



**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:  
**СН 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.пов. А.Ю. Соболеву**

(71) Заявитель(и):

**ДЕЛЕНЕКС ТЕРАПЬЮТИКС АГ (СН)**

(72) Автор(ы):

**УРЕХ Дэвид (СН),  
ЛИХТЛЕН Петер (СН)**

**(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 ИЛ-1 или TNF- $\alpha$ , 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%.

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

8. Антигенсвязывающий полипептид по п.1, причем значение  $pI$  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- $\alpha$ .

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. Клонированный 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.