

【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1部門第1区分

【発行日】平成23年8月25日(2011.8.25)

【公表番号】特表2011-501941(P2011-501941A)

【公表日】平成23年1月20日(2011.1.20)

【年通号数】公開・登録公報2011-003

【出願番号】特願2010-514184(P2010-514184)

【国際特許分類】

C 1 2 N	15/09	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 K	7/06	(2006.01)
C 1 2 N	1/15	(2006.01)
C 1 2 N	1/19	(2006.01)
C 1 2 N	1/21	(2006.01)
C 1 2 N	5/10	(2006.01)
G 0 1 N	33/50	(2006.01)
G 0 1 N	33/15	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	5/00	(2006.01)
A 6 1 P	5/14	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	5/06	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	1/08	(2006.01)
A 6 1 P	37/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	7/10	(2006.01)
A 6 1 P	19/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 7/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 21/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/18 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/04 (2006.01)

## 【 F I 】

C 1 2 N 15/00 Z N A A  
 A 6 1 K 37/02  
 A 6 1 P 37/06  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 1/00  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 C 0 7 K 7/06  
 C 1 2 N 1/15  
 C 1 2 N 1/19  
 C 1 2 N 1/21  
 C 1 2 N 5/00 1 0 1  
 G 0 1 N 33/50 Z  
 G 0 1 N 33/15 Z  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 15/08  
 A 6 1 P 17/00  
 A 6 1 P 17/14  
 A 6 1 P 5/00  
 A 6 1 P 5/14  
 A 6 1 P 21/00  
 A 6 1 P 1/16  
 A 6 1 P 5/06  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 7/06  
 A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 25/06  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 1/08  
 A 6 1 P 37/00  
 A 6 1 P 9/12  
 A 6 1 P 7/10  
 A 6 1 P 19/00  
 A 6 1 P 13/12  
 A 6 1 P 19/06

A 6 1 P 7/00  
 A 6 1 P 21/04  
 A 6 1 P 1/18  
 A 6 1 P 1/02  
 A 6 1 P 17/04

【手続補正書】

【提出日】平成23年7月6日(2011.7.6)

【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】

式  $T_1 E_2 E_3 E_4 Q_5 Q_6 Y_7 L_8$  を特徴とする配列を含む化合物であって、ここで、該化合物は、25以下のアミノ酸長であり、該化合物は、インターロイキン23(IL-23)レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズし、ここで、

$T_1$  は、残基なし、トレオニン、フェニルアラニン、アラニンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖 または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸を定義し、

$E_2$ 、 $E_3$  および  $E_4$  は、各々独立して、残基なし、アラニン、グルタミン酸、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、セリン、ヒスチジン、ホモセリン、ベータ - ロイシン、ベータ - フェニルアラニン、アルファアミノアジピン酸および からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む 3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは1級アリアルアルキルアミンであり、

$Q_5$  および  $Q_6$  は、各々独立して、残基なし、アラニン、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、セリン、ホモセリン、アルファ - アミノアジピン酸および からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む 3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは1級アリアルアルキルアミンであり、

$Y_7$  は、残基なし、チロシン、フェニルアラニン、トリプトファン、アラニン、ヒスチジン、ピリジルアラニンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖または芳香族側鎖または複素環式芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸であり、そして

$L_8$  は、残基なし、ロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む アルファ - アミノ酸；1～10個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリアルアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリアルアルキルアミンである、化合物。

【請求項 2】

(a) 前記 疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸 が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニンまたはアリルグリシンである ；および / または

(b) 前記 1～10個の炭素の脂肪族アミン が、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - パレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである ；および / または

(c) 前記 芳香族アミンまたはアリアルアルキルアミン が、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである ；および / または

(d) 前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリーールアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリプタミンである；および/または

(e) 前記疎水性側鎖 または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニン、アリルグリシン、ナフチルアラニン、ピリジルアラニン、ヒスチジン、チロシン、アラニン、バリン、イソロイシン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンまたはであり、ここで、は、中性の脂肪族アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン、例えば、メチルアミン、イソ - プチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミン；芳香族アミンもしくはアリーールアルキルアミン、例えば、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミン；チロシン；4 - ヒドロキシフェニルグリシン；フェニルグリシン；ホモセリン；3, 4 - ジヒドロキシフェニルアラニン；または4 - クロロフェニルアラニンである；および/または

(f) 前記1級アリーールアルキルアミンが、ベンジルアミン、フェニルエチルアミン、2, 2 - ジフェニルエチルアミンまたは4 - フェニル - ベンジルアミンである、請求項1に記載の化合物。

### 【請求項3】

式  $M_1 E_2 E_3 S_4 K_5 Q_6 L_7 Q_8 L_9$  を特徴とする配列を含む化合物であって、ここで、該化合物は、25以下のアミノ酸長であり、該化合物は、インターロイキン23 (IL - 23) レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズし、ここで；

$M_1$  は、残基なし、メチオニン、バリン、ロイシン、アラニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリーールアルキルアミンであり；

