



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

**(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012142231/10, 03.03.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
05.03.2010 EP 10002268.0

(43) Дата публикации заявки: 10.04.2014 Бюл. № 10

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 05.10.2012(86) Заявка РСТ:  
EP 2011/053214 (03.03.2011)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/107553 (09.09.2011)

Адрес для переписки:

105082, Москва, Спартаковский пер., д. 2, стр. 1,  
секция 1, этаж 3, "ЕВРОМАРКПАТ"

(71) Заявитель(и):

**Ф.ХОФФМАНН-ЛЯ РОШ АГ (CH)**

(72) Автор(ы):

**Георг ФЕРТИГ (DE),  
Александр ФИДЛЕР (DE),  
Клаус КАЛУЦА (DE),  
Марлене ТОМАС (DE),  
Карола РИС (DE),  
Штефан ЗЕЕБЕР (DE)****(54) АНТИТЕЛА ПРОТИВ CSF-1R ЧЕЛОВЕКА И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ****(57) Формула изобретения**

1. Антитело, связывающееся с CSF-1R человека, отличающееся связыванием с тем же эпитопом, что и антитело, депонированное в коллекции под номером DSM ACC2922.

2. Антитело по п.1, отличающееся тем, что включает в качестве области CDR3 переменного домена тяжелой цепи области CDR3 последовательности SEQ ID NO:1, SEQ ID NO:9 или SEQ ID NO:17.

3. Антитело по п.2, отличающееся тем, что

а) переменный домен тяжелой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:1, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:2 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:3, и переменный домен легкой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:4, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:5 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:6; или

б) переменный домен тяжелой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:9, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:10 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:11, и переменный домен легкой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:12, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:13 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:14; или

в) переменный домен тяжелой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:17, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:18 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:19, и переменный домен легкой цепи включает область

CDR3 последовательности SEQ ID NO:20, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:21 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:22; или

г) вариант антител по пунктам а), б) или в) имеет пересаженную область CDR, является гуманизированным или у него ослаблен Т-клеточный эпитоп.

4. Антитело по п.3, отличающееся тем, что включает

а) аминокислотную последовательность переменного домена тяжелой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:7, и аминокислотную последовательность переменного домена легкой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:8; или

б) аминокислотную последовательность переменного домена тяжелой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:15, и аминокислотную последовательность переменного домена легкой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:16; или

в) аминокислотную последовательность переменного домена тяжелой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:23, и аминокислотную последовательность переменного домена легкой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:24; или

г) вариант антител по пунктам а), б) или в), который имеет пересаженную область CDR, является гуманизированным или у него ослаблен Т-клеточный эпитоп.

5. Антитело по пп.1-4, отличающееся тем, что указанное антитело относится к подклассу IgG4 человека или подклассу IgG1 человека.

6. Фармацевтическая композиция, отличающаяся включением антитела или фрагмента антитела по пп.1-5.

7. Антитело по пп.1-5 для лечения рака.

8. Антитело по пп.1-5 для лечения разрежения костей.

9. Антитело по пп.1-5 для предупреждения или лечения метастазов.

10. Антитело по пп.1-5 для лечения воспалительных заболеваний.

11. Нуклеиновая кислота, кодирующая тяжелую цепь антитела, связывающегося с CSF-1R, отличающаяся тем, что указанное антитело включает переменный домен по п.2, 3 или 4.

12. Векторы экспрессии, отличающиеся тем, что включают нуклеиновую кислоту по п.11 для экспрессии антитела, связывающегося с CSF-1R, в прокариотических или эукариотических клетках-хозяевах.

13. Прокариотические или эукариотические клетки-хозяева, включающие вектор по п.12.

14. Способ получения рекомбинантного антитела по пп.1-5, отличающийся экспрессией нуклеиновой кислотой по п.11 в прокариотических или эукариотических клетках-хозяевах и выделением указанного антитела из указанных клеток или супернатанта культур клеток.

15. Антитело, связывающееся с CSF-1R человека, отличающееся тем, что

а) переменный домен тяжелой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:1, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:2 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:3, и переменный домен легкой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:4, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:5 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:6; или

б) переменный домен тяжелой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:9, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:10 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:11, и переменный домен легкой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:12, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:13 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:14; или

в) переменный домен тяжелой цепи включает область CDR3, которая имеет последовательность последовательности SEQ ID NO:17, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:18 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:19, и переменный домен легкой цепи включает область CDR3 последовательности SEQ ID NO:20, область CDR2 последовательности SEQ ID NO:21 и область CDR1 последовательности SEQ ID NO:22; или

г) вариант антител по пунктам а), б) или в) имеет пересаживаемую область CDR, является гуманизированным или у него ослаблен Т-клеточный эпитоп.

16. Антитело по п.15, отличающееся тем, что включает

а) аминокислотную последовательность переменного домена тяжелой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:7, и аминокислотную последовательность переменного домена легкой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:8; или

б) аминокислотную последовательность переменного домена тяжелой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:15, и аминокислотную последовательность переменного домена легкой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:16; или

в) аминокислотную последовательность переменного домена тяжелой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:23, и аминокислотную последовательность переменного домена легкой цепи, которая имеет последовательность SEQ ID NO:24; или

г) вариант антител по пунктам а), б) или в), который имеет пересаживаемую область CDR, является гуманизированным или у него ослаблен Т-клеточный эпитоп.

RU 2012142231 A

RU 2012142231 A