



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2003 134 636** ⁽¹³⁾ **A**
(51) МПК⁷ **A 61 K 38/02, A 61 P 31/00, G**
01 N 33/53, C 12 Q 1/18

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: **2003134636/13, 22.04.2002**

(30) Приоритет: **30.04.2001 DE 10121145.7**
21.06.2001 DE 10129870.6

(43) Дата публикации заявки: **20.04.2005 Бюл. № 11**

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: **01.12.2003**

(86) Заявка РСТ:
EP 02/04410 (22.04.2002)

(87) Публикация РСТ:
WO 02/08755 (07.11.2002)

Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Б.Спаская, 25, стр.3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и Партнеры",
пат.пов. Г.Б. Егоровой

(71) Заявитель(и):
НОВОЛОГИКС ГМБХ (DE)

(72) Автор(ы):
МАЙЕР Франк (DE)

(74) Патентный поверенный:
Егорова Галина Борисовна

(54) **EF-TU СВЯЗАННЫЕ ВЕЩЕСТВА В КАЧЕСТВЕ АНТИБАКТЕРИАЛЬНОГО СРЕДСТВА**

Формула изобретения

1. Применение веществ, которые связываются с EF-Tu, для получения средства для подавления синтеза цитоскелета в бактериальных клетках, причем вещества связываются с EF-Tu в области домена 2 (аминокислоты от 205 до 298) или/и домена 3 (аминокислоты от 299 до 394).

2. Применение по п.1, отличающееся тем, что вещества в области аминокислот с 218 до 224 домена 2 связываются с EF-Tu.

3. Применение по п.1 или 2, отличающееся тем, что вещества в области аминокислот с 317 до 328 или/и с 343 до 354 домена 3 связываются с EF-Tu.

4. Применение по одному из пп.1-3, отличающееся тем, что вещества содержат сегменты аминокислотных последовательностей домена 2 или/и 3 длиной от 4 до 20 аминокислот.

5. Применение по п.4, отличающееся тем, что сегменты имеют длину от 5 до 15 аминокислот, в частности, от 6 до 12 аминокислот.

6. Применение по одному из пп.1-5, отличающееся тем, что вещества выбраны из линейных или циклических пептидных соединений или пептидомиметиков.

7. Применение по п.6, отличающееся тем, что пептидные соединения или пептидомиметики содержат связанные гидрофобные группировки, группировки с большим объемным наполнением или/и группы с защитными функциями против разложения.

8. Применение по одному из пп.1-7 для получения антибактериального средства.

9. Применение по п.8, отличающееся тем, что антибактериальное средство готовится как фармацевтическая композиция, при необходимости вместе с фармацевтическими

обычными носителями, разбавителями или/и вспомогательными средствами.

10. Применение по п.8 или 9 для получения средства против грам-положительных или грам-отрицательных бактерий.

11. Применение по п.8 или 9 для получения средства против микоплазм.

12. Антибактериальное средство, содержащее сегменты аминокислотных последовательностей домена 2 и/или 3 бактериальных белков EF-Tu длиной от 4 до 20 аминокислот.

13. Антибактериальное средство по п.13, содержащее сегменты длиной от 5 до 15 аминокислот.

14. Антибактериальное средство по п.12 или 13, содержащее сегменты длиной от 6 до 12 аминокислот.

15. Антибактериальное средство по одному из пп.12-14, отличающееся тем, что оно содержит связанные с сегментами гидрофобные группировки, группировки с большим объемным наполнением и/или группировки с защитными функциями против разложения.

16. Антибактериальное средство по одному из пп.12-15, приготавливаемое как фармацевтическая композиция, при необходимости вместе с обычными фармацевтическими носителями, разбавителями или/и вспомогательными средствами.

17. Способ идентификации нового антибактериального активного вещества, включающий:

(а)приведение тестируемых веществ в контакт с бактериальным EF-Tu или его полимеризационноспособным фрагментом и

(б)определение, способно ли вещество подавлять образование EF-Tu-полимеров.

18. Способ по п.17, отличающийся тем, что он проводится как тест *in vitro*.

19. Способ по п.17, отличающийся тем, что он проводится как тест *in vivo*.

20. Способ по одному из пп.17-19, отличающийся тем, что для определения образования EF-Tu-полимеров применяются меченые антитела или/и меченые EF-Tu-белки или их полимеризуемые фрагменты.

21. Способ по одному из пп.17-20, отличающийся тем, что вещество, подавляющее образование EF-Tu-полимеров, или его производное приготавливают как фармацевтическую композицию, при необходимости вместе с обычными фармацевтическими носителями, разбавителями или/и вспомогательными средствами.

22. Способ по одному из пп.18-21, отличающийся тем, что вещество, подавляющее образование EF-Tu-полимеров, или его производное, приготавливают как фармацевтическую композицию, при необходимости вместе с обычными фармацевтическими носителями, разбавителями или/и вспомогательными средствами.