$E_2$  および  $E_3$  は、各々独立して、残基なし、アラニン、グルタミン酸、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、セリン、ヒスチジン、ホモセリン、ベータ - ロイシン、ベータ - フェニルアラニン、アルファアミノアジピン酸、トリメシジン酸またはアルファ、オメガ - ジカルボン酸 (例えば、コハク酸、グルタル酸またはアゼライン酸) および からなる群から選択され、ここで、は、疎水性側鎖を含む3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは1級アリーールアルキルアミンであり；

$S_4$  は、残基なし、セリン、トレオニン、アロトレオニン、ヒドロキシプロリン、ベータ - ヒドロキシバリン、バリンおよび からなる群から選択され、ここで、は、中性の親水性アミノ酸であり；

$K_5$  は、残基なし、グルタミン、リシン、アルギニン、ヒスチジン、アラニン、オルニチン、シトルリン、2 - ピリジルアラニン、3 - ピリジルアラニン、4 - ピリジルアラニンおよびアルギニン代替物からなる群から選択され；

$Q_6$  は、残基なし、アラニン、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、セリンおよび からなる群から選択され、ここで、は、疎水性側鎖を含む3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは1級アリーールアルキルアミンであり；

$L_7$  は、残基なし、ロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリーールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリーールアルキルアミンであり；

$Q_8$  は、残基なし、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、セリンおよび からなる群から選択され、ここで、は、疎水性側鎖を含む3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは1級アリーールアルキルアミンであり；そして

$L_9$  は、残基なし、ロイシン、イソロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンである、化合物。

【請求項 4】

(a) 前記中性アミノ酸が、ヒドロキシバリン、ベータ , ベータ - ジアルキルセリン、ホモ - セリン、アロトレオニンまたはヒドロキシプロリンである；および / または

(b) 前記疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニンまたはアリルグリシンである；および / または

(c) 前記 1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである；および / または

(d) 前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである；および / または

(e) 前記アルギニン代替物が、4 - アミジノフェニルアセチル、4 - アミジノフェニルプロピオニル、4 - アミジノフェニルグリシル、4 - アミジノフェニルメチルグリシル、4 - グアニジノフェニルアセチル、4 - グアニジノフェニルプロピオニル、4 - グアニジノフェニルグリシルまたは 4 - グアニジノフェニルメチルグリシルである；および / または

(f) 前記 1 級アリールアルキルアミンが、ベンジルアミン、フェニルエチルアミン、2 , 2 - ジフェニルエチルアミンまたは 4 - フェニル - ベンジルアミンである；および / または

(g) 前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリールアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリプタミンである、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

式  $K_1 K_2 Y_3 L_4 V_5 W_6 V_7 Q_8$  を特徴とする配列を含む化合物であって、ここで、該化合物は、25 以下のアミノ酸長であり、該化合物は、インターロイキン 23 (IL - 23) レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズし、ここで；

$K_1$  および  $K_2$  は、各々独立して、残基なし、リシン、アルギニン、ヒスチジン、アラニン、オルニチン、シトルリン、2 - ピリジルアラニン、3 - ピリジルアラニン、4 - ピリジルアラニンおよびアルギニン代替物からなる群から選択され；

$Y_3$  は、残基なし、チロシン、フェニルアラニン、トリプトファン、アラニンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖 または芳香族側鎖または複素環式芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸であり；

$L_4$  は、残基なし、ロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンであり；

$V_5$  は、残基なし、バリン、ロイシン、アラニン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンであり；

$W_6$  は、残基なし、トリプトファン、チロシン、フェニルアラニン、アラニンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖 もしくは芳香族側鎖；または複素

環式芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸であり；

$V_7$  は、残基なし、バリン、ロイシン、アラニン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1～10個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンであり；そして

$Q_8$  は、残基なし、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、セリンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは1級アリールアルキルアミンである、

化合物。

【請求項6】

(a) 前記疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニンまたはアリルグリシンである；および / または

(b) 前記1～10個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである；および / または

(c) 前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである；および / または

(d) 前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリールアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリプタミンである；および / または

(e) 前記疎水性側鎖 または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニン、アリルグリシン、ナフチルアラニン、ピリジルアラニン、ヒスチジン、チロシン、アラニン、バリン、イソロイシン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンまたは であり、ここで、 は、中性脂肪族アミノ酸；1～10個の炭素の脂肪族アミン、例えば、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミン；芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン、例えば、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミン；チロシン；4 - ヒドロキシフェニルグリシン；フェニルグリシン；ホモセリン；3, 4 - ジヒドロキシフェニルアラニン；または4 - クロロフェニルアラニンである；および / または

(f) 前記アルギニン代替物が、4 - アミジノフェニルアセチル、4 - アミジノフェニルプロピオニル、4 - アミジノフェニルグリシル、4 - アミジノフェニルメチルグリシル、4 - グアニジノフェニルアセチル、4 - グアニジノフェニルプロピオニル、4 - グアニジノフェニルグリシルまたは4 - グアニジノフェニルメチルグリシルである；および / または

(g) 前記1級アリールアルキルアミンが、ベンジルアミン、フェニルエチルアミン、2, 2 - ジフェニルエチルアミンまたは4 - フェニル - ベンジルアミンである、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

式  $L_1P_2D_3E_4V_5T_6C_7V_8$  を特徴とする配列を含む化合物であって、ここで、該化合物は、25以下のアミノ酸長であり、該化合物は、インターロイキン23 (IL - 23) レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズし、ここで；

