

(12)

Patentschrift

- (21) Anmeldenummer: A 1536/2007 (51) Int. Cl.⁸: **C07K 14/47** (2006.01)
A61K 38/17 (2006.01)
(22) Anmeldetag: 2007-09-28
(43) Veröffentlicht am: 2008-11-15

(56) Entgegenhaltungen:
US 2002090369A1 HUTTNER ET AL., J
NUTR.
1998 FEB; 128 (2 SUPPL):297S-299S.

(73) Patentanmelder:
SCHREIBER CHRISTOPH
A-9900 LIENZ (AT)

(72) Erfinder:
SCHREIBER CHRISTOPH
LIENZ (AT)
HONEDER INGELA
WIEN (AT)

(54) **EIN NEUES DEFENSIN**

(57) β -Defensin mit der Sequenz
SCLRNGVCMPGKCAPTDWHLC-
RAGSRPPVKCCRKK
dessen N-Terminus mit dem C-Terminus des Pep-
tids MRLHLLLLVLFFLVLSAGSGFTQGRRTV fusio-
niert sein kann.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ein neues β -Defensin, gemäß Anspruch 1 sowie Humanarzneimittel, Tierarzneimittel sowie Futterzusatzstoffe für Tiere enthaltend das erfindungsgemäße β -Defensin.

Defensine sind Polypeptide mit antibiotischer Wirkung. Aufgrund der zunehmenden Antibiotikaresistenz, insbesondere von pathogenen Mikroorganismen, ist es dringend erforderlich, das Arsenal der antibiotisch wirksamen Substanzen zu ergänzen, um diese Mikroorganismen erfolgreich zu bekämpfen. Defensine werden in Säugern in verschiedenen Geweben und Organen exprimiert.

Das der Erfindung zu Grunde liegende technische Problem bestand darin, weitere wirksame Defensine zur Verfügung zu stellen, die unter anderem als Arzneimittel eingesetzt werden können.

Erfindungsgemäß gelöst wird das angesprochene technische Problem durch das β -Defensin mit der Sequenz

SCLRNGVCMPGKCAPTQWHLCRAGSRPPVKCCRKK

wobei dessen N-Terminus mit dem C-Terminus des Peptids
MRLHLLLLVLFFLVLSAGSGFTQGRRTV fusioniert ist.

Fig. 1 zeigt Aminosäuresequenzen der bekannten ovinen β -Defensine BD01_SHEEP und BD02_SHEEP. Das erfindungsgemäß besonders bevorzugte β -Defensin ist BD03_SHEEP.

Die Beschreibung enthält ein Sequenzprotokoll des erfindungsgemäßen β -Defensins.

Die minimale Hemmkonzentration des erfindungsgemäßen β -Defensins gegenüber verschiedenen Mikroorganismen wurde analysiert, dabei sind Werte von 0,1-0,8 $\mu\text{g/ml}$ bei verschiedenen Keimen beobachtet worden.

Das erfindungsgemäße Arzneimittel enthält als wirksamen Bestandteil das erfindungsgemäße β -Defensin. Dem Fachmann sind die gegebenenfalls zur Formulierung der β -Defensine als Arzneimittel einsetzbaren Hilfs- und Trägerstoffe geläufig. Das β -Defensin kann in Mengen eingesetzt werden, die durch ihre therapeutische Breite definiert sind. Typischerweise werden sie in Mengen von 1 μg bis 100 mg eingesetzt. Die Formulierungen des erfindungsgemäßen β -Defensins als Lösung für intravenöse, intramusculare, subkutane und topische Applikationen sind bevorzugt. Das erfindungsgemäße β -Defensin ist zur Behandlung von Infektionen geeignet. Insbesondere kann das erfindungsgemäße β -Defensin als antibiotisch wirksame Substanz eingesetzt werden. Das antibiotische Spektrum des erfindungsgemäßen β -Defensins ist weit und reicht zum Beispiel zur Behandlung von Infektionen durch multiresistente Erreger, wie Streptokokkus, Bacillus, Pseudomonas, Escherichia, Staphylokokkus und Candida.

SEQUENZPROTOKOLL

<110> Schreiber, Christoph
 Honeder, Ingela
 5
 <120> BD03_SHEEP
 <130> n/a
 10
 <160> 2
 <170> PatentIn version 3.3
 <210> 1
 15
 <211> 64
 <212> PRT
 <213> Ovis aries
 <400> 1
 20
 Met Arg Leu His Leu Leu Leu Leu Val Leu Phe Phe Leu Val Leu Ser
 1 5 10 15
 25
 Ala Gly Ser Gly Phe Thr Gln Gly Arg Arg Thr Val Ser Cys Leu Arg
 20 25 30
 30
 Asn Lys Gly Val Cys Met Pro Gly Lys Cys Ala Pro Thr Asp Trp His
 35 40 45
 30
 Leu Cys Arg Ala Gly Ser Arg Pro Pro Val Lys Cys Cys Arg Lys Lys
 50 55 60
 35
 <210> 2
 <211> 311
 <212> DNA
 <213> Ovis aries
 40
 <400> 2
 gagctcgtga cgccaacatg aggctccatc tcctgctcct cgtgctcttc ttcttggtcc 60
 tgtctgctgg gtcaggattt actcaaggaa gaagaactgt tagctgctta aggaataaag 120
 45
 gcgtgtgtat gccgggcaag tgtgctccaa cagattggca cctgtgtcgg gcgggcagta 180
 ggccccagat aaaatgctgc agaaagaagt aagagaaggc gaagacgcgg ccaggaccga 240
 tgcgagtgca gaaactgcgc ccttagacag atagcctaaa atttaaacca gaataaattt 300
 50
 tgttcaaagt t 311
 55

Patentansprüche:

1. β -Defensin mit der Sequenz
SCLRNKGVCMPGKCAPTDWHLCRAGSRPPVKCCRKK
2. β -Defensin nach Anspruch 1, wobei dessen N-Terminus mit dem C-Terminus des Peptids
MRLHLLLLVLFFLVLSAGSGFTQGRRTV fusioniert ist.
3. Humanarzneimittel enthaltend als wirksamen Bestandteil ein β -Defensin gemäß Anspruch
1 und/oder Anspruch 2.
4. Tierarzneimittel enthaltend als wirksamen Bestandteil ein β -Defensin gemäß Anspruch 1
und/oder Anspruch 2.
5. Futterzusatzstoffe für Tiere enthaltend als wirksamen Bestandteil ein β -Defensin gemäß
Anspruch 1 und/oder Anspruch 2.

Hiezu 1 Blatt Zeichnungen



BD01_SHEEP:

MRLHHLLLVL FVVLSAGSG FTQGVNRLS CHRNKGVCVP SRCPRHMRQI GTCRGPPVKC CRKK

BD02_SHEEP:

MRLHHLLLVL FVVLSAGSG FTHGVTDSL S CRWKKGICVL TRCPGTMRQI GTCFGPPVKC CRLK

BD03_SHEEP:

MRLHHLLLVL FFLVLSAGSG FTQGRRTVSC LRNKGVCMPG KCAPTDWHLC RAGSRPPVKC CRKK

Fig. 1