



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20200103 T1



HR P20200103 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:
C07K 14/605 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 03.04.2020.

(21) Broj predmeta: P20200103T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 21.01.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2014072294
Datum podnošenja međunarodne prijave: 17.10.2014.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 14793463.2
Datum podnošenja europske prijave patenta: 17.10.2014.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2015055802
Datum međunarodne objave: 23.04.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3057983 A2
Datum objave europske prijave patenta: 24.08.2016.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3057983 B1
Datum objave europskog patenta: 13.11.2019.

(31) Broj prve prijave: 201361892250 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 17.10.2013. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

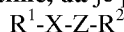
(73) Nositelji patenta: Zealand Pharma A/S, Sydmarken 11, 2860 Søborg, DK
Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216
Ingelheim am Rhein, DE
(72) Izumitelji: Ditte Riber, Zealand Pharma A/S, Smedeland 36, 2600 Glostrup, DK
Jakob Lind Tolborg, Zealand Pharma A/S, Smedeland 36, 2600 Glostrup,
DK
Dieter Wolfgang Hamprecht, Boehringer Ingelheim GmbH, Binger
Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE
(74) Zastupnik: CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: ANALOZI GLUKAGONA

HR P20200103 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj, **naznačen time, da** je predstavljen formulom:



u kojoj:

R^1 je H (naime vodik), C_{1-4} -alkil, acetyl, formil, benzoyl ili trifluoroacetyl;

R^2 je OH ili NH_2 ;

X je peptid koji ima sljedeću sekvencu:

H-X2-X3-GTFTSDYSKYL-X15-X16-X17-X18-A-X20-DFI-X24-WLE-X28-A

gdje:

X2 je odabran od Ac3c, Ac4c i Ac5c;

X3 je odabran od Gln i His;

X15 je odabran od Asp i Glu;

X16 je odabran od Glu, Lys i Ψ ;

X17 je odabran od Lys, Arg i Ψ ;

X18 je odabran od Ala i Arg;

X20 je odabran od Lys i Ψ ;

X24 je odabran od Glu, Lys i Ψ ;

X28 je odabran od Ser, Lys i Ψ ;

gdje svaki Ψ predstavlja ostatak koji je neovisno odabran od Lys, Arg, Orn i Cys, te gdje je bočni lanac od svakog ostatka Ψ konjugiran na lipofilni supstituent;

te time, da je Z odsutan ili je to sekvencija od 1-20 aminokiselinskih jedinica koje su neovisno odabrane iz skupine koja se sastoji od Ala, Leu, Ser, Thr, Tyr, Cys, Glu, Lys, Arg, Dbu, Dpr i Orn; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili njegov solvat.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** peptid X ima sekvencu odabranu od sljedećih:

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDEKAAKDFIEWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDEKRAKDFIEWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDKRAAKDFIEWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDEKRAKDFIEWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERAAKDFIKWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAKDFIKWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERAAKDFIEWLEKA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAKDFIEWLEKA

H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDEKAAKDFIEWLESA i

H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDEKRAKDFIEWLESA.

3. Spoj prema zahtjevu 2, **naznačen time, da** je odabran od sljedećih:

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDEKAAKDFIEWLESA- NH_2

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDEKRAKDFIEWLESA- NH_2

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDKRAAKDFIEWLESA- NH_2

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDEKRAKDFIEWLESA- NH_2

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERAAKDFIKWLESA- NH_2

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAKDFIKWLESA- NH_2

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERAAKDFIEWLEKA- NH_2

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAKDFIEWLEKA- NH_2

H-H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDEKAAKDFIEWLESA- NH_2 i

H-H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDEKRAKDFIEWLESA- NH_2 .

4. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** peptid X ima sekvencu koja je odabrana od sljedećih:

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDE Ψ AAKDFIEWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDE Ψ RAKDFIEWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLD Ψ RAAKDFIEWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDE Ψ RAKDFIEWLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERAAKDFI Ψ WLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAKDFI Ψ WLESA

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERAAKDFIEWLE Ψ A

H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAKDFIEWLE Ψ A

H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDE Ψ AAKDFIEWLESA i

H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDE Ψ RAKDFIEWLESA.

5. Spoj prema zahtjevu 4, **naznačen time, da** je odabran od sljedećih:

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDE Ψ AAKDFIEWLESA- NH_2

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDE Ψ RAKDFIEWLESA- NH_2

H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDΨRAAKDFIEWLESA-NH₂
H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDEΨRAKDFIEWLESA-NH₂
H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAAKDFIΨWLESA-NH₂
H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAKDFIΨWLESA-NH₂
H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAAKDFIEWLEΨA-NH₂
H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAKDFIEWLEΨA-NH₂
H-H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDEΨAAKDFIEWLESA-NH₂ i
H-H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDEΨRAKDFIEWLESA-NH₂.