$L_1$  は、残基なし、ロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1～10個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミンであり；

P<sub>2</sub> は、残基なし、プロリン、アラニン、N - メチルグリシン、N - イソブチルグリシン、アミノイソ酪酸 ( A i b )、N - メチル - L - アラニン ( M e A l a )、t r a n s - 4 - ヒドロキシプロリン、ジエチルチアゾリジンカルボン酸 ( D t c ) および からなる群から選択され、ここでは、構造制約生成アミノ酸であり；

D<sub>3</sub> は、残基なし、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、グルタミン、セリン、ヒスチジン、ホモセリン、ベータ - ロイシン、ベータ - フェニルアラニン、アルファアミノアジピン酸および からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む 3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは 1 級アリーラルアルキルアミンであり；

E<sub>4</sub> は、残基なし、アラニン、グルタミン酸、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、セリン、ヒスチジン、ホモセリン、ベータ - ロイシン、ベータ - フェニルアラニン、アルファアミノアジピン酸および からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む 3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは 1 級アリーラルアルキルアミンであり；

V<sub>5</sub> は、残基なし、バリン、ロイシン、アラニン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリーラルアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリーラルアルキルアミンであり；

T<sub>6</sub> は、残基なし、トレオニン、フェニルアラニン、アラニンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖 または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸を定義し；

C<sub>7</sub> は、残基なし、システイン、セリン、ホモセリン、ホモシステイン、トレオニン、メチオニン、N - アセチルシステイン、シスタチオニン、2 - アミノブチレートおよび、 - ジメチルシステイン ( ペニシラミン ) からなる群から選択され；そして

V<sub>8</sub> は、残基なし、バリン、ロイシン、アラニン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリーラルアルキルアミンである、化合物。

#### 【請求項 8】

( a ) 前記疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、t e r t - ロイシン、シクロヘキシルアラニンまたはアリルグリシンである；および / または

( b ) 前記 1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - パレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである；および / または

( c ) 前記芳香族アミンまたはアリーラルアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである；および / または

( d ) 前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリーラルアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリプタミンである；および / または

( e ) 前記疎水性側鎖 または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、t e r t - ロイシン、シクロヘキシルアラニン、アリルグリシン、ナフチルアラニン、ピリジルアラニン、ヒスチジン、チロシン、アラニン、バリン、イソロイシン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンまたは であり、ここで、 は、中性脂肪族アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン、例えば、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - パレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミン；芳香族アミンもしくはアリーラルアルキルアミン、例えば、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまた

はフェニルエチルアミン；チロシン；4 - ヒドロキシフェニルグリシン；フェニルグリシン；ホモセリン；3 , 4 - ジヒドロキシフェニルアラニン；または4 - クロロフェニルアラニンである；および／または

( f ) 前記構造制約生成アミノ酸が、アゼチジン - 2 - カルボン酸、ピペコリン酸、イソニペコチン酸、4 - ( アミノメチル ) 安息香酸、2 - アミノ安息香酸またはニペコチン酸である；および／または

( g ) 前記1級アリールアルキルアミンが、ベンジルアミン、フェニルエチルアミン、2 , 2 - ジフェニルエチルアミンまたは4 - フェニル - ベンジルアミンである、請求項7に記載の化合物。

#### 【請求項9】

前記化合物が、前記配列のアミノ末端に付着された $G_1$ 、該配列のカルボキシ末端に付着された $G_2$ 、または該配列のアミノ末端に付着された $G_1$ および該配列のカルボキシ末端に付着された $G_2$ をさらに含み、ここで、 $G_1$ は、残基なし、水素、1 ~ 8個の炭素の直鎖または分枝鎖アルキル基およびアシル基からなる群から選択され、 $G_2$ は、残基なし、水素、 $NH_2$ 、1 ~ 10個の炭素の脂肪族アミン、芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンおよび複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリールアルキルアミンから選択され、必要に応じてここで、

( a ) 前記アシル基が、アセチル、プロピオニル、ブタニル、イソ - プロピオニルまたはイソ - ブタニルである；および／または

( b ) 前記1 ~ 10個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - パレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである；および／または

( c ) 前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである；および／または

( d ) 前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリールアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリプタミンである、請求項1、3、5または7のいずれか1項に記載の化合物。

#### 【請求項10】

前記化合物が、少なくとも1つのD - アミノ酸を含む、請求項1 ~ 9のいずれか1項に記載の化合物。

#### 【請求項11】

前記化合物が、配列TEEEQQYL ( 配列番号1 )、TAAEQQYL ( 配列番号7 )、TAAQQQYL ( 配列番号8 )、EEEQQQYL ( 配列番号9 )、AEEQQQYL ( 配列番号12 )、TEEEQ ( 配列番号15 )、TEEE ( 配列番号16 )、TEEEQAYL ( 配列番号17 )またはTEEEAAYL ( 配列番号18 )からなる、請求項1に記載の化合物、あるいは、

