



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20240906 T1

HR P20240906 T1

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

(51) MKP:

A61K 38/00 (2006.01)
A61K 38/16 (2006.01) **A61P 3/00** (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01) **A61K 38/22** (2006.01)
C07K 14/575 (2006.01) **C07K 14/72** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 11.10.2024.

(21) Broj predmeta: P20240906T

(22) Datum podnošenja : 18.08.2021.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2021072923
Datum podnošenja međunarodne prijave: 18.08.2021.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 21777954.5
Datum podnošenja europske prijave patenta: 18.08.2021.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2022038179
Datum međunarodne objave: 24.02.2022.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 4199946 A1
Datum objave europske prijave patenta: 28.06.2023.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 4199946 B1
Datum objave europskog patenta: 05.06.2024.

(31) Broj prve prijave: 20315387

(32) Datum podnošenja prve prijave: 19.08.2020.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

SANOFI, 46, avenue de la Grande Armée, 75017 Paris, FR
Stephane Illiano, 75008 Paris, FR
Laurence Lucats, 75008 Paris, FR
Laetitia Ledein, 75008 Paris, FR
Philippe Beauverger, 75008 Paris, FR
Philip Janiak, 75008 Paris, FR
Marie-Laure Ozoux, 75008 Paris, FR
Nis Halland, 65926 Frankfurt am Main, DE
Ziyu Li, 65926 Frankfurt am Main, DE
Ralf Elvert, 65926 Frankfurt am Main, DE
Andreas Evers, 65926 Frankfurt am Main, DE
Elisabetta Bianchi, 00071 Pomezia, IT
Alessia Santoprete, 00071 Pomezia, IT
Daniela Roversi, 00071 Pomezia, IT
Martina Tripepi, 00071 Pomezia, IT

(74) Zastupnik:

Vukmir i suradnici odvjetničko društvo d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

AGONISTI CRF2 RECEPTORA I NJIHOVA PRIMJENA U TERAPIJI

HR P20240906 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj koji je peptid koji sadrži aminokiselinsku sekvencu formule (I):
 X1-X2-X3-X4-X5-X6-X7-X8-X9-X10-X11-X12-X13-X14-X15-X16-X17-X18-X19-X20- X21 - X22- X23- X24-
 X25- X26- X27 - X28- X29- X30- X31 - X32 - X33- X34- X35-X36-X37-X38 (I), pri čemu

X1 je izoleucin (I) ili fenilalanin (F);

X2 je valin (V) ili treonin (T);

X3 je leucin (L);

X4 je serin (S);

X5 je leucin (L);

X6 je aspartat (D);

X7 je valin (V) ili D-valin (v);

X8 je prolin (P);

X9 je izoleucin (I) ili treonin (T);

X10 je lizin (K), glutamat (E), histidin (H) ili glicin (G);

X11 je izoleucin (I) ili leucin (L);

X12 je lizin (K), pri čemu je epsilon-amino grupa bočnog lanca lizina kovalentno vezana na skupinu koja veže albumin;

X13 je glutamin (Q) ili lizin (K);

X14 je izoleucin (I), lizin (K) ili 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib);

X15 je leucin (L);

X16 je leucin (L) ili fenilalanin (F);

X17 je glutamat (E) ili lizin (K);

X18 je glutamin (Q);

X19 je alanin (A), glutamat (E) ili glutamin (Q);

X20 je lizin (K) ili arginin (R);

X21 je glutamin (Q) ili lizin (K);

X22 je lizin (K), arginin (R) ili glutamat (E);

X23 je lizin (K) ili 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib);

X24 je glutamin (Q), 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib), leucin (L) ili glutamat (E);

X25 je arginin (R), lizin (K) ili 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib);

X26 je alanin (A), glutamat (E), 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib) ili glutamin (Q);

X27 je glutamin (Q), 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib) ili lizin (K);

X28 je alanin (A);

X29 je glutamat (E) ili lizin (K);

X30 je lizin (K) ili treonin (T);

X31 je asparagin (N) ili alanin (A);

X32 je lizin (K), alanin (A), valin (V), treonin (T), glutamat (E) ili 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib);

X33 je arginin (R), lizin (K) ili glutamin (Q);

X34 je izoleucin (I) ili leucin (L);

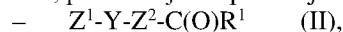
X35 je leucin (L);

X36 je alanin (A) ili glutamat (E);

X37 je glutamin (Q) ili arginin (R); i

X38 je izoleucin (I) ili valin (V);

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol; pri čemu je skupina koja veže albumin grupa formule (II):



pri čemu

Y je AEEA, {AEEA}₂, {AEEA}₃, Gly, {Gly}₂, {Gly}₃, N-MeGly, {N-MeGly}₂, {N-MeGly}₃ ili nije prisutan kada je Z² gGlu ili {gGlu}₂, pri čemu AEEA označava [2-(2-aminoetoksi)etoksi]-acetyl;

Z¹ i Z² svaki su neovisno odabrani između gGlu, {gGlu}₂, {gGlu}₃, {gGlu}₄ ili nisu prisutni, pri čemu Z¹ nije prisutan kad je Y {AEEA}₂ i Z² gGlu ili {gGlu}₂; i

R¹ je -(CH₂)_xCOOH ili -(CH₂)_xCH₃, pri čemu je x cijeli broj od 12 do 22.

2. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je skupina koja veže albumin odabrana iz sljedećih grupa:

– (gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₄CH₃

– (gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₄COOH

– (gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₆CH₃

– (gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₆COOH

– (gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₈CH₃

– (gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₈COOH

– (AEEA)_{n=1,2}--(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₄CH₃

– (AEEA)_{n=1,2}--(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₄COOH

– (AEEA)_{n=1,2}--(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₆CH₃

- $(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH_2)_{16}COOH$
- $(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH_2)_{18}CH_3$
- $(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH_2)_{18}COOH$
- $(gGlu)_{n=1-4}-(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH_2)_{14}CH_3$
- $(gGlu)_{n=1-4}-(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH_2)_{14}COOH$
- $(gGlu)_{n=1-4}-(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH_2)_{16}CH_3$
- $(gGlu)_{n=1-4}-(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH_2)_{16}COOH$
- $(gGlu)_{n=1-4}-(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH_2)_{18}CH_3$; i
- $(gGlu)_{n=1-4}-(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH_2)_{18}COOH$.

3. Spoj prema zahtjevima 1 ili 2, pri čemu:

- X1 je izoleucin (I);
- X2 je valin (V);
- X7 je valin (V) ili D-valin (v);
- X9 je izoleucin (I) ili treonin (T);
- X10 je lizin (K) ili glicin (G);
- X11 je leucin (L);
- X13 je lizin (K) ili glutamin (Q);
- X14 je lizin (K) ili izoleucin (I);
- X16 je leucin (L);
- X19 je alanin (A) ili glutamat (E);
- X21 je glutamin (Q);
- X22 je glutamat (E), arginin (R) ili lizin (K);
- X23 je lizin (K) ili 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib);
- X24 je glutamat (E) ili glutamin (Q) ili 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib);
- X25 je lizin (K) ili arginin (R);
- X26 je alanin (A), glutamat (E) ili glutamin (Q);
- X27 je 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib); lizin (K) ili glutamin (Q);
- X29 je glutamat (E);
- X30 je lizin (K) ili treonin (T);
- X31 je asparagin (N);
- X32 je lizin (K) ili alanin (A);
- X33 je arginin (R) ili glutamin (Q);
- X34 je izoleucin (I);
- X35 je leucin (L);
- X36 je alanin (A) ili glutamat (E);
- X37 je arginin (R) ili glutamin (Q); i
- X38 je valin (V).

4. Spoj prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, pri čemu:

- X7 je D-valin (v);
- X10 je lizin (K) ili glicin (G);
- X19 je alanin (A) ili glutamat (E);
- X34 je 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib) ili lizin (K);
- X24 je 2-aminoizomaslačna kiselina (Aib) ili glutamin (Q);
- X25 je arginin (R);
- X26 je glutamin (Q), alanin (A) ili glutamat (E);
- X27 je glutamin (Q) ili lizin (K);
- X30 je treonin (T) ili lizin (K);
- X33 je arginin (R) ili glutamin (Q);
- X36 je alanin (A) ili glutamat (E); i
- X37 je arginin (R) ili glutamin (Q).

5. Spoj prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, pri čemu:

- X10 je lizin;
- X19 je glutamat (E);
- X24 je glutamin (Q);
- X25 je arginin (R);
- X26 je glutamat (E);
- X27 je glutamin (Q);
- X30 je lizin (K);
- X33 je glutamin (Q);
- X36 je alanin (A); i
- XX37 je glutamin (Q).

6. Spoj prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, pri čemu je spoj peptid aminokiselinske sekvence formule (I), pri čemu je opcionalno aminokiselinski ostatak na X1 aciliran i pri čemu je opcionalno aminokiselinski ostatak na X38 amidiran; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
7. Spoj prema zahtjevu 6, pri čemu je aminokiselinski ostatak na X38 amidiran kao C-terminalni primarni amid.
- 5 8. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je skupina koja veže albumin odabrana iz sljedećih grupa:
 - (gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₄COOH
 - (gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₆COOH
 - (gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₈COOH
 - (AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₄COOH
 - 10 – (AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₆COOH
 - (AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₈COOH
 - (gGlu)_{n=1-4}-(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₄COOH
 - (gGlu)_{n=1-4}-(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₆COOH
 - (gGlu)_{n=1-4}-(AEEA)_{n=1,2}-(gGlu)_{n=1-4}-C(O)(CH₂)₁₈COOH
- 15 9. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je skupina koja veže albumin -{AEEA}₂-gGlu-C(O)(CH₂)₁₄COOH ili -{AEEA}₂-gGlu-C(O)(CH₂)₁₆COOH.
10. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj peptid bilo koje sekvence SEQ ID br. 1 do 227 ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
11. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj peptid bilo koje sekvence SEQ ID br. 3, 7, 35, 83, 130, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 147, 149, 151, 152 171, 172, 173 i 174 ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
- 20 12. Farmaceutski pripravak koji sadrži spoj prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva i farmaceutski prihvatljivu pomoćnu tvar, razrjeđivač ili nositelj.
13. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11 ili farmaceutski pripravak prema zahtjevu 12 za primjenu u terapiji.
14. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11 ili farmaceutski pripravak prema zahtjevu 12 za primjenu u metodi liječenja ili prevencije kardiovaskularne bolesti, pretilosti ili dijabetesa u bolesnika.
- 25