



(51) МПК
C07K 7/08 (2006.01)
C07K 14/435 (2006.01)
A61P 31/00 (2006.01)
A61K 38/10 (2006.01)
A61K 38/17 (2006.01)

**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2020118460, 05.12.2018

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
 07.12.2017 US 62/595,725

(43) Дата публикации заявки: 10.01.2022 Бюл. № 1

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
 национальной фазе: 07.07.2020

(86) Заявка РСТ:
 US 2018/064029 (05.12.2018)

(87) Публикация заявки РСТ:
 WO 2019/113181 (13.06.2019)

Адрес для переписки:

191036, Санкт-Петербург, а/я 24,
 "НЕВИНПАТ", А.В. Поликарпову

(71) Заявитель(и):

ЗОИТИС СЕРВИСЕЗ ЭлЭлСи (US)

(72) Автор(ы):

**КУН Майкл (US),
 ЭВИН Ричард Эндрю (US),
 ШИХАН Дерек Джеймс (US),
 БАИМА Эрик (US),
 ЗУК Кристофер А. (US),
 ФЕЛПС Хилари (US)**

(54) **Антимикробные пептиды и способы их использования**

(57) Формула изобретения

1. Пептид, имеющий аминокислотную последовательность длиной 18-21 аминокислот и содержащий на ее N-конце SEQ ID NO: 1 (KWCFRVCYRGICYRRCRD) или SEQ ID NO: 29 (PKWCFRVCYRGICYRRCRD), или пептид, отличающийся от SEQ ID NO: 1 или SEQ ID NO: 29 одной, двумя или тремя аминокислотами, при этом аминокислоты, отличающиеся от аминокислот SEQ ID NO: 1 или SEQ ID NO: 29, независимо выбраны из группы, состоящей из:

глицина в позиции, соответствующей позиции 1 SEQ ID NO: 1; фенилаланина в позиции, соответствующей позиции 2 SEQ ID NO: 1; валина или триптофана в позиции, соответствующей позиции 4 SEQ ID NO: 1; тирозина в позиции, соответствующей позиции 5 SEQ ID NO: 1; аланина в позиции, соответствующей позиции 6 SEQ ID NO: 1; лизина, триптофана или аргинина в позиции, соответствующей позиции 8 SEQ ID NO: 1;

глицина или фенилаланина в позиции, соответствующей позиции 9 SEQ ID NO: 1; аргинина в позиции, соответствующей позиции 10 SEQ ID NO: 1; аланина или тирозина в позиции, соответствующей позиции 11 SEQ ID NO: 1; гистидина в позиции, соответствующей позиции 14 SEQ ID NO: 1; лизина, аланина или аспарагина в позиции, соответствующей позиции 17 SEQ ID NO: 1;

аспарагина или аргинина в позиции, соответствующей позиции 18 SEQ ID NO: 1;

при условии, что

если аминокислота в позиции, соответствующей позиции 1 SEQ ID NO: 1, представляет

**A
 0
 9
 4
 8
 1
 1
 0
 2
 0
 2
 RU**

**RU
 2
 0
 2
 0
 1
 1
 8
 4
 6
 0
 A**

собой глицин, то тогда этот глицин не является модифицированным ацилом или пальмитиновой кислотой.

2. Пептид по п. 1, где указанная аминокислотная последовательность содержит аспарагиновую кислоту в позиции, соответствующей позиции 18 SEQ ID NO: 1.

3. Пептид по любому из пп. 1-2, где указанная аминокислотная последовательность содержит аспарагин в позиции, соответствующей позиции 17 SEQ ID NO: 1.

4. Пептид по любому из пп. 1-3, где указанная аминокислотная последовательность содержит глицин в позиции, соответствующей позиции 1 SEQ ID NO: 1.

5. Пептид по любому из пп. 1-4, где указанная аминокислотная последовательность содержит аланин в позиции, соответствующей позиции 11 SEQ ID NO: 1.

6. Пептид по любому из пп. 1-5, где аргинин находится в позиции, соответствующей позиции 14 SEQ ID NO: 1, в позиции, соответствующей позиции 15 SEQ ID NO: 1, или в обеих позициях.

7. Пептид по любому из пп. 1-6, где указанная аминокислотная последовательность содержит аргинин в позиции, соответствующей позиции 14 SEQ ID NO: 1, и в позиции, соответствующей позиции 15 SEQ ID NO: 1.

8. Пептид по любому из пп. 1-7, где длина указанной аминокислотной последовательности составляет 18 аминокислот.

9. Пептид по любому из пп. 1-8, где пептид отличается от SEQ ID NO: 1 или SEQ ID NO: 29 одной аминокислотой.

10. Пептид по п. 1, где указанная аминокислотная последовательность содержит на ее N-конце SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 4 (KFCFRVCYRGICYRRCRD); SEQ ID NO: 5 (KWCFYVCYRGICYRRCRD), SEQ ID NO: 6 (KWCFRVCRRGICYRRCRD), SEQ ID NO: 8 (KWCFRVCYRGACYRRCRD), SEQ ID NO: 10 (KWCFRVCYRGICYHRRCRD) или SEQ ID NO: 11 (KWCFRVCYRGICYRRCND).

11. Пептид по п. 10, где указанная аминокислотная последовательность содержит SEQ ID NO: 1.

12. Пептид по п. 10, где указанная аминокислотная последовательность содержит SEQ ID NO: 4, или SEQ ID NO: 5, или SEQ ID NO: 6, или SEQ ID NO: 8.

13. Пептид по любому из пп. 1-8, где указанная аминокислотная последовательность содержит SEQ ID NO: 17 (YRGI).

14. Пептид по п. 1, где указанная аминокислотная последовательность содержит на своем N-конце одну из SEQ ID NO: 97-100, 102-110, 112-118.

15. Пептид по п. 14, где указанная аминокислотная последовательность содержит на своем N-конце SEQ ID NO: 102, 103, 108.

16. Пептид по любому из пп. 1-12, где C-концевая аминокислота указанной последовательности является аспарагиновой кислотой.

17. Мультимер, содержащий множество повторов аминокислотной последовательности, как она определена в п. 16, которые соединены посредством пептидной D-P связи между C-концевой аспарагиновой кислотой вышестоящего мономера и N-концевым пролином нижестоящего мономера.

18. Мультимер по п. 17, где указанные повторы соединены друг с другом напрямую.

19. Мультимер по п. 17 или 18, где множество составляет от 2 до 20.

20. Композиция, содержащая пептид, имеющий аминокислотную последовательность согласно любому из пп. 1-16.

21. Композиция по п. 20, которая адаптирована для местного введения.

22. Композиция по п. 21, которая изготовлена в виде крема, мази, спрея или эмульсии.

23. Способ лечения бактериальной инфекции у нуждающегося в этом субъекта, включающий введение указанному субъекту композиции по любому из пп. 20-22.

24. Способ по п. 23, где указанная бактериальная инфекция вызвана *S. aureus*, *E coli*

или *Spseudintermedius*.

25. Способ по п. 23 или 24, где указанная бактериальная инфекция представляет собой респираторную инфекцию, кожную инфекцию или мастит.

26. Способ по п. 25, где указанная инфекция представляет собой кожную инфекцию и композицию наносят местно.

27. Способ по п. 26, где нуждающимся субъектом является собака.

RU 2020110202 A 0948110202 A

RU 2020118460 A