前記化合物が、配列MEESKQLQL ( 配列番号2 )、MAESKQLQL ( 配列番号19 )、MAASKQLQL ( 配列番号20 )、ESKQLQL ( 配列番号21 )、MEESKQLQI ( 配列番号22 )、MEESKQL ( 配列番号23 )、MEESKQ ( 配列番号24 )、MEESQQQLQI ( 配列番号25 )、EESKQLQL ( 配列番号26 )、VQAANALGMEESKQLQLHLDDLVL ( 配列番号27 )またはLVLDLHLQLQLKSEEMGLANAAQV ( 配列番号28 )からなる、請求項3に記載の化合物。

#### 【請求項12】

配列番号1 ~ 5のいずれか1つのアミノ酸配列をコードする単離された核酸配列を含む、ベクター。

#### 【請求項13】

請求項12に記載のベクターを含む細胞であって、例えば、原核細胞または真核細胞であり、そして必要に応じて請求項1から11までのいずれか1項に記載の化合物を発現す



る、細胞。

【請求項 14】

請求項 1 から 11 までのいずれか 1 項に記載の化合物を含む薬学的組成物。

【請求項 15】

自己免疫障害または炎症性障害、例えば、炎症性腸疾患、乾癬または多発性硬化症を処置する方法において使用するための請求項 1 から 11 までのいずれか 1 項に記載の化合物を含む組成物であって、該方法は、その必要のある被験体に、有効な用量の該組成物を投与する工程を包含し、必要に応じてここで、

(a) 該組成物が、抗炎症性化合物と組み合わせて投与される；および / または

(b) 該投与が、該組成物の経口投与を含む、組成物。

【請求項 16】

請求項 1 から 11 までのいずれか 1 項に記載の化合物がインターロイキン 23 レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズする能力を阻害するか、または増強する候補化合物を同定するインビトロでの方法であって、該方法は：

(i) 請求項 1 から 11 までのいずれか 1 項に記載の化合物の存在下において、該インターロイキン 23 レセプターを該候補化合物と接触させる工程；および

(ii) 該候補化合物と接触していないコントロールと比較して、該インターロイキン 23 レセプターの生物学的活性の増加または減少についてアッセイする工程であって、ここで、該コントロールと比較して該生物学的活性の減少は、該候補化合物が、請求項 1 から 11 までのいずれか 1 項に記載の化合物がインターロイキン 23 レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズする能力を増強することを示し、そして該コントロールと比較して該生物学的活性の増加は、該候補化合物が、請求項 1 から 11 までのいずれか 1 項に記載の化合物がインターロイキン 23 レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズする能力を阻害することを示す、工程

を包含し、必要に応じて、ここで、該化合物は、(a) 検出可能なシグナルを直接または間接的に提供する部分で標識されており、該部分は、例えば、(a) 放射標識、例えば  $^{125}\text{I}$ 、 $^{14}\text{C}$  または  $^3\text{H}$ ；または (b) アルカリホスファターゼまたは (c) 西洋ワサビペルオキシダーゼである、方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0046

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0046】

本発明の第 12 の局面の望ましい実施形態において、本発明の第 11 の局面の化合物は、検出可能なシグナルを直接または間接的に提供する部分で標識されている。望ましくは、その部分は、放射標識（例えば、 $^{125}\text{I}$ 、 $^{14}\text{C}$  または  $^3\text{H}$ ）であるか、またはその部分は、アルカリホスファターゼもしくは西洋ワサビペルオキシダーゼである。

本発明の好ましい実施形態では、例えば以下が提供される：

(項目 1)

式  $\text{T}_1\text{E}_2\text{E}_3\text{E}_4\text{Q}_5\text{Q}_6\text{Y}_7\text{L}_8$  を特徴とする配列を含む化合物であって、ここで、該化合物は、25 以下のアミノ酸長であり、該化合物は、インターロイキン 23 (IL-23) レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズし、ここで；

$\text{T}_1$  は、残基なし、トレオニン、フェニルアラニン、アラニンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖 または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸を定義し；

$\text{E}_2$ 、 $\text{E}_3$  および  $\text{E}_4$  は、各々独立して、残基なし、アラニン、グルタミン酸、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、セリン、ヒスチジン、ホモセリン、ベータ - ロイシン、ベータ - フェニルアラニン、アルファアミノアジピン酸および からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む 3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルフ

α - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは 1 級アリールアルキルアミンであり；  
Q<sub>5</sub> および Q<sub>6</sub> は、各々独立して、残基なし、アラニン、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、セリン、ホモセリン、アルファ - アミノアジピン酸および からの群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む 3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは 1 級アリールアルキルアミンであり；

Y<sub>7</sub> は、残基なし、チロシン、フェニルアラニン、トリプトファン、アラニン、ヒスチジン、ピリジルアラニンおよび からの群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖または芳香族側鎖または複素環式芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸であり；そして

L<sub>8</sub> は、残基なし、ロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からの群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンである、

化合物。

( 項目 2 )

前記化合物が、少なくとも 1 つの D - アミノ酸を含む、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 3 )

前記疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニンまたはアリルグリシンである、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 4 )

前記 1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 5 )

前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 6 )

前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリールアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリプタミンである、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 7 )

