



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11)(21) Patenttihakemus-Patentansökan 873185
(51) Kv.lk.⁴/Int.cl.⁴ C 07 K 7/40, C 12 P 21/00
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 20.07.87
(23) Alkupäivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 22.01.88
(86) Kv. hakemus-Int.ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 21.07.86 DK 3470/86

(71) Hakija/Sökande: *Novo Industri A/S*, Novo Alle, Bagsvaerd, Tanska

(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Markussen, Jan 2. Norris, Kjeld 3. Langkjaer, Liselotte

(74) Asiamies/Ombud: Berggren

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Uusia peptidejä. Nya peptider.

(57)Tiivistelmä

Keksintö koskee insuliinijohdannaisia, joiden varaus on positiivinen verrattuna humaani-insuliinin varaukseen neutraalissa pH:ssa ja joita voidaan käyttää valmistettaessa liuoksia, joilla on pidennetty insuliinin vaikutus. Uusissa insuliinijohdannaisissa emäksinen aminohappo on substituoitu B27-asemassa ja/tai neutraali aminohappo on sijoitettu A4-, A17-, B13- ja/tai B21-^{A21} asemaan. A-ketjun C-pääte, Asn^{A21}, voidaan substituoida jollain muulla aminohapolla liuosten stabiilisuuden lisäämiseksi farmaseuttisten liuosten heikosti happamassa pH:ssa. Edelleen, B-ketjun C-terminaalinen karboksyyli-ryhmä voidaan suojata amido- tai esteritäh-teellä. Edellyttäen, että A21 on Asn, on B30:n karboksyylihapporyhmä vapaa.

(57)Sammandrag

Uppfinningen avser insulinderivat med en positiv laddning jämförd till human-insulins laddning vid neutral pH, och de kan användas för att preparera lösningar med en prolongerad insulinverkan. Vid de nya insulinderivaten är en alkalisk aminosyra substituerad i en B27-position och/eller en neutral aminosyra är placerad i en A4-, A17-, B13- och/eller B21-position. C-terminalen av A-kedja, Asn^{A21}, kan substitueras med någon annan aminosyra för att öka lösningars stabilitet vid svagt syrlig pH av farmaceutiska lösningar. Vidare, B-kedjas C-terminalkarboksylgrupp kan blockeras med en amido- eller esterrest. Förutsatt att A21 är Asn, är karboxylsyragruppen av B30 fri.