

REPUBLICA MOLDOVA



(19) Agenția de Stat
pentru Proprietatea Intelectuală

(51) Int.Cl: C07K 14/605 (2006.01)
A61K 38/26 (2006.01)
A61K 38/28 (2006.01)

(12) CERERE DE BREVET DE INVENȚIE

(21) Nr. depozit: a 2017 0055 (22) Data depozit: 2015.10.22 (31) Nr.: 62/068157; 62/208869 (32) Data: 2014.10.24; 2015.08.24 (33) Țara: US; US (41) Data publicării cererii: 2017.09.30, BOPI nr. 9/2017	(13) A2 (85) Data deschiderii fazei naționale în conformitate cu PCT, 2017.05.22 (86) Cerere internațională PCT: PCT/US2015/056794, 2015.10.22 (87) Publicare internațională: WO 2016/065090 A1, 2016.04.28
(71) Solicitant: MERCK SHARP & DOHME CORP., US (72) Inventatori: CARRINGTON Paul E., US; DENG Qiaolin, US; NARGUND Ravi, US; PALANI Anandan, US; TUCKER Thomas Joseph, US; WU Chengwei, US; BIANCHI Elisabetta, IT; ORVIETO Federica, IT (74) Mandatar autorizat: ANDRIEȘ Ludmila	

(54) Co-agoniști ai receptorilor glucagonului și GLP-1

(57) Rezumat:

1
Invenția se referă la analogi peptidici ai glucagonului obținuți prin modificare în scopul de a obține rezistență la clivaj și la inactivare cu dipeptidil peptidaza IV (DPP - IV) și pentru a crește *in vivo* timpul de înjumătățire a analogului peptidic, permițând, totodată, analogului peptidic să posede o activitate agonistă relativ egală cu activitatea agonistă în ceea ce privește receptorul peptidei de tipul glucagonului 1 (GLP - 1) și receptorul pentru

2
glucagon (GCG), precum și la utilizarea unor astfel de co-agoniști ai receptorului pentru GLP - 1/receptorului pentru GCG pentru tratamentul tulburărilor metabolice, cum ar fi diabetul zaharat, boala de ficat gras nealcoolică (NAFLD), steatohepatita nealcoolică (NASH) și obezitatea.

Revendicări: 102
Figuri: 4
Secvențe: 35

Șef Secție Examinare:

LEVIȚCHI Svetlana

Examinator:

GROSU Petru

Redactor:

LOZOVANU Maria

(54) Co-agonists of the glucagon and GLP-1 receptors**(57) Abstract:**

1
The invention relates to peptide analogs of glucagon, which have been modified to be resistant to cleavage and inactivation by dipeptidyl peptidase IV (DPP-IV) and to increase in vivo half-life of the peptide analog while enabling the peptide analog to have relatively balanced agonist activity at the glucagon-like peptide 1 (GLP-1) receptor and the glucagon (GCG) receptor, and the use of

2
such GLP-1 receptor/GCG receptor co-agonists for treatment of metabolic disorders such as diabetes, non-alcoholic fatty liver disease (NAFLD), non-alcoholic steatohepatitis (NASH), and obesity.

Claims: 102

Fig.: 4

Sequences: 35

(54) Ко-агонисты рецепторов глюкагона и GLP-1**(57) Реферат:**

1
Изобретение относится к пептидным аналогам глюкагона, полученные путем модификации с целью достижения устойчивости к расщеплению и инактивации с дипептидилпептидазой IV (DPP - IV) и для увеличения периода полураспада пептидного аналога *in vivo*, также, позволяет пептидному аналогу обладать относительно равной агонистической активностью в отношении рецептора пептида типа глюкагон 1 (GLP -

2
1) и рецептора глюкагона (GCG), а также для применения таких ко-агонистов рецептора GLP - 1/рецептора для GCG для лечения метаболических расстройств, таких как сахарный диабет, неалкогольная жировая болезнь печени (NAFLD), неалкогольный стеатогепатит (NASH) и ожирение.

П. формулы: 102

Фиг.: 4

Последовательности: 35