前記疎水性側鎖 または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニン、アリルグリシン、ナフチルアラニン、ピリジルアラニン、ヒスチジン、チロシン、アラニン、バリン、イソロイシン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンまたは であり、ここで、 は、中性の脂肪族アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；チロシン；4 - ヒドロキシフェニルグリシン；フェニルグリシン；ホモセリン；3, 4 - ジヒドロキシフェニルアラニン；または 4 - クロロフェニルアラニンである、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 8 )

前記 1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目 7 に記載の化合物。

( 項目 9 )

前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目 7 に記載の化合物。

( 項目 10 )

前記 1 級アリールアルキルアミンが、ベンジルアミン、フェニルエチルアミン、2, 2 - ジフェニルエチルアミンまたは 4 - フェニル - ベンジルアミンである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 1)

前記化合物が、配列 T E E E Q Q Y L (配列番号 1)、T A A E Q Q Y L (配列番号 7)、T A A A Q Q Y L (配列番号 8)、E E E Q Q Y L (配列番号 9)、A E E Q Q Y L (配列番号 12)、T E E E Q (配列番号 15)、T E E E (配列番号 16)、T E E E Q A Y L (配列番号 17) または T E E E A A Y L (配列番号 18) からなる、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 2)

少なくとも 1 つのアミノ酸が、D - アミノ酸である、項目 1 1 に記載の化合物。

(項目 1 3)

前記化合物が、前記配列のアミノ末端に付着された  $G_1$ 、該配列のカルボキシ末端に付着された  $G_2$ 、または該配列のアミノ末端に付着された  $G_1$  および該配列のカルボキシ末端に付着された  $G_2$  をさらに含み、ここで、 $G_1$  は、残基なし、水素、1 ~ 8 個の炭素の直鎖または分枝鎖アルキル基およびアシル基からなる群から選択され、 $G_2$  は、残基なし、水素、 $NH_2$ 、1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン、芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンおよびヘテロアリールアルキルアミンの複素環式芳香族からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 4)

前記アシル基が、アセチル、プロピオニル、ブタニル、イソ - プロピオニルまたはイソ - ブタニルである、項目 1 3 に記載の化合物。

(項目 1 5)

前記 1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目 1 3 に記載の化合物。

(項目 1 6)

前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目 1 3 に記載の化合物。

(項目 1 7)

前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリールアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリプタミンである、項目 1 3 に記載の化合物。

(項目 1 8)

式  $M_1 E_2 E_3 S_4 K_5 Q_6 L_7 Q_8 L_9$  を特徴とする配列を含む化合物であって、ここで、該化合物は、25 以下のアミノ酸長であり、該化合物は、インターロイキン 23 (IL - 23) レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズし、ここで、

$M_1$  は、残基なし、メチオニン、バリン、ロイシン、アラニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミンであり；

$E_2$  および  $E_3$  は、各々独立して、残基なし、アラニン、グルタミン酸、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、セリン、ヒスチジン、ホモセリン、ベータ - ロイシン、ベータ - フェニルアラニン、アルファアミノアジピン酸、トリメシジン酸またはアルファ、オメガ - ジカルボン酸 (例えば、コハク酸、グルタル酸またはアゼライン酸) および からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む 3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは 1 級アリールアルキルアミンであり；

$S_4$  は、残基なし、セリン、トレオニン、アロトレオニン、ヒドロキシプロリン、ベータ - ヒドロキシバリン、バリンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、中性の

親水性アミノ酸であり；

K<sub>5</sub> は、残基なし、グルタミン、リシン、アルギニン、ヒスチジン、アラニン、オルニチン、シトルリン、2 - ピリジルアラニン、3 - ピリジルアラニン、4 - ピリジルアラニンおよびアルギニン代替物からなる群から選択され；

Q<sub>6</sub> は、残基なし、アラニン、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、セリンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む 3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは 1 級アリールアルキルアミンであり；

L<sub>7</sub> は、残基なし、ロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンであり；

Q<sub>8</sub> は、残基なし、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、セリンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む 3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは 1 級アリールアルキルアミンであり；そして

L<sub>9</sub> は、残基なし、ロイシン、イソロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンである、

化合物。

( 項目 19 )

前記化合物が、少なくとも 1 つの D - アミノ酸を含む、項目 18 に記載の化合物。

( 項目 20 )

前記中性アミノ酸が、ヒドロキシバリン、ベータ , ベータ - ジアルキルセリン、ホモ - セリン、アトロネオンまたはヒドロキシプロリンである、項目 18 に記載の化合物。

( 項目 21 )

前記疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニンまたはアリルグリシンである、項目 18 に記載の化合物。

( 項目 22 )

前記 1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - パレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目 18 に記載の化合物。

( 項目 23 )

前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目 18 に記載の化合物。

( 項目 24 )

前記アルギニン代替物が、4 - アミジノフェニルアセチル、4 - アミジノフェニルプロピオニル、4 - アミジノフェニルグリシル、4 - アミジノフェニルメチルグリシル、4 - グアニジノフェニルアセチル、4 - グアニジノフェニルプロピオニル、4 - グアニジノフェニルグリシルまたは 4 - グアニジノフェニルメチルグリシルである、項目 18 に記載の化合物。

( 項目 25 )

