



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2015125549, 27.11.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
28.11.2012 US 61/730,763

(43) Дата публикации заявки: 11.01.2017 Бюл. № 02

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 29.06.2015(86) Заявка РСТ:
US 2013/072359 (27.11.2013)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2014/085674 (05.06.2014)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО
"Юридическая фирма Городиский и Партнеры"

(71) Заявитель(и):

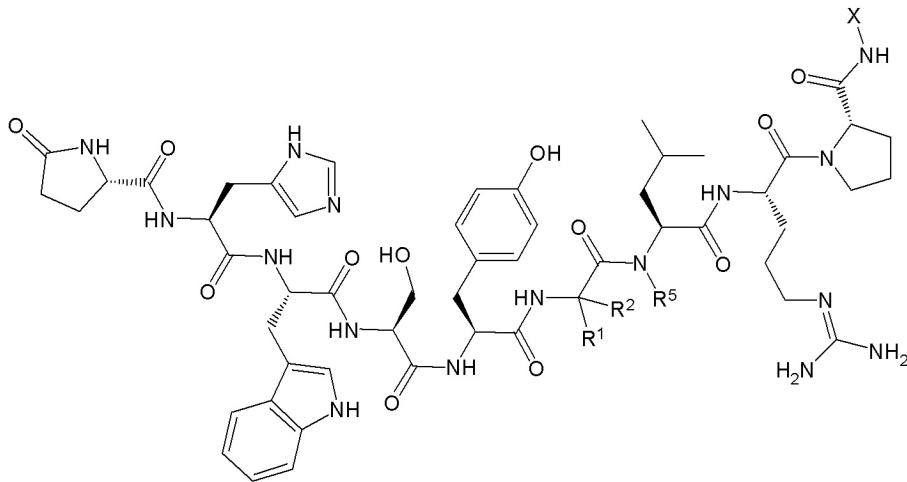
**ДЖЕЙБИЭС ЮНАЙТИД ЭНИМАЛ
ХЭЛС П ЛЛК (US)**

(72) Автор(ы):

**УЭБЕЛ Стефен Кент (US),
СВОНСОН Марк Э. (US),
КРЭЛИНГ Роберт Р. (US),
ДЖОНСТОН Майкл Э. (US)****(54) СПОСОБ ДЛЯ СИНХРОНИЗАЦИИ ВРЕМЕНИ ОСЕМЕНЕНИЯ МОЛОДЫХ СВИНЕЙ****(57) Формула изобретения**

1. Способ синхронизации времени овуляции молодой свиньи, включающий стадии: введения молодой свиньи гормона для синхронизации эструса; введения молодой свиньи единичной дозы гонадотропин-рилизинг гормона для синхронизации овуляции без введения любого другого гормона для синхронизации овуляции, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят на пятый день после последнего ежедневного введения гормона для синхронизации эструса; и осеменения молодой свиньи без контроля эструса только один раз на шестой день после последнего ежедневного введения гормона для синхронизации эструса.
2. Способ по п. 1, в котором гонадотропин-рилизинг гормон имеет формулу

A
6
5
5
2
1
5
1
0
2
RURU
2
0
1
5
1
2
5
5
4
9
A



или его сольват, гидрат или фармацевтически приемлемая соль, в которой

R^1 и R^2 представляют собой независимо друг от друга в каждом случае водород или независимо друг от друга выбраны из группы, состоящей из алкила, гетероалкила, циклоалкила, гетероциклоалкила, галогеналкила, арила, гетероарила, арилалкила и гетероарилалкила, каждый из которых является необязательно замещенным, или R^1 и R^2 и присоединенный углерод образуют карбоцикл или гетероцикл;

R^5 представляет собой водород или алкил; и

X представляет собой водород, или X выбран из группы, состоящей из алкила, циклоалкила, гетероалкила, необязательно замещенного алкилен-карбоксамидом и $HNC(O)NR^3R^4$, в которой R^3 и R^4 в каждом случае независимо друг от друга выбраны из группы, состоящей из водорода, алкила, гетероалкила и галогеналкила.

3. Способ по п. 2, в котором гонадотропин-рилизинг гормон выбран из группы, состоящей из соединений формулы по п. 2, в которой

a) R^1 представляет собой 1H-индол-3-илметил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой $CH_2(CO)NH_2$, R^5 представляет собой водород, и конфигурация углерода, к которому присоединен R^1 , представляет собой R;

b) R^1 представляет собой водород, R^2 представляет собой водород, X представляет собой $CH_2(CO)NH_2$, и R^5 представляет собой водород;

c) R^1 представляет собой 1H-1-бензилимидазол-4-илметил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой этил, и R^5 представляет собой водород;

d) R^1 представляет собой 2-метилпропил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой этил, и R^5 представляет собой водород;

e) R^1 представляет собой 2-нафтилметил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой $CH_2(CO)NH_2$, и R^5 представляет собой водород;

f) R^1 представляет собой трет-бутоксиметил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой этил, R^5 представляет собой водород, и конфигурация углерода, к которому присоединен R^1 , представляет собой R;

g) R^1 представляет собой бензил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой $CH_2(CO)NH_2$, R^5 представляет собой водород, и конфигурация углерода, к

которому присоединен R^1 , представляет собой R;

h) R^1 представляет собой трет-бутоксиметил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой $\text{HN}(\text{CO})\text{NH}_2$, и R^5 представляет собой водород;

i) R^1 представляет собой 1Н-индол-3-илметил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой этил, и R^5 представляет собой водород;

j) R^1 представляет собой метил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой водород, R^5 представляет собой водород, и конфигурация углерода, к которому присоединен R^1 , представляет собой R;