5

10

15

20

25

35

40

45

50

6. Spoj prema zahtjevu 4, **naznačen time, da** je to
H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDERRAAKDFIΨWLESA-NH₂.
7. Spoj prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, **naznačen time, da** kada je Ψ prisutan, tada lipofilni supstituent ima formulu Z¹ gdje je Z¹ lipofilni dio skupine konjugiran direktno na bočni lanac od ostatka Ψ, ili Z¹Z² gdje Z¹ je lipofilni dio skupine, a Z² je držač razmaka, i Z¹ je konjugiran na bočni lanac ostatka Ψ preko Z².
8. Spoj prema zahtjevu 7, **naznačen time, da** aminokiselinska komponenta od Ψ je Lys.
9. Spoj prema zahtjevu 8, **naznačen time, da** Ψ je Lys(heksadekanoil-izoGlu).
10. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** ima sekvencu kako slijedi:
H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDE-K(heksadekanoil-izoGlu)-AAKDFIEWLESA ili
H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDE-K(heksadekanoil-izoGlu)-AAKDFIEWLESA.
11. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** je odabran od sljedećih:
H-H-Ac4c-QGTFTSDYSKYLDE-K(heksadekanoil-izoGlu)-AAKDFIEWLESA-NH₂ i
H-H-Ac4c-HGTFTSDYSKYLDE-K(heksadekanoil-izoGlu)-AAKDFIEWLESA-NH₂.
12. Farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačena time, da** je od spoja prema bilo kojem od zahtjeva 2 do 11.
13. Sastav, **naznačen time, da** obuhvaća spoj ili farmaceutski prihvatljivu sol prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 12 u mješavini s nosačem, primjerice gdje je sastav farmaceutski pripravak, a nosač je farmaceutski prihvatljiv nosač.
14. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 12, **naznačen/a time, da** se upotrebljava u liječenju.
15. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 12, **naznačen/a time, da** se upotrebljava u:
 - (i) terapijskom postupku prevencije dobivanja na težini ili promicanja gubitka težine;
 - (ii) terapijskom postupku smanjivanja razina LDL u cirkulaciji, i/ili povećavanja omjera HDL/LDL; ili
 - (iii) postupku prevencije ili liječenja pretilosti, morbidne pretilosti prije operativnog zahvata, upale povezane s pretilosti, bolesti žučnog mjehura kojoj je uzrok pretilost, apneje u spavanju koja je izazvana putem pretilosti, dijabetesa, metaboličkog sindroma, hipertenzije, aterogenske dislipidemije, ateroskleroze, arterioskleroze, koronarne srčane bolesti, bolesti perifernih arterija, moždanog udara ili mikrovaskularne bolesti.
16. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol za uporabu prema zahtjevu 15, **naznačen/a time, da** se spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol primjenjuje kao dio kombinirane terapije zajedno sa sredstvom za liječenje dijabetesa, pretilosti, dislipidemije ili hipertenzije.
17. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol za uporabu prema zahtjevu 16, **naznačen/a time, da:**
 - (i) sredstvo za liječenje dijabetesa je bigvanid (primjerice metformin), sulfonilurea, meglitinid ili glinid, (primjerice nateglinid), DPP-IV-inhibitor, SGLT2-inhibitor, glitazon, neki drugi agonist za GLP-1, inzulin ili analog inzulina;
 - (ii) sredstvo za liječenje pretilosti je agonist peptidnog receptora 1 koji je nalik na glukagon, agonist peptidnog receptora YY ili njegov analog, antagonist kanabinoidnog receptora 1, inhibitor lipaze, agonist melanokortinskog receptora 4, antagonist receptora 1 melaninskog koncentracijskog hormona, fentermin, kombinacija inhibitora ponovnog nakupljanja norepinefrina/dopamina i antagonista receptora opioida (primjerice kombinacija fentermina i topiramata), kombinacija bupropiona i naltreksona, ili serotonergijsko sredstvo;
 - (iii) dok sredstvo za liječenje hipertenzije je inhibitor enzima za konverziju angiotenzina, blokator receptora II angiotenzina, diuretik, beta blokator ili blokator kanala kalcija; ili
 - (iv) sredstvo za liječenje dislipidemije je statin, fibrat, niacin i/ili inhibitor apsorpcije kolesterola.