

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

(21)(22) Заявка: 2012157399/04, 17.06.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
18.06.2010 АТ А1010/2010

(43) Дата публикации заявки: 27.07.2014 Бюл. № 21

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 18.01.2013(86) Заявка РСТ:
ЕР 2011/060105 (17.06.2011)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/157819 (22.12.2011)Адрес для переписки:
197101, Санкт-Петербург, а/я 981, "АРС-
ПАТЕНТ", И.И. Липатовой

(71) Заявитель(и):

КсайберСайенс ГмбХ (АТ)

(72) Автор(ы):

ПЕТЦЕЛЬБАУЭР Петер (АТ),
РАЙНГРУБЕР Сонья (АТ)(54) **ПЕПТИДЫ В КАЧЕСТВЕ АКТИВНЫХ АГЕНТОВ ДЛЯ СТАБИЛИЗАЦИИ БИОЛОГИЧЕСКИХ
БАРЬЕРОВ**

(57) Формула изобретения

1. Пептид, содержащий или состоящий из последовательности аминокислот
GX1RPX2X3X4X5GGX6 (SEQ ID NO: 1)

где

X₁ представляет собой аминокислоту, выбранную из группы, состоящей из R и A;X₂ либо опущена, либо представляет собой аминокислоту, выбранную из группы,
состоящей из L и V;X₃ либо опущена, либо представляет собой аминокислотную последовательность,
состоящую из 1-5 аминокислот;X₄ либо опущена, либо представляет собой аминокислотную последовательность,
состоящую из GG;X₅ представляет собой две аминокислоты, выбранные из группы, состоящей из A, I
и S, иX₆ либо опущена, либо представляет собой аминокислотную последовательность,
состоящую из 1-5 аминокислот.

2. Пептид по п.1, который способен ингибировать активность Rho-ГТФазы.

3. Пептид по п.1, дополнительно содержащий X₇ на С-конце последовательности,
где X₇ представляет собой остаток, выбранный из группы, состоящей из NH₂, альбумина,

полиэтиленгликоля, декстрана, ферритина, гидроксиптилкрахмала и Fc-фрагмента антитела.

4. Пептид по п.1, где X_1 является R.
5. Пептид по п.1, где X_2 является L и V.
6. Пептид по п.5, где X_2 является L.
7. Пептид по п.1, где X_3 является PPP.
8. Пептид по п.1, где X_4 является GG.
9. Пептид по п.1, где X_5 является IS или AS.
10. Пептид по п.9, где X_5 является IS.
11. Пептид по п.1, в котором X_6 опущена.
12. Пептид по п.1, где X_1 является R, X_2 является L, X_3 опущена, X_5 является IS и X_6 опущена, или где X_1 представляет собой R, X_2 является V, X_3 опущена, X_5 представляется собой IS и X_6 опущена.

13. Пептид по п.1, где указанный пептид содержит или состоит из аминокислотной последовательности, выбранной из группы, состоящей из

GRRPLGGISGG (SEQ ID NO: 3);
GRRPVGGISGG (SEQ ID NO: 6);
GRRPLISGG (SEQ ID NO: 4);
GRRPVISGG (SEQ ID NO: 7);
GRRPLPPPISGG (SEQ ID NO: 8);
GRRPVPPPISGG (SEQ ID NO: 9);
GRRPLGGAAGG (SEQ ID NO: 10);
GRRPVGGAAGG (SEQ ID NO: 11);
GRRPLPPPAAGG (SEQ ID NO: 12);
GRRPVPPPAAGG (SEQ ID NO: 13);
GRRPLGGASGG (SEQ ID NO: 14);
GRRPVGGASGG (SEQ ID NO: 15);
GRRPLPPPASGG (SEQ ID NO: 16);
GRRPVPPPASGG (SEQ ID NO: 17);
GRRPLGGIAGG (SEQ ID NO: 18);
GRRPVGGIAGG (SEQ ID NO: 19);
GRRPLPPPIAGG (SEQ ID NO: 20);
GRRPVPPPIAGG (SEQ ID NO: 21);
GARPLGGISGG (SEQ ID NO: 22);
GARPVGGISGG (SEQ ID NO: 23);
GARPLPPPISGG (SEQ ID NO: 24);
GARPVPPPISGG (SEQ ID NO: 25);
GARPLGGAAGG (SEQ ID NO: 26);
GARPVGGAAGG (SEQ ID NO: 27);
GARPLPPPAAGG (SEQ ID NO: 28);
GARPVPPPAAGG (SEQ ID NO: 29);
GARPLGGASGG (SEQ ID NO: 30);
GARPVGGASGG (SEQ ID NO: 31);
GARPLPPPASGG (SEQ ID NO: 32);
GARPVPPPASGG (SEQ ID NO: 33);
GARPLGGIAGG (SEQ ID NO: 34);
GARPVGGIAGG (SEQ ID NO: 35);
GARPLPPPIAGG (SEQ ID NO: 36); и

