求項 18】

軽鎖成分、移行成分および標的化成分が、リンカーによって互いに結合している請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 19】

軽鎖成分が、ボツリヌス毒素 A 型の軽鎖であり、移行成分が、細胞質への少なくとも軽鎖の移行を促進しうるボツリヌス毒素 A 型の重鎖のアミノ末端フラグメントであり、標的化成分が、PyroGlu-His-Trp-Ser-Tyr-D-Lys-Leu-Arg-Pro-エチルアミドである請求項 12 に記載の薬剤。

【請求項 20】

血液脳関門を越える薬剤の移行を促進するのに有効な促進剤成分に結合させた請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 21】

ヒトを含む哺乳動物のゴナドトロピン関連疾患を治療するのに有用な請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 22】

ゴナドトロピン関連疾患が、乳癌、前立腺癌、膵臓癌、子宮内膜症、子宮内膜癌および性的早熟からなる群から選択される請求項 21 に記載の薬剤。