

РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ



(19) RU⁽¹¹⁾ 2012 136 530⁽¹³⁾ A

(51) МПК
C07K 14/575 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2012136530/10, 27.01.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
27.01.2010 GB 1001333.2

(43) Дата публикации заявки: 10.03.2014 Бюл. № 7

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 27.08.2012

(86) Заявка РСТ:
GB 2011/000110 (27.01.2011)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/092473 (04.08.2011)

Адрес для переписки:
115035, Москва, ул. Балчуг, 7, "Балчуг Плаза",
ЗАО "САЛАНС", Т.Ю. Микуцкой

(71) Заявитель(и):

ИМПЕРИАЛ ИННОВЕЙШНС
ЛИМИТЕД (GB)

(72) Автор(ы):

БЛУМ Стивен Роберт (GB)

A

(54) НОВЫЕ СОЕДИНЕНИЯ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ПИЩЕВОЕ ПОВЕДЕНИЕ

(57) Формула изобретения

1. Аналог PYY, содержащий последовательность аминокислот, выраженную формулой (I)

Xaa²-Ile-Xaa⁴-Pro-Xaa⁶-Ala-Pro-Gly-Glu-Asp-Ala-Ser-Pro-Glu-Xaa¹⁶-Xaa¹⁷-Xaa¹⁸-Xaa¹⁹-Tyr-Xaa²¹-Xaa²²-Ala-Leu-Xaa²⁵-His-Tyr-Leu-Asn-Xaa³⁰-Val-Thr-Arg-Gln-Arg-Tyr-NH₂

(I) [SEQ ID NO:1]

в котором

Xaa² выбран из группы, состоящей из Pro и Gly;

Xaa⁴ выбран из группы, состоящей из Arg, His, Lys и Orn;

Xaa⁶ выбран из группы, состоящей из Asp, Glu, His, Lys, Ser, Thr и Val;

Xaa¹⁶ выбран из группы, состоящей из Asn, Asp, Gln и Glu;

Xaa¹⁷ выбран из группы, состоящей из Ile, Leu и Val;

Xaa¹⁸ выбран из группы, состоящей из Ala, Asn, Asp и Val;

Xaa¹⁹ выбран из группы, состоящей из Arg и His;

Xaa²¹ выбран из группы, состоящей из His, Phe, Trp и Tyr;

Xaa²² выбран из группы, состоящей из Ala, Ile, Leu и Val;

R U
2 0 1 2 1 3 6 5 3 0

A

Xaa²⁵ выбран из группы, состоящей из Arg, Gln и His; и

Xaa³⁰ выбран из группы, состоящей из Arg, His, Leu и Lys;

или соединение, представляющее собой его вариант и/или производное; или его соль и/или сольват, включая соль указанного варианта и/или производного, и сольват указанного варианта и/или производного и/или соли, причем вариант представляет собой последовательность аминокислот, в которой имеется до двух аминокислот, кроме Xaa⁴, Xaa⁶, Xaa¹⁶, Xaa¹⁷, Xaa¹⁸, Xaa¹⁹, Xaa²¹, Xaa²², Xaa²⁵ и Xaa³⁰, замененных иной аминокислотой.

2. Аналог PYY по п.1, в котором Xaa¹⁶ представляет собой Glu.

3. Аналог PYY по п.2, в котором Xaa²⁵ представляет собой Arg.

4. Аналог PYY по п.3, в котором

Xaa² представляет собой Pro;

Xaa⁴ представляет собой Lys;

Xaa⁶ выбран из группы, состоящей из Glu и Ser;

Xaa¹⁷ представляет собой Leu;

Xaa¹⁸ представляет собой Asn;

Xaa²¹ представляет собой Tyr;

Xaa²² представляет собой Ala; и

Xaa³⁰ выбран из группы, состоящей из His, Leu и Lys.