前記 1 級アリールアルキルアミンが、ベンジルアミン、フェニルエチルアミン、2,2 - ジフェニルエチルアミンまたは 4 - フェニル - ベンジルアミンである、項目 18 に記載の化合物。

( 項目 2 6 )

前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリールアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリブタミンである、項目 1 8 に記載の化合物。

( 項目 2 7 )

前記化合物が、配列 M E E S K Q L Q L ( 配列番号 2 )、M A E S K Q L Q L ( 配列番号 1 9 )、M A A S K Q L Q L ( 配列番号 2 0 )、E S K Q L Q L ( 配列番号 2 1 )、M E E S K Q L Q I ( 配列番号 2 2 )、M E E S K Q L ( 配列番号 2 3 )、M E E S K Q ( 配列番号 2 4 )、M E E S Q Q L Q I ( 配列番号 2 5 )、E E S K Q L Q L ( 配列番号 2 6 )、V Q A A N A L G M E E S K Q L Q L H L D D L V L ( 配列番号 2 7 ) または L V L D D L H L Q L Q K S E E M G L A N A A Q V ( 配列番号 2 8 ) からなる、項目 1 8 に記載の化合物。

( 項目 2 8 )

少なくとも 1 つのアミノ酸が、D - アミノ酸である、項目 2 7 に記載の化合物。

( 項目 2 9 )

前記化合物が、前記配列のアミノ末端に付着された G<sub>1</sub>、該配列のカルボキシ末端に付着された G<sub>2</sub>、または該配列のアミノ末端に付着された G<sub>1</sub> および該配列のカルボキシ末端に付着された G<sub>2</sub> をさらに含み、ここで、G<sub>1</sub> は、残基なし、水素、1 ~ 8 個の炭素の直鎖または分枝鎖アルキル基およびアシル基からなる群から選択され、G<sub>2</sub> は、残基なし、水素、NH<sub>2</sub>、1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン、および芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンからなる群から選択される、項目 1 8 に記載の化合物。

( 項目 3 0 )

前記アシル基が、アセチル、プロピオニル、ブタニル、イソ - プロピオニルまたはイソ - ブタニルである、項目 2 9 に記載の化合物。

( 項目 3 1 )

前記 1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目 2 9 に記載の化合物。

( 項目 3 2 )

前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目 2 9 に記載の化合物。

( 項目 3 3 )

式 K<sub>1</sub> K<sub>2</sub> Y<sub>3</sub> L<sub>4</sub> V<sub>5</sub> W<sub>6</sub> V<sub>7</sub> Q<sub>8</sub> を特徴とする配列を含む化合物であって、ここで、該化合物は、25 以下のアミノ酸長であり、該化合物は、インターロイキン 23 ( IL - 23 ) レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズし、ここで、

K<sub>1</sub> および K<sub>2</sub> は、各々独立して、残基なし、リシン、アルギニン、ヒスチジン、アラニン、オルニチン、シトルリン、2 - ピリジルアラニン、3 - ピリジルアラニン、4 - ピリジルアラニンおよびアルギニン代替物からなる群から選択され、

Y<sub>3</sub> は、残基なし、チロシン、フェニルアラニン、トリプトファン、アラニンおよびからなる群から選択され、ここで、  
は、疎水性側鎖 または芳香族側鎖または複素環式芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸であり、

L<sub>4</sub> は、残基なし、ロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、  
は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンであり、

V<sub>5</sub> は、残基なし、バリン、ロイシン、アラニン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、  
は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンで

あり；

W<sub>6</sub>は、残基なし、トリプトファン、チロシン、フェニルアラニン、アラニンおよびからなる群から選択され、ここで、        は、疎水性側鎖もしくは芳香族側鎖；または複素環式芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸であり；

V<sub>7</sub>は、残基なし、バリン、ロイシン、アラニン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよびからなる群から選択され、ここで、        は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1 ~ 10個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリールアルキルアミンであり；そして

Q<sub>8</sub>は、残基なし、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、セリンおよびからなる群から選択され、ここで、        は、疎水性側鎖を含む3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは1級アリールアルキルアミンである、

化合物。

(項目34)

前記化合物は、少なくとも1つのD - アミノ酸を含む、項目33に記載の化合物。

(項目35)

前記疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニンまたはアリルグリシンである、項目33に記載の化合物。

(項目36)

前記1 ~ 10個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目33に記載の化合物。

(項目37)

前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目33に記載の化合物。

(項目38)

前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリールアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリプタミンである、項目33に記載の化合物。

(項目39)

前記疎水性側鎖または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニン、アリルグリシン、ナフチルアラニン、ピリジルアラニン、ヒスチジン、チロシン、アラニン、バリン、イソロイシン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンまたはであり、ここで、        は、中性脂肪族アミノ酸；1 ~ 10個の炭素の脂肪族アミン；芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミン；チロシン；4 - ヒドロキシフェニルグリシン；フェニルグリシン；ホモセリン；3, 4 - ジヒドロキシフェニルアラニン；または4 - クロロフェニルアラニンである、項目33に記載の化合物。

(項目40)

前記1 ~ 10個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目39に記載の化合物。

(項目41)

前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目39に記載の化合物。

(項目42)

