

【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30年7月26日(2018.7.26)

【公表番号】特表2017-527538(P2017-527538A)

【公表日】平成29年9月21日(2017.9.21)

【年通号数】公開・登録公報2017-036

【出願番号】特願2017-502269(P2017-502269)

【国際特許分類】

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 2 3 K 20/142 (2016.01)

A 2 3 K 20/20 (2016.01)

【F I】

C 0 7 K 7/06 Z N A

A 6 1 P 15/00 1 7 1

A 6 1 P 5/00

A 6 1 K 38/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 3/00 1 7 1

A 2 3 K 20/142

A 2 3 K 20/20

【手続補正書】

【提出日】平成30年6月15日(2018.6.15)

【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 I :  $X_1 - NMeVal - X_4 - Leu - Met - Z$  (式 I) のペプチド模倣物であって、

前記ペプチド模倣物は 5 ~ 10 個のアミノ酸からなり、

$X_1$  は、1 ~ 6 個の天然または非天然のアミノ酸残基、および任意で N 末端のキャッピング部分または修飾、のストレッチであり、

NMeVal は、N - メチル - バリン残基または N - メチル - D - バリン残基であり、

$X_4$  は、 $n$  が 2 ~ 6 である  $-NH(CH_2)_n-CO-$  であり、

Z は、アミド化、アシル化、還元化またはエステル化されていてもよいペプチドの C 末端を表す、

ペプチド模倣物。

【請求項 2】

$X_1$  は、L 配置または D 配置の少なくとも 1 つの芳香族アミノ酸残基を含む、請求項 1

に記載のペプチド模倣物。

【請求項 3】

X<sub>1</sub> は、少なくとも 1 つの負電荷（酸性）アミノ酸残基を含む、請求項 1 に記載のペプチド模倣物。

【請求項 4】

X<sub>1</sub> は、芳香族残基と負電荷（酸性）残基と N 末端キャッピング部分とを含む 2 個または 3 個のアミノ酸残基からなる、請求項 1 に記載のペプチド模倣物。

【請求項 5】

X<sub>1</sub> は、脂肪族アミノ酸残基および極性非荷電残基から選択される残基を含む、請求項 4 に記載のペプチド模倣物。

【請求項 6】

X<sub>1</sub> は、Phe、DPhe、Trp および DTrp からなる群より選択される芳香族残基と、Glu および Asp から選択される負電荷（酸性）残基と、スクシニル（Succ）N 末端キャッピング部分と、を含む、請求項 1 に記載のペプチド模倣物。

【請求項 7】

X<sub>1</sub> は、Phe および DTrp から選択される芳香族残基と、Asp 残基と、スクシニル（Succ）N 末端キャッピング部分と、任意で Ile および Ser から選択される残基と、を含む、請求項 1 に記載のペプチド模倣物。

【請求項 8】

前記ペプチド模倣物は式 I I : X<sub>1</sub> - NMeVal - Ala - Leu - Met - NH<sub>2</sub>（式 I I）のものであり、X<sub>1</sub> は、Succ - Asp - Phe、Succ - Asp - DPhe、Succ - Asp - Trp、Succ - Asp - DTrp、Succ - Asp - Ile - Phe、Succ - Asp - Ile - DPhe、Succ - Asp - Ile - Trp、Succ - Asp - Ile - DTrp、Succ - Asp - Ser - Phe、Succ - Asp - Ser - DPhe、Succ - Asp - Ser - Trp、Succ - Asp - Ser - DTrp、Succ - Glu - Phe、Succ - Glu - DPhe、Succ - Glu - Trp、Succ - Glu - DTrp、Succ - Glu - Ile - Phe、Succ - Glu - Ile - DPhe、Succ - Glu - Ile - Trp、Succ - Glu - Ile - DTrp、Succ - Glu - Ser - Phe、Succ - Glu - Ser - DPhe、Succ - Glu - Ser - Trp、および Succ - Glu - Ser - DTrp からなる群より選択される、請求項 1 に記載のペプチド模倣物。

【請求項 9】

配列：NMeVal - Ala - Leu - Met（配列番号 7）を含む 5 ～ 10 個のアミノ酸残基からなる、請求項 1 に記載のペプチド模倣物。

【請求項 10】

前記ペプチド模倣物は、配列番号 7 の配列と、少なくとも 1 つの芳香族アミノ酸残基と、少なくとも 1 つの負電荷アミノ酸残基と、脂肪族アミノ酸残基および極性非荷電残基から選択される少なくとも 1 つの残基と、キャッピングされた N 末端と、を含む、請求項 9 に記載のペプチド模倣物。

【請求項 11】

前記ペプチド模倣物は、  
Succ - Asp - Ile - Phe - N(Me)Val - Ala - Leu - Met - NH<sub>2</sub>（配列番号 1）、  
Succ - Asp - Phe - N(Me)Val - Ala - Leu - Met - NH<sub>2</sub>（配列番号 2）、  
Succ - Asp - Ser - Phe - N(Me)Val - Ala - Leu - Met - NH<sub>2</sub>（配列番号 3）、  
Succ - Asp - Ile - D - Trp - N(Me)Val - Ala - Leu - Met - NH<sub>2</sub>（配列番号 4）、  
Succ - Asp - D - Trp - N(Me)Val - Ala - Leu - Met - NH<sub>2</sub>

(配列番号5)、および

Succ - Asp - Ser - D - Trp - N (Me) Val - Ala - Leu - Met - NH<sub>2</sub> (配列番号6)、

からなる群より選択され、ここでSuccはスクシニルを表す、請求項1に記載のペプチド模倣物。

【請求項12】

請求項1～11のいずれか1項に記載のペプチド模倣物を含む組成物。

【請求項13】

少なくとも1種の許容される担体、希釈剤、塩または賦形剤を含む医薬組成物の形態であるか、あるいは少なくとも1種の栄養素、および任意で少なくとも1種の食物添加物、を含む食物組成物の形態である、請求項12に記載の組成物。

【請求項14】

頭頂内投与、経口投与、および浸漬による投与からなる群より選択される経路による魚への投与あるいは通常の食物または水の摂取の一部としての魚への投与のために製剤化された、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

魚の生殖または成熟の少なくとも1つのパラメータの阻害に使用するための、請求項1～11のいずれか1項に記載のペプチド模倣物または請求項12～14のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項16】

魚の生殖または成熟の少なくとも1つのパラメータの阻害は、発情期を遅延させるか排除すること、早発性の発情期を遅延させるか排除すること、性決定を調節すること、性分化を調節すること、産卵、および、生殖と関係のあるホルモン依存的な問題またはプロセスを処置すること、からなる群より選択されるパラメータを含む、請求項15に記載のペプチド模倣物または組成物。

【請求項17】

魚の生殖または成熟の阻害は、処置される魚の重量を増加させる、請求項16に記載のペプチド模倣物または組成物。

【請求項18】

魚は、ティラピア、コイ、サケ、バス、ナマズおよびボラからなる群より選択される、請求項15に記載のペプチド模倣物または組成物。

【請求項19】

前記組成物は、非経口投与、経口投与、および浸漬による投与からなる群より選択される経路により魚に投与される、請求項15に記載のペプチド模倣物または組成物。

【請求項20】

前記食物組成物は、食物または水の摂取の一部として魚に投与される、請求項15に記載のペプチド模倣物または組成物。