РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ

(19) **RU** (11) **2012 129 735** (13) **A**

(51) МПК
C07K 16/28 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: **2012129735/10, 17.12.2010**

Приоритет(ы):
(30) Конвенционный приоритет:
22.12.2009 EP 09015831.2

(43) Дата публикации заявки: **27.01.2014** Бюл. № **3**

(85) Дата начала рассмотрения заявки PCT на национальной фазе: **23.07.2012**

(86) Заявка PCT:
EP 2010/070062 (17.12.2010)

(87) Публикация заявки PCT:
WO 2011/076683 (30.06.2011)

Адрес для переписки:
191186, Санкт-Петербург, а/я 230, "АРС-ПАТЕНТ", И.И. Липатовой

(71) Заявитель(и):
РОШ ГЛИКАРТ АГ (CH)

(72) Автор(ы):
БОССЕНМАЙЕР Биргит (DE),
ДИМОУДИС Николаос (DE),
ФРИСС Томас (DE),
ЖОРЖ Ги (DE),
КОЛЬМ Ирен (DE),
КРЕЛЛЬ Ханс-Вилли (DE),
ЛИФКЕ Валериа (DE),
МЁССНЕР Эккехард (CH)

(54) АНТИТЕЛА К HER3 И ИХ ПРИМЕНЕНИЯ

(57) Формула изобретения

1. Антитело, которое связывается с человеческим HER3, характеризующееся тем, что вариабельный домен тяжелой цепи содержит CDR3H-область SEQ ID №1, CDR2H-область SEQ ID №2 и CDR1H-область SEQ ID №3, а вариабельный домен легкой цепи содержит CDR3L-область SEQ ID №4, CDR2L-область SEQ ID №5 и CDR1 L-область SEQ ID №6 или CDR1L-область SEQ ID №7.

2. Антитело по п.1, характеризующееся тем, что вариабельный домен тяжелой цепи VH представляет собой SEQ ID №8; а вариабельный домен легкой цепи VL представляет собой SEQ ID №9, или вариабельный домен легкой цепи VL представляет собой SEQ ID №10, или вариабельный домен легкой цепи VL представляет собой SEQ ID №11, или их гуманизированную версию.

3. Антитело по п.1, характеризующееся тем, что содержит в качестве вариабельного домена тяжелой цепи CDR3H-область SEQ ID №1, CDR2H-область SEQ ID №2, CDR1H-область SEQ ID №3, а вариабельный домен легкой цепи включает CDR3L-область SEQ ID №4, CDR2L-область SEQ ID №5 и CDR1L-область SEQ ID №6.

4. Антитело по п.3, характеризующееся тем, что вариабельный домен тяжелой цепи VH представляет собой SEQ ID №8; а вариабельный домен легкой цепи VL представляет собой SEQ ID №9, или вариабельный домен легкой цепи VL представляет собой SEQ ID №11.

5. Антитело по п.1, характеризующееся тем, что содержит в качестве вариабельного

RU 2012129735 A

RU 2012129735 A

домена тяжелой цепи CDR3H-область SEQ ID №1, CDR2H-область SEQ ID №2 и CDR1H-область SEQ ID №3, а вариабельный домен легкой цепи включает CDR3L-область SEQ ID №4, CDR2L-область SEQ ID №5 и CDR1L-область SEQ ID №7.

6. Антитело по п.1, характеризующееся тем, что вариабельный домен тяжелой цепи VH представляет собой SEQ ID №8; а вариабельный домен легкой цепи VL представляет собой SEQ ID №10.

7. Антитело, которое связывается с человеческим HER3, содержащее вариабельный домен тяжелой цепи VH, имеющий по меньшей мере 95% идентичность последовательности с SEQ ID №8, и вариабельный домен легкой цепи VL, имеющий по меньшей мере 95% идентичность последовательности с SEQ ID №9, SEQ ID №10 или SEQ ID №11.

8. Антитело по п.7, где вариабельный домен легкой цепи VL имеет по меньшей мере 95% идентичность последовательности с SEQ ID №9.

9. Антитело по п.7, где вариабельный домен легкой цепи VL имеет по меньшей мере 95% идентичность последовательности с SEQ ID №10.

10. Антитело по п.7, где вариабельный домен легкой цепи VL имеет по меньшей мере 95% идентичность последовательности с SEQ ID №11.

11. Антитело по пп.1-10, характеризующееся тем, что оно является моноклональным.

12. Антитело по пп.1-10, характеризующееся тем, что оно является гуманизированным.

13. Антитело по пп.1-10, характеризующееся тем, что оно относится к подклассу IgG1.

14. Антитело по пп.1-10, характеризующееся тем, что оно гликозилировано сахарной цепочкой на Asn297, при этом количество фукозы в указанной сахарной цепочке составляет 65% или ниже.

15. Фармацевтическая композиция, которая характеризуется тем, что содержит антитело по пп.1-14.

16. Антитело по пп.1-10 для лечения рака.

17. Применение антитела по пп.1-14 для изготовления лекарственного средства для лечения рака.

18. Способ лечения пациента, страдающего от рака, путем введения указанному пациенту, которому необходимо такое лечение, антитела по пп.1-14.

19. Нуклеиновая кислота, кодирующая тяжелую и легкую цепь антитела, которое связывается с человеческим HER3, характеризующаяся тем, что антитело содержит вариабельный домен по п.2.

20. Экспрессионный вектор, который характеризуется тем, что содержит нуклеиновую кислоту по п.19 для экспрессии антитела по пп.1-9 в прокариотической или эукариотической клетке-хозяине.

21. Прокариотическая или эукариотическая клетка-хозяин, содержащая вектор по п.20.

22. Способ производства рекомбинантного антитела по пп.1-14, который характеризуется экспрессией нуклеиновой кислоты по п.19 в прокариотической или эукариотической клетке-хозяине и восстановлением указанного антитела из указанной клетки или клеточного культурального супернатанта.

RU 2012129735 A

RU 2012129735 A