

NOVEDAD DE LA INVENCION

REIVINDICACIONES

1. Un péptido, caracterizado porque comprende la siguiente secuencia de aminoácidos: X1-X2-X3-X4-X5-X6-X7-X8-X9-X10-X11-X12-X13-X14-X15 (SEQ ID NO: 2); o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde: X1 es cualquier aminoácido o peptido; X2 es cualquier aminoácido; X3 es un aminoácido que tiene un anillo aromático opcionalmente sustituido en una cadena lateral; X4 es un aminoácido que tiene un anillo aromático opcionalmente sustituido en una cadena lateral; X5 es un aminoácido que tiene un anillo aromático opcionalmente sustituido o un cicloalquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral; X6 es un aminoácido que tiene un grupo alquilo en una cadena lateral; X7 es cualquier aminoácido secundario, N-alquilaminoácido o peptido; X8 es cualquier aminoácido; X9 es un aminoácido que tiene un anillo aromático opcionalmente sustituido o un grupo alquilo o cicloalquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral; X10 es R; X11 es un aminoácido que tiene un anillo aromático opcionalmente sustituido o un grupo alquilo o cicloalquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral; X12 es un aminoácido alifático opcionalmente sustituido o un aminoácido que tiene una cadena de alquilo opcionalmente sustituida en una cadena lateral; X13 es cualquier aminoácido secundario, N-alquilaminoácido o peptido; X14 es un aminoácido que tiene un anillo aromático opcionalmente sustituido en una cadena lateral; y X15 es cualquier aminoácido.

2. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque se satisfacen uno o dos o más de los siguientes requisitos: X1 es un aminoácido que tiene un grupo alquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral o un peptido que tiene un grupo alquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral unida al nitrógeno de amida; X3 es F o W opcionalmente sustituido; X4 es F o Y opcionalmente sustituido, o naftilalanina; X5 es F, Y o naftilalanina opcionalmente sustituidos, o ciclohexilalanina opcionalmente sustituida; X6 es un aminoácido que tiene un grupo alquilo ramificado, o un aminoácido que tiene un grupo cicloalquilo, en donde un átomo de carbono contenido en el mismo es opcionalmente reemplazado por un átomo de oxígeno; X8 es un aminoácido que tiene un anillo aromático opcionalmente sustituido o un grupo alquilo o cicloalquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral; X9 es F o Y opcionalmente sustituido, o un aminoácido que contiene un grupo heterocicloalquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral, o alanina; X12 es un aminoácido alifático que contiene tres o más átomos de carbono en una cadena lateral, o un aminoácido que tiene una cadena de alquilo opcionalmente sustituida en una cadena lateral; X13 es un N-alquilaminoácido; X14 es F o Y opcionalmente sustituido; y X15 es un aminoácido que tiene un elemento de azufre (S) en el extremo de la cadena lateral.

3. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque se satisfacen uno o dos o más de los siguientes requisitos: X1 es un aminoácido que tiene un grupo alquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral o un peptoide que tiene un grupo alquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral unida al nitrógeno de amida; X3 es F o W opcionalmente sustituido; X4 es F o Y opcionalmente sustituido, o naftilalanina; X5 es F, Y o naftilalanina opcionalmente sustituidos, o ciclohexilalanina opcionalmente sustituida; X6 es un aminoácido que tiene un grupo alquilo ramificado, o un aminoácido que tiene un grupo cicloalquilo, en donde un átomo de carbono contenido en el mismo es opcionalmente reemplazado por un átomo de oxígeno; X8 es un aminoácido que tiene un anillo aromático opcionalmente sustituido o un grupo alquilo o cicloalquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral; X9 es F o Y opcionalmente sustituido, o un aminoácido que contiene un grupo heterocicloalquilo opcionalmente sustituido en una cadena lateral, o alanina; X12 es un aminoácido alifático que contiene tres o más átomos de carbono en una cadena lateral, o un aminoácido que tiene una cadena de alquilo opcionalmente sustituida en una cadena lateral; X13 es un N-alquilaminoácido; X14 es F o Y opcionalmente sustituido; y X15 es un aminoácido alifático, y está unido además a un aminoácido alifático o prolina como X16.

4. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque se satisfacen uno o dos o más de los siguientes requisitos: X1 es A, MeA, Dap, ApG, CrpG, CmG, MeD, N, CrmG, MeopG, MeeG, AcapG, A4paa, KCOpipzaa, CeG, CrbG, K, KMe, Hly, E, Hgl, Orn, Dab, MeE, D o MeHgl; X2 es R, Dap, K, E, A, da, S, G, de, dkCOpipzaa, ddab o dorn; X3 es W, W7N, F44Py, Bph, W6N, F41dMeCmm4Pyz, W1Bn, W6H, W1Ph, Bph4ms, W1aa, W7Ph3C, W1Ph4OMe, W1Ph4COO, F42Py o W6H1Ph4COO; X4 es Y, 3Py6NH2, YBn, Yae, Nal1, Yph o mBph; X5 es MeF, MeY, MeF3Me, F, MeCha, MeYap, MeA1Ac4pip, MemBph, MeNal1, MeNal2, MeF4OMe o MeF4C; X6 es I, Gcpe o TMe; X7 es MeG, MeA, Meda, dp, EtG o PrG; X8 es Y, F4COO, K, 4Py, F, F3aao, F3OMe, A4paa, KCOpipzaa, Bph2C, Bph2OMe o pBph2aao; X9 es Y, F4COO, 3Py, 4Py, F4aao, F4CON, F3CON, F4F o F4OMe; X11 es MeF, Me4Py, Me3Py, F, Cha, MeCha, MeK, MeKMe, MeF4am, MeD, MeE, MeF4COO o F4am; X12 es L, Ahp, Ano, Ado, Ade, Aoc, SPent, HseBu, AhpOMe, HsePr o Aun; X13 es MeA, MeE, MeKCOpipzaa, MeK, MeDap o MeDab; X14 es MeF, MeF3Et, Me4Py, Me3Py o MemBph; y X15 es C, MeC, dc, Medc, dhcy, Hcy o de.

5. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque se satisfacen uno o dos o más de los siguientes requisitos: X1 es A, MeA, Dap, ApG, CrpG, CmG, MeD, N, CrmG, MeopG, MeeG, AcapG, A4paa, KCOpipzaa, CeG, CrbG, K, KMe, Hly, E, Hgl, Orn, Dab, MeE, D o MeHgl; X2 es R, Dap, K, E, A, da, S, G, de, dkCOpipzaa, ddab o dorn; X3 es W, W7N, F44Py, Bph, W6N, F41dMeCmm4Pyz, W1Bn, W6H, W1Ph, Bph4ms, W1aa, W7Ph3C, W1Ph4OMe, F42Py, W1Ph4COO o W6H1Ph4COO; X4 es Y, 3Py6NH2, YBn, Yae, Nal1, Yph o mBph; X5 es MeF, MeY, MeF3Me, F, MeCha, MeYap, MeA1Ac4pip, MemBph,

MeNal1, MeNal2, MeF4OMe o MeF4C; X6 es I, Gcpe o TMe; X7 es MeG, MeA, Meda, dp, EtG o PrG; X8 es Y, F4COO, K, 4Py, F, F3aao, F3OMe, A4paa, KCOpipzaa, Bph2C, Bph2OMe o pBph2aao; X9 es Y, F4COO, 3Py, 4Py, F4aao, F4CON, F3CON, F4F o F4OMe; X11 es MeF, Me4Py, Me3Py, F, Cha, MeCha, MeK, MeKMe, MeF4am, MeD, MeE, MeF4COO o F4am; X12 es L, Ahp, Ano, Ado, Ade, Aoc, SPent, HseBu, AhpOMe, HsePr o Aun; X13 es MeA, MeE, MeKCOpipzaa, MeK, MeDap o MeDab; X14 es MeF, MeF3Et, Me4Py, Me3Py o MemBph; y X15 es Aeoc, Ape, dhgl, Hgl, MeHgl, Medhgl, MeAeoc o MeApe, o X15 es G, da, A o de, y está unido a MeA, Meda, G, da, MeG, P o A como X16.

6. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque se satisfacen uno o dos de los siguientes requisitos: X1 es A, MeA, Dap, ApG, CrpG, CmG, MeD, N, CrmG, MeopG, MeeG, AcapG, A4paa, KCOpipzaa, CeG, CrbG, K, KMe, Hly, E, Hgl, Orn, Dab, MeE, D o MeHgl; y X15 es Aeoc, Ape, dhgl, Hgl, MeHgl, Medhgl, MeAeoc o MeApe, o X15 es G, da, A o de, y está unido a MeA, Meda, G, da, MeG, P o A como X16.

7. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque comprende o consiste en una secuencia de aminoácidos expuesta en cualquiera de SEQ ID NOs: 2 a 368.

8. Un péptido, caracterizado porque comprende la siguiente secuencia de aminoácidos: A-R-W-Y-MeF-I-MeG-Y-Y-R-MeF-L-MeA-MeF-C (SEQ ID NO: 1) o una secuencia de aminoácidos que tiene una sustitución, adición, delección o inserción en 1 a 14 residuos de aminoácido seleccionados del grupo que consiste en residuos de aminoácido en las posiciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 11, 12, 13, 14 y 15 en la secuencia de aminoácidos anterior; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

9. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizado además porque el péptido es un péptido cíclico.

10. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 4, 6, 7 y 8, caracterizado además porque tiene una estructura cíclica en la cual un aminoácido cloroacetilado está unido a un residuo de cisteína incluido en el péptido.

11. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 3, 5, 6 y 7, caracterizado además porque tiene una estructura cíclica en la cual un grupo amino de un residuo de aminoácido en la posición 1 incluido en el péptido está unido a un grupo carboxi de un residuo de aminoácido en la posición 15.

12. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 3, 5, 6 y 7, caracterizado además porque tiene una estructura cíclica en la cual un grupo amino de un residuo de aminoácido en la posición 1 incluido en el péptido está unido a un grupo carboxi de un residuo de aminoácido en la posición 16.

13. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad

con la reivindicación 9, caracterizado además porque el péptido comprende adicionalmente una estructura de entrelazamiento.

14. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 9, caracterizado además porque tiene una estructura de entrelazamiento entre cualquiera de X1, X2 o X3 y X11 o X13.

15. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 12, caracterizado además porque comprende o consiste en una secuencia de aminoácidos expuesta en cualquiera de SEQ ID NOs: 238-290, 326-329, 334-338, 348-354, 358-360, 362-366 y 368.

16. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizado además porque comprende adicionalmente un residuo de aminoácido adicional.

17. El péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizado además porque comprende un enlazador en un extremo C-terminal del mismo.

18. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende el péptido o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8.

19. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 18, caracterizada además porque tiene actividad inhibidora de la miostatina.

20. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 18, caracterizada además porque es para prevenir o tratar una enfermedad relacionada con la miostatina o una enfermedad o síntoma asociado con una función muscular reducida.

21. Un método para inhibir la señalización de la miostatina, caracterizado porque comprende usar el péptido o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8.

22. Una composición de diagnóstico, caracterizada porque comprende el péptido o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, para diagnosticar una enfermedad relacionada con la miostatina o una enfermedad o síntoma asociado con una función muscular reducida.

23. Un método para poner a prueba un péptido o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, caracterizado porque comprende poner a prueba por lo menos uno de: a) solubilidad en un solvente, b) actividad inhibidora de la miostatina, c) toxicidad celular y/o tisular, o d) toxicidad para un animal de experimentación, en donde el péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo es el péptido o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8.