前記アルギニン代替物が、4 - アミジノフェニルアセチル、4 - アミジノフェニルプロ

ピオニル、4 - アミジノフェニルグリシル、4 - アミジノフェニルメチルグリシル、4 - グアニジノフェニルアセチル、4 - グアニジノフェニルプロピオニル、4 - グアニジノフェニルグリシルまたは4 - グアニジノフェニルメチルグリシルである、項目33に記載の化合物。

(項目43)

前記1級アリールアルキルアミンが、ベンジルアミン、フェニルエチルアミン、2,2 - ジフェニルエチルアミンまたは4 - フェニル - ベンジルアミンである、項目33に記載の化合物。

(項目44)

前記化合物が、前記配列のアミノ末端に付着された $G_1$ 、該配列のカルボキシ末端に付着された $G_2$ 、または該配列のアミノ末端に付着された $G_1$ および該配列のカルボキシ末端に付着された $G_2$ をさらに含み、ここで、 $G_1$ は、残基なし、水素、1～8個の炭素の直鎖または分枝鎖アルキル基およびアシル基からなる群から選択され、 $G_2$ は、残基なし、水素、 $NH_2$ 、1～10個の炭素の脂肪族アミン、および芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンからなる群から選択される、項目33に記載の化合物。

(項目45)

前記アシル基が、アセチル、プロピオニル、ブタニル、イソ - プロピオニルまたはイソ - ブタニルである、項目44に記載の化合物。

(項目46)

前記1～10個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - パレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目44に記載の化合物。

(項目47)

前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目44に記載の化合物。

(項目48)

式 $L_1P_2D_3E_4V_5T_6C_7V_8$ を特徴とする配列を含む化合物であって、ここで、該化合物は、25以下のアミノ酸長であり、該化合物は、インターロイキン23(IL - 23)レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズし、ここで；

$L_1$ は、残基なし、ロイシン、アラニン、バリン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸；1～10個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリールアルキルアミンであり；

$P_2$ は、残基なし、プロリン、アラニン、N - メチルグリシン、N - イソブチルグリシン、アミノイソ酪酸(Aib)、N - メチル - L - アラニン(MeAla)、trans - 4 - ヒドロキシプロリン、ジエチルチアゾリジンカルボン酸(Dtc)および からなる群から選択され、ここで は、構造制約生成アミノ酸であり；

$D_3$ は、残基なし、アスパラギン酸、アスパラギン、グルタミン酸、グルタミン、セリン、ヒスチジン、ホモセリン、ベータ - ロイシン、ベータ - フェニルアラニン、アルファアミノアジピン酸および からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは1級アリールアルキルアミンであり；

$E_4$ は、残基なし、アラニン、グルタミン酸、グルタミン、アスパラギン酸、アスパラギン、セリン、ヒスチジン、ホモセリン、ベータ - ロイシン、ベータ - フェニルアラニン、アルファアミノアジピン酸および からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含む3 - アミノ - 5 - フェニルペンタン酸 - アルファ - アミノ酸、芳香族アミン、脂肪族アミンまたは1級アリールアルキルアミンであり；

$V_5$ は、残基なし、バリン、ロイシン、アラニン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ

ァ - アミノ酸； 1 ～ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリーラルアルキルアミン；または複素環式芳香族アミンもしくはヘテロアリーラルアルキルアミンであり；

T<sub>6</sub> は、残基なし、トレオニン、フェニルアラニン、アラニンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖 または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸を定義し；

C<sub>7</sub> は、残基なし、システイン、セリン、ホモセリン、ホモシステイン、トレオニン、メチオニン、N - アセチルシステイン、シスタチオニン、2 - アミノブチレートおよび、 - ジメチルシステイン（ペニシラミン）からなる群から選択され；そして

V<sub>8</sub> は、残基なし、バリン、ロイシン、アラニン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンおよび からなる群から選択され、ここで、 は、疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸； 1 ～ 10 個の炭素の脂肪族アミン；または芳香族アミンもしくはアリーラルアルキルアミンである、

化合物。

（項目 49）

前記化合物が、少なくとも 1 つの D - アミノ酸を含む、項目 48 に記載の化合物。

（項目 50）

前記疎水性側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニンまたはアリルグリシンである、項目 48 に記載の化合物。

（項目 51）

前記 1 ～ 10 個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目 48 に記載の化合物。

（項目 52）

前記芳香族アミンまたはアリーラルアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目 48 に記載の化合物。

（項目 53）

前記複素環式芳香族アミンまたはヘテロアリーラルアルキルアミンが、ピリジルアミン、ピリジルメチルアミンまたはトリプタミンである、項目 48 に記載の化合物。

（項目 54）

前記疎水性側鎖 または芳香族側鎖を含むアルファ - アミノ酸が、ノル - ロイシン、イソ - ロイシン、tert - ロイシン、シクロヘキシルアラニン、アリルグリシン、ナフチルアラニン、ピリジルアラニン、ヒスチジン、チロシン、アラニン、バリン、イソロイシン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、トリプトファンまたは であり、ここで、 は、中性脂肪族アミノ酸； 1 ～ 10 個の炭素の脂肪族アミン；芳香族アミンもしくはアリーラルアルキルアミン；チロシン；4 - ヒドロキシフェニルグリシン；フェニルグリシン；ホモセリン；3, 4 - ジヒドロキシフェニルアラニン；または 4 - クロロフェニルアラニンである、項目 48 に記載の化合物。

