

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

(21)(22) Заявка: 2016112931, 01.10.2014

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

11.10.2013 US 61/890,056;

14.02.2014 US 61/940,095

(43) Дата публикации заявки: 16.11.2017 Бюл. № 32

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 11.05.2016

(86) Заявка РСТ:

US 2014/058646 (01.10.2014)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2015/054006 (16.04.2015)

Адрес для переписки:

190000, Санкт-Петербург, BOX 1125,
"ПАТЕНТИКА"

(71) Заявитель(и):

ТЕРИКС ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ ЛТД. (US)

(72) Автор(ы):

ФРАНКЛИН Ричард (US)(54) **КОМПОЗИЦИИ НОВЫХ ПЕПТИДОВ**

(57) Формула изобретения

1. Пептид, содержащий аминокислотную последовательность согласно формуле I:
 $\text{Ala}^1\text{-Xaa}^2\text{-Xaa}^3\text{-Ser}^4\text{-Xaa}^5\text{-Xaa}^6\text{-Cys}^7$ (SEQ ID NO: 1),

где Xaa^2 выбран из Arg, Lys, Ala, Cit (цитруллин), Orn (орнитин), ацетилированного Ser, Sar, D-Arg и D-Lys;

Xaa^3 выбран из Val, Ala, Leu, Nle, Ile, Gly, Lys, Pro, Aib (2-аминоизомасляной кислоты), Asp (1-аминоциклопентанкарбоновой кислоты) и Tyr;

Xaa^5 выбран из Ile, Ala, Leu, norLeu, Val и Gly; и

Xaa^6 выбран из His, Arg и 6-NH₂-Phe (6-аминофенилаланина).

2. Пептид по п. 1, отличающийся тем, что указанный пептид содержит от 7 до 25 аминокислот включительно.

3. Пептид по п. 1, отличающийся тем, что указанный пептид содержит одну или более химических модификаций для увеличения устойчивости к протеазам, стабильности в сыворотке и/или биодоступности.

4. Фармацевтическая композиция, содержащая пептид по п. 1 и фармацевтически приемлемый носитель.

5. Фармацевтическая композиция по п. 4, отличающаяся тем, что указанная фармацевтическая композиция приготовлена для перорального, внутримышечного,

внутривенного, подкожного, местного, трансдермального, ректального, вагинального введения, введения в легкое, интраназального, интрабуккального или сублингвального введения.

6. Фармацевтическая композиция по п. 4, отличающаяся тем, что указанная фармацевтическая композиция дополнительно содержит одно или более фармакологически приемлемых вспомогательных веществ, выбранных из полимерного носителя, разрыхляющего агента, смазывающего агента, растворителя или агента, способствующего набуханию.

7. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 4-6, отличающаяся тем, что указанная фармацевтическая композиция приготовлена в виде таблетки, пилюли, капсулы, гранул, сиропа, спрея, аэрозоля, липосомальной композиции, мази, суппозитория, импланта, пластыря или состава с медленным высвобождением.

8. Способ лечения заболевания, состояния или расстройства, включающий: введение нуждающемуся в этом субъекту пептида или композиции по любому из пп. 1-7.

9. Пептид, содержащий аминокислотную последовательность
Ala¹-Arg²-Val³-Ser⁴-Ile⁵-His⁶-Cys⁷ (SEQ ID NO: 18).

10. Пептид по п. 9, отличающийся тем, что указанный пептид содержит одну или более химических модификаций для повышения устойчивости к протеазам, стабильности в сыворотке и/или биодоступности.

11. Фармацевтическая композиция, содержащая пептид по п. 9 и фармацевтически приемлемый носитель.

12. Фармацевтическая композиция по п. 11, отличающаяся тем, что указанная фармацевтическая композиция приготовлена для перорального, внутримышечного, внутривенного, подкожного, местного, трансдермального, ректального, вагинального введения, введения в легкое, интраназального, интрабуккального или сублингвального введения.

13. Фармацевтическая композиция по п. 11, отличающаяся тем, что указанная фармацевтическая композиция дополнительно содержит одно или более фармакологически приемлемых вспомогательных веществ, выбранных из полимерного носителя, разрыхляющего агента, смазывающего агента, растворителя или агента, способствующего набуханию.

14. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 11-13, отличающаяся тем, что указанная фармацевтическая композиция приготовлена в виде таблетки, пилюли, капсулы, гранул, сиропа, спрея, аэрозоля, липосомальной композиции, мази, суппозитория, импланта, пластыря или состава с медленным высвобождением.

15. Способ лечения заболевания, состояния или расстройства, включающий: введение нуждающемуся в этом субъекту пептида или композиции по любому из пп. 9-14.

16. Применение пептида Ala¹-Arg²-Val³-Ser⁴-Ile⁵-His⁶-Cys⁷ (SEQ ID NO: 18) для лечения человека.

17. Способ по п. 15, отличающийся тем, что указанное заболевание, состояние или расстройство представляет собой инсульт.

18. Способ по п. 17, отличающийся тем, что указанный пептид или композиция содержит пептид с аминокислотной последовательностью

Ala¹-Arg²-Val³-Ser⁴-Ile⁵-His⁶-Cys⁷ (SEQ ID NO: 18).