

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2018145945, 09.06.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
10.06.2016 EP 16174056.8

(43) Дата публикации заявки: 10.07.2020 Бюл. № 19

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 10.01.2019(86) Заявка РСТ:
EP 2017/064196 (09.06.2017)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2017/212057 (14.12.2017)Адрес для переписки:
143430, Московская обл., Нахабино, Советская,
28, кв. 59

(71) Заявитель(и):

РЕГУЛАКСИС (FR)

(72) Автор(ы):

**КАРЕЛЛИ, Клод (FR),
ВЕТУ, Кристель (FR),
ПАОЛИНИ, Рафаэль (FR)**

(54) Пептид для лечения остеоартрита, фармацевтическая композиция, лекарственное средство, единичная дозированная форма

(57) Формула изобретения

1. Пептид, содержащий аминокислотную последовательность SEQ ID NO: 1, или ее фрагмент или вариант, где SEQ ID NO: 1 представляет собой последовательность:

X1-Tyr-X2-Leu-X3-Ala-Gly-X4-Lys-Asn-Phe-Phe-X5 (SEQ ID NO: 1)

где:

- X1 это вакантная позиция или валин или последовательность, выбранная из
нижеследующих:

Z1-Val

Asp-Z1-Val

Ser-Asp-Z1-Val (SEQ ID NO: 5)

Z2-Ser-Asp-Z1-Val (SEQ ID NO: 6) and

Gly-Z2-Ser-Asp-Z1-Val (SEQ ID NO: 7)

где Z1 это аргинин, а Z2 это треонин, или Z1 это Ser-Asp или Ser-Asn, а Z2 это аланин;
- X2 это последовательность, выбранная из следующих вариантов: Glu-Lys, Glu-Ser
и Asp-Leu;- X3 вакантная позиция или лизин или последовательность, выбранная из
нижеследующих:

Lys-Asp

Lys-Asp-Leu

Lys-Asp-Leu-Glu (SEQ ID NO: 8)

Lys-Asp-Leu-Glu-Glu (SEQ ID NO: 9)
Lys-Asp-Leu-Glu-Glu-Gly (SEQ ID NO: 10)
Lys-Asp-Leu-Glu-Glu-Gly-Ile (SEQ ID NO: 11)
Lys-Asp-Leu-Glu-Glu-Gly-Ile-Gln (SEQ ID NO: 12)
Lys-Asp-Leu-Glu-Glu-Gly-Ile-Gln-Z3 (SEQ ID NO: 13) and
Lys-Asp-Leu-Glu-Glu-Gly-Ile-Gln-Z3-Leu (SEQ ID NO: 14)

где Z3 это аланин или треонин;

- X4 это аминокислотный остаток, выбранный из следующих вариантов: цистеин, серин, тирозин, фенилаланин, аспарагиновая кислота, глутаминовая кислота, аланин и глицин; и

- X5 вакантная позиция или остаток триптофана или последовательность, выбранная из нижеследующих:

Trp-Lys
Trp-Lys-Thr
Trp-Lys-Thr-Phe (SEQ ID NO: 15)
Trp-Lys-Thr-Phe-Thr (SEQ ID NO: 16)
Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-Ser (SEQ ID NO: 17)
Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-Ser-X6 (SEQ ID NO: 18) and
Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-Ser-X6-Lys-Gln-Ala (SEQ ID NO: 19)

где X6 это аминокислотный остаток, выбранный из следующих вариантов: цистеин, серин, тирозин, фенилаланин, аспарагиновая кислота, глутаминовая кислота, аланин и глицин;

для использования в лечении остеоартрита у субъекта.

2. Пептид по п. 1, состоящий из аминокислотной последовательности, включающей от 11 до 50 аминокислотных остатков, предпочтительно включающей от 20 и 30 аминокислотных остатков.

3. Пептид по любому из пп. 1 и 2, где:

- X1 это Gly-Z2-Ser-Asp-Z1-Val; и
- X5 это Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-Ser-X6.

4. Пептид по любому из пп. 1-3, где упомянутый пептид содержит последовательность SEQ ID NO: 2, 3 4 или 20:

- Gly-Ala-Ser-Asp-Ser-Asp-Val-Tyr-Asp-Leu-Leu-Ala-Gly-Ser-Lys-Asn-Phe-Phe-Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-Ser-Ser (SEQ ID NO: 2)

- Gly-Ala-Ser-Asp-Ser-Asp-Val-Tyr-Asp-Leu-Leu-Lys-Ala-Gly-Ser-Lys-Asn-Phe-Phe-Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-Ser-Ser (SEQ ID NO: 3)

- Gly-Thr-Ser-Asp-Arg-Val-Tyr-Glu-Lys-Leu-Ala-Gly-Ser-Lys-Asn-Phe-Phe-Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-Ser-Ser (SEQ ID NO: 4)

- Gly-Ala-Ser-Asp-Ser-Asn-Val-Tyr-Asp-Leu-Leu-Lys-Ala-Gly-Ser-Lys-Asn-Phe-Phe-Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-Ser-Ser (SEQ ID NO: 20).

5. Пептид по любому из пп. 1-4, где упомянутый пептид подлежит введению путем внутрисуставной инъекции в сустав, подлежащий лечению.

6. Пептид по любому из пп. 1-5, где упомянутый пептид подлежит введению в конечной концентрации в суставе, составляющей от 10⁻³М до 10⁻⁷ М.

7. Фармацевтическая композиция, содержащая, по крайней мере, один пептид по любому из пп. 1-6 и один или более фармацевтически приемлемых эксципиентов.

8. Лекарственное средство, содержащее, по крайней мере, один пептид по любому из пп. 1-6.

9. Фармацевтическая дозированная лекарственная форма, содержащая по крайней мере, один пептид по любому из пп. 1-6.

10. Фармацевтическая дозированная лекарственная форма по п. 9, представляющая

собой одноразовый предварительно заполненный дозированный шприц для местной инъекции в сустав, подлежащий лечению.

11. Фармацевтическая композиция по п. 7, лекарственное средство по п. 8, или фармацевтическая дозированная лекарственная форма по пп. 9 и 10, в которых содержится дополнительно, по крайней мере один агент, восстанавливающий вязкость синовиальной жидкости.

12. Фармацевтическая композиция, лекарственный препарат или фармацевтическая дозированная лекарственная форма по п. 11, где агентом, восстанавливающим вязкость синовиальной жидкости, является гиалуроновая кислота, предпочтительно в концентрации, составляющей от 0,1% до 10%.

RU 2018145945 A

RU 2018145945 A