к) R^1 представляет собой 1Н-индол-3-илметил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой этил, R^5 представляет собой метил, и конфигурация углерода, к которому присоединен R^1 , представляет собой R;

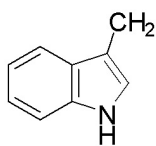
л) R^1 представляет собой метил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой $\text{CH}_2(\text{CO})\text{NH}_2$, R^5 представляет собой водород, и конфигурация углерода, к которому присоединен R^1 , представляет собой R;

м) R^1 представляет собой 4-аминобутил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой $\text{HN}(\text{CO})\text{NH}_2$, R^5 представляет собой водород, и конфигурация углерода, к которому присоединен R^1 , представляет собой R;

н) R^1 представляет собой метил, R^2 представляет собой метил, X представляет собой $\text{HN}(\text{CO})\text{NH}_2$, и R^5 представляет собой водород; и

о) R^1 представляет собой этил, R^2 представляет собой водород, X представляет собой водород, R^5 представляет собой водород, и конфигурация углерода, к которому присоединен R^1 , представляет собой R.

4. Способ по п. 2, в котором в формуле X представляет собой $\text{H}_2\text{CC}(\text{O})\text{NH}_2$, R_1 представляет собой водород, и R_2 представляет собой



5. Способ по п. 1, в котором гонадотропин-рилизинг гормон представляет собой трипторелин.

6. Способ по п. 5, в котором гормон, который синхронизирует эструс, представляет собой альтреногест.

7. Способ по любому из пп. 1-6, в котором осеменение представляет собой искусственное осеменение.

8. Способ по любому из пп. 1-6, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят в эффективном количестве, и эффективное количество гонадотропин-рилизинг гормона представляет собой приблизительно 200 мкг.

9. Способ по любому из пп. 1-6, в котором дозу гонадотропин-рилизинг гормона вводят с использованием способа, выбранного из группы, состоящей из применения катетера с депонированием, ручного введения и инъекции.

10. Способ по п. 9, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят с помощью катетера с депонированием.

11. Способ по п. 9, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят с помощью инъекции.

12. Способ по любому из пп. 1-6, в котором гонадотропин-рилизинг гормон находится в композиции, и композиция содержит метилпарабен в количестве приблизительно 0,09 мас.% на единицу объема, пропилпарабен в количестве приблизительно 0,01 мас.% на единицу объема, хлорид натрия в количестве приблизительно 0,91 мас.% на единицу объема, цитрат натрия в количестве приблизительно 0,186 мас.% на единицу объема, L-метионин в количестве приблизительно 0,1 мас.% на единицу объема, лимонную кислоту в количестве приблизительно 0,07 мас.% на единицу объема, трипторелин в количестве приблизительно 0,01 мас.% на единицу объема и метилцеллюлозу в количестве, которое обеспечивает вязкость от приблизительно 250 сП до приблизительно 400 сП.

13. Способ по любому из пп. 1-6, в котором гонадотропин-рилизинг гормон находится в эксципiente, выбранном из группы, состоящей из забуференного физиологического раствора, жидкого спирта, гликоля, раствора глюкозы, сложного эфира, амида и стерилизованной воды.

14. Способ по п. 13, в котором эксципиент дополнительно содержит рН-буферный агент, выбранный из группы, состоящей из ацетатного буфера, боратного буфера, карбонатного буфера, цитратного буфера, фосфатного буфера, хлористоводородной кислоты, гидроксида натрия, оксида магния, дигидрофосфата калия, бикарбоната, аммиака, угольной кислоты, цитрата натрия, лимонной кислоты, уксусной кислоты и моногидрофосфата натрия.

15. Способ по любому из пп. 1-6, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят через от приблизительно 125 до приблизительно 133 ч после последнего ежедневного введения гормона для синхронизации эструса.

16. Способ по любому из пп. 1-6, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят через от приблизительно 126 до приблизительно 130 ч после последнего ежедневного введения гормона для синхронизации эструса.

17. Способ по любому из пп. 1-6, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят через приблизительно 126 ч после последнего ежедневного введения гормона для синхронизации эструса.

18. Способ по любому из пп. 1-6, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят через приблизительно 128 ч после последнего ежедневного введения гормона для синхронизации эструса.

19. Способ по любому из пп. 1-6, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят через приблизительно 130 ч после последнего ежедневного введения гормона для синхронизации эструса.

20. Способ по любому из пп. 1-6, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят через приблизительно 132 ч после последнего ежедневного введения гормона для синхронизации эструса.

21. Способ по любому из пп. 1-6, в котором молодую свинью осеменяют через от приблизительно 24 до приблизительно 28 ч после введения гонадотропин-рилизинг гормона.

22. Способ по любому из пп. 1-6, в котором молодую свинью осеменяют через от приблизительно 20 до приблизительно 24 ч после введения гонадотропин-рилизинг гормона.

23. Способ по п. 21, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят через приблизительно 126 ч после последнего ежедневного введения гормона для

синхронизации эструса.

24. Способ по п. 22, в котором гонадотропин-рилизинг гормон вводят через приблизительно 126 ч после последнего ежедневного введения гормона для синхронизации эструса.

A 6 7 5 5 2 1 5 1 0 2 R U

R U 2 0 1 5 1 2 5 5 4 9 A