GARPVPPPIAGG (SEQ ID NO: 37).

14. Пептид по любому из пп.1-13 для использования в качестве лекарственного средства.

15. Пептид по любому из пп.1-13 для применения при лечении или профилактике заболевания или расстройства, связанного с локализованным или системным нарушением функции эпителиальных или эндотелиальных барьеров.

16. Пептид по любому из пп.1-13 для применения при лечении и/или профилактике заболевания или расстройства, выбранного из группы, состоящей из острого повреждения легких (ALI), острого повреждения почек (ОПП), острого респираторного дистресс-синдрома (ОРДС), вентилятор-индуцированного повреждения легких (VILI), синдрома системного воспалительного ответа (ССВО), сепсиса, ожогов и синдрома полиорганной дисфункции (СПОН).

17. Пептид по любому из пп.1-13, где путь введения является парентеральным или пероральным.

18. Полинуклеотид, кодирующий пептид по любому из пп.1-13.

19. Полинуклеотид по п.18 для использования в качестве лекарственного средства.

20. Полинуклеотид по п.18 для применения при лечении или профилактике заболевания или расстройства, связанного с локализованным или системным нарушением функции эпителиальных или эндотелиальных барьеров.

21. Полинуклеотид по п.18 для применения при лечении и/или профилактике заболевания или расстройства, выбранного из группы, состоящей из острого повреждения легких (ALI), острого повреждения почек (ОПП), острого респираторного дистресс-синдрома (ОРДС), вентилятор-индуцированного повреждения легких (VILI), синдрома системного воспалительного ответа (ССВО), сепсиса, ожогов и синдрома полиорганной дисфункции (СПОН).

22. Полинуклеотид по любому из пп.18-21, где путь введения является парентеральным или пероральным.

23. Фармацевтическая композиция, содержащая пептид по любому из пп.1-13 и/или полинуклеотид по п.18, возможно дополнительно содержащая фармацевтически приемлемый носитель и/или разбавитель.

24. Фармацевтическая композиция по п.23 для применения при лечении или профилактике заболевания или расстройства, связанного с локализованным или системным нарушением функции эпителиальных или эндотелиальных барьеров.

25. Фармацевтическая композиция по п.23 для применения при лечении и/или профилактике заболевания или расстройства, выбранного из группы, состоящей из острого повреждения легких (ALI), острого повреждения почек (ОПП), острого респираторного дистресс-синдрома (ОРДС), вентилятор-индуцированного повреждения легких (VILI), синдрома системного воспалительного ответа (ССВО), сепсиса, ожогов и синдрома полиорганной дисфункции (СПОН).

26. Фармацевтическая композиция по любому из пп.23-25, где путь введения является парентеральным или пероральным.

27. Способ лечения или профилактики заболевания или расстройства, связанного с локализованным или системным нарушением функции эпителиальных или эндотелиальных барьеров, посредством введения субъекту эффективной дозы пептида по любому из пп.1-13, полинуклеотида по п.18, или фармацевтической композиции по п.23.

28. Способ лечения или профилактики заболевания или расстройства, выбранного из группы, состоящей из острого повреждения легких (ОПЛ), острого повреждения почек (АКИ), острого респираторного дистресс-синдрома (ОРДС), вентилятор-индуцированного повреждения легких (VILI), синдрома системного воспалительного

ответа (ССВО), сепсиса, ожогов и синдрома полиорганной дисфункции (СПОН), посредством введения субъекту эффективной дозы пептида по любому из пп.1-13, полинуклеотида по п.18, или фармацевтической композиции по п.23.

29. Способ по п.27 или 28, в котором путь введения является парентеральным или пероральным.

RU 2012157399 A

RU 2012157399 A