5. Аналог PYY по п.3, в котором

Xaa² представляет собой Pro

Xaa⁴ представляет собой His;

Xaa⁶ представляет собой His;

Xaa¹⁷ представляет собой Leu;

Xaa¹⁸ представляет собой Asn;

Xaa²¹ представляет собой Tyr;

Xaa²² представляет собой Ala; и

Xaa³⁰ представляет собой His.

6. Аналог PYY по п.4, в котором Xaa¹⁹ представляет собой His.

7. Аналог PYY по п.6, в котором Xaa³⁰ представляет собой His.

8. Аналог PYY по п.7, в котором Xaa⁶ представляет собой Glu.

9. Аналог PYY по п.5, в котором Xaa¹⁹ представляет собой His.

10. Аналог PYY по п.1, который представляет собой производное, модифицированное посредством одного или несколько процессов, выбранных из амидирования, гликозилирования, карбамилирования, ацилирования, сульфатации, фосфорилирования, циклизации, липидизации, пегилирования и слияния с другим белком или полипептидом с образованием гибридного белка.

11. Аналог PYY по п.10, который получен рекомбинантным способом или синтетическим способом.

12. Аналог PYY по любому из пп.1-11, предназначенный для использования в качестве лекарственного средства.

13. Аналог PYY по любому из пп.1-11, предназначенный для использования при

R
U
2
0
1
2
1
3
6
5
3
0

A
3
1
2
1
2
0
1
2
R
U

лечении ожирения или диабета, для снижения аппетита у пациента, уменьшения приема пищи у пациента или уменьшения приема калорий у пациента.

14. Аналог PYY по п.13, в котором пациент имеет избыточный вес и/или страдает ожирением и/или страдает диабетом.

15. Аналог PYY по п.13, в котором соединение вводят парентерально, подкожно, внутривенно, внутримышечно, интраназально, трансдермально или сублингвально.

16. Фармацевтическая композиция, содержащая аналог PYY по любому из пп.1-11 в сочетании с фармацевтически приемлемым носителем и по выбору с другими терапевтическими ингредиентами.

17. Фармацевтическая композиция по п.16, помещенная в шприц или иное устройство для подкожного введения людям.

18. Фармацевтическая композиция по п.16, предназначенная для использования при лечении ожирения или диабета, для снижения аппетита у пациента, уменьшения приема пищи у пациента или уменьшения приема калорий у пациента.

19. Способ лечения или профилактики заболевания, или нарушения, или иного нежелательного физиологического состояния, включающий в себя подкожное введение аналога PYY по любому из пп.1-11.

20. Способ лечения или профилактики заболевания, или нарушения, или иного нежелательного физиологического состояния, включающий в себя подкожное введение фармацевтической композиции по п.16.

21. Способ лечения ожирения или диабета у пациента, нуждающегося в таком лечении, или снижения аппетита у пациента, или уменьшения приема пищи у пациента или уменьшения приема калорий у пациента, в котором пациенту вводят аналог PYY по любому из пп.1-11.

22. Способ лечения ожирения или диабета у пациента, нуждающегося в таком лечении, снижения аппетита у пациента, уменьшения приема пищи у пациента или уменьшения приема калорий у пациента, в котором пациенту вводят фармацевтическую композицию по п.16.

23. Способ по п.21, в котором пациент имеет избыточный вес и/или страдает ожирением и/или страдает диабетом.

24. Способ по п.21, в котором соединение вводят парентерально, подкожно, внутривенно, внутримышечно, интраназально, трансдермально или сублингвально.

25. Применение аналога PYY по любому из пп.1-11, для изготовления лекарственного средства для лечения ожирения или диабета, для снижения аппетита у пациента, для уменьшения приема пищи у пациента или для уменьшения приема калорий у пациента.

26. Применение по п.25, в котором пациент имеет избыточный вес и/или страдает ожирением и/или страдает диабетом.

27. Применение по п.25, в котором лекарственное средство выполнено с возможностью введения парентерально, подкожно, внутривенно, внутримышечно, интраназально, трансдермально или сублингвально.