

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2010136988/10, 05.02.2009

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
05.02.2008 US 61/026,317
14.08.2008 US 61/088,876

(43) Дата публикации заявки: 20.03.2012 Бюл. № 8

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 06.09.2010(86) Заявка РСТ:
CH 2009/000045 (05.02.2009)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2009/097704 (13.08.2009)Адрес для переписки:
103735, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО
"Союзпатент", пат.пov. А.Ю. Соболеву

(71) Заявитель(и):

ДЕЛЕНЕКС ТЕРАПЬЮТИКС АГ (CH)

(72) Автор(ы):

УРЕХ Дэвид (CH),
ЛИХТЛЕН Петер (CH)

RU 2010136988 A

(54) АНТИГЕНСВЯЗЫВАЮЩИЕ ПОЛИПЕПТИДЫ ПРОТИВ ДЕГЕНЕРАЦИИ ХРЯЩА

(57) Формула изобретения

1. Антигенсвязывающий полипептид для лечения, профилактики и/или замедления прогрессирования дегенерации хряща, причем данный полипептид способен проникать в хрящ.
2. Антигенсвязывающий полипептид по п.1, причем полипептид представляет собой одноцепочечное антитело.
3. Антигенсвязывающий полипептид по п.1 или 2, причем полипептид обладает растворимостью по меньшей мере в 5 мг/мл, более предпочтительно по меньшей мере в 10 мг/мл и наиболее предпочтительно по меньшей мере в 20 мг/мл.
4. Антигенсвязывающий полипептид по п.1, причем полипептид обладает молекулярной массой, по меньшей мере, 10 кДа, но менее 50 кДа.
5. Антигенсвязывающий полипептид по п.1, причем полипептид специфически связывается с цитокином, в частности IL-1 или TNF- α , с рецептором цитокина или с ферментом, разрушающим протеогликаны хряща.
6. Антигенсвязывающий полипептид по п.1, включающий:
область V_L, идентичную SEQ ID No. 1 по меньшей мере на 90%, более предпочтительно по меньшей мере на 95%; и/или
область V_H, идентичную SEQ ID No. 2 по меньшей мере на 90%, более предпочтительно по меньшей мере на 95%.

RU 2010136988 A

7. Антигенсвязывающий полипептид по п.1, причем полипептид имеет последовательность SEQ ID No. 3.

8. Антигенсвязывающий полипептид по п.1, причем значение рI антигенсвязывающего полипептида превышает 7,0, предпочтительно превышает 7,4 и более предпочтительно 7,8 или выше.

9. Применение антигенсвязывающего полипептида по любому из пп.1-8 для лечения, профилактики и/или замедления прогрессирования дегенерации хряща, в частности остеоартрита.

10. Применение антигенсвязывающего полипептида по любому из пп.1-8 для изготовления медикамента для лечения, профилактики и/или замедления прогрессирования дегенерации хряща, либо в качестве средства диагностики *in vitro* для выявления дегенерации хряща, в частности остеоартрита.

11. Композиция, включающая антигенсвязывающий полипептид по любому из пп.1-8, в частности фармацевтическая композиция.

12. Композиция по п.11, включающая водный раствор с рН-буфером, имеющий значение рН более 6,0.

13. Композиция по п.11 или 12, составляющая лекарственную форму, пригодную для внутрисуставного введения, в частности лекарственную форму с замедленным высвобождением.

14. Композиция по п.11, составляющая лекарственную форму, придающую общий положительный заряд данному полипептиду.

15. Композиция по п.11, в которой полипептид представляет собой scFv и специфически связывается с TNF- α .

16. Готовое изделие, включающее контейнер, содержащий антигенсвязывающий полипептид по любому из пп.1-8 или композицию по любому из пп.11-15.

17. Применение композиции по любому из пп.11-15 для лечения, профилактики и/или замедления прогрессирования дегенерации хряща и связанного с ней заболевания, в частности остеоартрита.

18. Последовательность ДНК, кодирующая антигенсвязывающий полипептид по любому из пп.1-8.

19. Клонирующий или экспрессирующий вектор, содержащий последовательность ДНК по п.18.

20. Подходящая клетка-хозяин, трансформированная экспрессирующим вектором по п.19.

21. Способ получения антигенсвязывающего полипептида по любому из пп.1-8, включающий культивирование клетки-хозяина по п.20 в условиях, способствующих синтезу данного антигенсвязывающего полипептида, и извлечение его из культуры.

22. Способ лечения, профилактики и/или замедления прогрессирования дегенерации хряща, в котором антигенсвязывающий полипептид по любому из пп.1-8 вводят местно, в частности внутрисуставно.