



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

**(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012116152/10, 22.09.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
23.09.2009 GB 0916686.9

(43) Дата публикации заявки: 27.10.2013 Бюл. № 30

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 23.04.2012(86) Заявка РСТ:  
GB 2010/001776 (22.09.2010)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/036440 (31.03.2011)Адрес для переписки:  
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО  
"Союзпатент", Е.В.Воробьевой

(71) Заявитель(и):

**АСКЛЕПИУММ ЛИМИТЕД (GB)**

(72) Автор(ы):

**ЧЕНЬ Минь-Че (GB)****(54) АНТАГОНИСТЫ Dsg2 ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ РАКА****(57) Формула изобретения**

1. Антагонист Dsg2 для применения в качестве медикамента для профилактики или лечения рака, где указанный антагонист модулирует функцию аминокислотной последовательности TQDVFVGSVEELSAANTLVMKINATDADEPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:1) EC2 домена Dsg2, или ее фрагмента или варианта.

2. Антагонист по п.1, где антагонист снижает ЕМТ-стимулирующую функцию Dsg2.

3. Антагонист по п.1, где антагонист специфически связывается с аминокислотной последовательностью SEQ ID NO:1.

4. Антагонист по п.2, где антагонист специфически связывается с аминокислотной последовательностью SEQ ID NO:1.

5. Антагонист по п.1, где антагонист включает в себя часть или всю аминокислотную последовательность SEQ ID NO:1 или ее аминокислотные производные или аналоги.

6. Антагонист по п.2, где антагонист включает в себя часть или всю аминокислотную последовательность SEQ ID NO:1 или ее аминокислотные производные или аналоги.

7. Антагонист по п.1, где антагонист представляет собой антитело или фрагмент или производное антитела; пептид; пептидомиметик; или малую молекулу.

8. Антагонист по п.2, где антагонист представляет собой антитело или фрагмент или производное антитела; пептид; пептидомиметик; или малую молекулу.

9. Антагонист по п.3, где антагонист представляет собой антитело или фрагмент или производное антитела; пептид; пептидомиметик; или малую молекулу.

10. Антагонист по п.4, где антагонист представляет собой антитело или фрагмент или производное антитела; пептид; пептидомиметик; или малую молекулу.

11. Антагонист по п.5, где антагонист представляет собой антитело или фрагмент или производное антитела; пептид; пептидомиметик; или малую молекулу.

12. Антагонист по п.6, где антагонист представляет собой антитело или фрагмент или производное антитела; пептид; пептидомиметик; или малую молекулу.

13. Антагонист по п.7, где антагонист представляет собой поликлональное антитело.

14 Антагонист по п.7, где антагонист представляет собой пептид или пептидомиметик, включающий часть или всю аминокислотную последовательность SEQ ID NO:1, или ее аминокислотные производные или аналоги.

15. Антагонист по п.14, где пептид включает аминокислотную последовательность TQDVFVGSVEELSAANTLVMKINATDADEPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:1), KINATDAD EPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:6) или EELSAANTLV (SEQ ID NO:7), или ее аминокислотные производные или аналоги.

16. Антагонист Dsg2 для применения в качестве медикамента для профилактики или лечения рака, где указанный антагонист представляет собой полипептид Dsg2 или его фрагмент или вариант, где указанный полипептид содержит одну или более замен, инверсий и/или делеций аминокислотных остатков в пределах последовательности TQ DVFVGSVEELSAANTLVMKINATDADEPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:1) EC2 домена Dsg2, или ее фрагмента или варианта.

17. Антагонист по п.16, где полипептид включает аминокислотную последовательность SEQ ID NO:8 или SEQ ID NO:9.

18. Антагонист ЕМТ-стимулирующей функции Dsg2 для применения в качестве медикамента для профилактики или лечения рака.

19. Антагонист ЕМТ-стимулирующей функции Dsg2 по п.18, где указанный антагонист определяется по любому одному из пп.1-17.

20. Антагонист по п.18, где указанный антагонист снижает функцию Dsg2, стимулирующую клеточное метастазирование и/или клеточную инвазию.

21. Антагонист по п.18, где указанный рак представляет собой рак простаты, рак молочной железы или рак кожи.

22. Пептид, включающий аминокислотную последовательность TQDVFVGSVEELS AANTLVMKINATDADEPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:1), KINATDADEPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:6) или EELSAANTLV (SEQ ID NO:7), или ее фрагмент или вариант.

23. Полипептид, включающий аминокислотную последовательность SEQ ID NO:2 или ее фрагмент или вариант, где указанный полипептид содержит одну или более замен, инверсий и/или делеций аминокислотных остатков в пределах последовательности TQDVFVGSVEELSAANTLVMKINATDADEPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:1) EC2 домена Dsg2, или ее фрагмента или варианта.

24. Полипептид по п.23, где полипептид включает аминокислотную последовательность SEQ ID NO:8 или SEQ ID NO:9.

25. Антитело, способное специфически связываться с аминокислотной последовательностью TQDVFVGSVEELSAANTLVMKINATDADEPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:1) KINATDADEPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:6) или EELSAANTLV (SEQ ID NO:7), или ее фрагментом или вариантом.

26. Пептид по п.22 для применения в медицине.

27. Полипептид по п.23 для применения в медицине.

28. Антитело по п.25 для применения в медицине.

29. Фармацевтическая композиция, включающая в качестве антагониста пептид, полипептид или антитело по любому из пп.1, 22, 23 или 25 и фармацевтически приемлемый носитель.

30. Способ скрининга для антагонистов Dsg2, где указанный антагонист модулирует функцию аминокислотной последовательности: TQDVFGSVEELSAANTLVMKINA T DADEPNTLNSKISYR (SEQ ID NO:1) EC2 домена Dsg2, или ее фрагмента или варианта, включающий (i) экспонирование клеток, содержащих полипептид Dsg2 с тестируемым соединением; (ii) и определение влияния тестируемого соединения на функцию аминокислотной последовательности SEQ ID NO:1 EC2 домена Dsg2.

31. Способ по п.30, дополнительно включающий стадию отбора тестируемого соединения, которое снижает ЕМТ-стимулирующую активность Dsg2.

32. Способ по п.30, где способ включает дополнительную стадию смешивания выбранного агента (или его производного или аналога) с фармацевтически приемлемым носителем.

R U 2 0 1 2 1 1 6 1 5 2 A

R U 2 0 1 2 1 1 6 1 5 2 A