（項目 55）

前記 1 ～ 10 個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - バレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目 54 に記載の化合物。

（項目 56）

前記芳香族アミンまたはアリーラルアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目 54 に記載の化合物。

（項目 57）

前記構造制約生成アミノ酸が、アゼチジン - 2 - カルボン酸、ピペコリン酸、イソニペ



コチン酸、4 - (アミノメチル)安息香酸、2 - アミノ安息香酸またはニペコチン酸である、項目48に記載の化合物。

(項目58)

前記1級アリールアルキルアミンが、ベンジルアミン、フェニルエチルアミン、2,2 - ジフェニルエチルアミンまたは4 - フェニル - ベンジルアミンである、項目48に記載の化合物。

(項目59)

前記化合物が、前記配列のアミノ末端に付着されたG<sub>1</sub>、該配列のカルボキシ末端に付着されたG<sub>2</sub>、または該配列のアミノ末端に付着されたG<sub>1</sub>および該配列のカルボキシ末端に付着されたG<sub>2</sub>をさらに含み、ここで、G<sub>1</sub>は、残基なし、水素、1～8個の炭素の直鎖または分枝鎖アルキル基およびアシル基からなる群から選択され、G<sub>2</sub>は、残基なし、水素、NH<sub>2</sub>、1～10個の炭素の脂肪族アミン、および芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンからなる群から選択される、項目48に記載の化合物。

(項目60)

前記アシル基が、アセチル、プロピオニル、ブタニル、イソ - プロピオニルまたはイソ - ブタニルである、項目59に記載の化合物。

(項目61)

前記1～10個の炭素の脂肪族アミンが、メチルアミン、イソ - ブチルアミン、イソ - パレリルアミン、シクロペンチルアミン、シクロヘキシルメチルアミンまたはシクロヘキシルアミンである、項目59に記載の化合物。

(項目62)

前記芳香族アミンまたはアリールアルキルアミンが、アニリン、ナフチルアミン、ベンジルアミン、シンナミルアミンまたはフェニルエチルアミンである、項目59に記載の化合物。

(項目63)

配列番号1～5のいずれか1つのアミノ酸配列をコードする単離された核酸配列を含む、ベクター。

(項目64)

項目63に記載のベクターを含む細胞。

(項目65)

前記細胞が、原核細胞である、項目64に記載の細胞。

(項目66)

前記細胞が、真核細胞である、項目64に記載の細胞。

(項目67)

項目1から62までのいずれか1項に記載の化合物を発現する細胞。

(項目68)

前記細胞が、原核細胞である、項目67に記載の細胞。

(項目69)

前記細胞が、真核細胞である、項目67に記載の細胞。

(項目70)

項目1から62までのいずれか1項に記載の化合物を含む薬学的組成物。

(項目71)

自己免疫障害または炎症性障害を処置する方法であって、該方法は、その必要のある被験体に、有効な用量の項目1から62までのいずれか1項に記載の化合物を投与する工程を包含する、方法。

(項目72)

前記自己免疫障害または炎症性障害が、炎症性腸疾患、乾癬または多発性硬化症である、項目71に記載の方法。

(項目73)

前記化合物が、抗炎症性化合物と組み合わせて投与される、項目71に記載の方法。

( 項目 7 4 )

前記投与が、前記化合物の経口投与を含む、項目 7 1 に記載の方法。

( 項目 7 5 )

項目 1 から 6 2 までのいずれか 1 項に記載の化合物がインターロイキン 2 3 レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズする能力を阻害するか、または増強する候補化合物を同定する方法であって、該方法は：

( i ) 項目 1 から 6 2 までのいずれか 1 項に記載の化合物の存在下において、該インターロイキン 2 3 レセプターを該候補化合物と接触させる工程；および

( i i ) 該候補化合物と接触していないコントロールと比較して、該インターロイキン 2 3 レセプターの生物学的活性の増加または減少についてアッセイする工程であって、ここで、該コントロールと比較して該生物学的活性の減少は、該候補化合物が、項目 1 から 6 2 までのいずれか 1 項に記載の化合物がインターロイキン 2 3 レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズする能力を増強することを示唆し、そして該コントロールと比較して該生物学的活性の増加は、該候補化合物が、項目 1 から 6 2 までのいずれか 1 項に記載の化合物がインターロイキン 2 3 レセプターの生物学的活性をアンタゴナイズする能力を阻害することを示唆する、工程を包含する、方法。

( 項目 7 6 )

前記項目 1 から 6 2 までのいずれか 1 項に記載の前記化合物が、検出可能なシグナルを直接または間接的に提供する部分で標識されている、項目 7 5 に記載の方法。

( 項目 7 7 )

前記部分が、放射標識である、項目 7 6 に記載の方法。

( 項目 7 8 )

前記放射標識が、 $^{125}\text{I}$ 、 $^{14}\text{C}$ または $^3\text{H}$ である、項目 7 7 に記載の方法。

( 項目 7 9 )

前記部分が、アルカリホスファターゼまたは西洋ワサビペルオキシダーゼである、項目 7 6 に記載の方法。