



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20201959 T1

HR P20201959 T1

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

(51) MKP:

A61K 38/00 (2006.01)
A61P 21/00 (2006.01)
A61P 25/14 (2006.01)
A61P 25/16 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)
C07K 14/605 (2006.01)
C07K 14/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 25/02 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)
A61P 25/08 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 16.04.2021.

(21) Broj predmeta: P20201959T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 07.12.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/GB2017053655
Datum podnošenja međunarodne prijave: 04.12.2017.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 17811693.5
Datum podnošenja europske prijave patenta: 04.12.2017.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2018104718
Datum međunarodne objave: 14.06.2018.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3548061 A1
Datum objave europske prijave patenta: 09.10.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3548061 B1
Datum objave europskog patenta: 09.09.2020.

(31) Broj prve prijave: 201620611 (32) Datum podnošenja prve prijave: 05.12.2016. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta: **Lancaster University Business Enterprises Limited, University House
Bailrigg, Lancaster LA1 4YW, GB**

(72) Izumitelj: **Christian Hölscher, Lancaster, Lancashire LA1 4YQ, GB**

(74) Zastupnik: **ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

(54) Naziv izuma: **LIJEČENJE NEUROLOŠKIH BOLESTI**

HR P20201959 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. GIP/GLP-1 ko-agonistički peptid predstavljen općom formulom I:
 Tyr-Aib-Glu-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Tyr-Ser-Ile-Tyr-Leu-Asp-Lys-Gln-Ala-Ala-Aib-
 Glu-Phe-Val-Xaa²⁴-Trp-Leu-Leu-Ala-Gly-Y1-Y2-R²

(I) (SEQ. ID. No. 1)

- 5 naznačen time što Xaa²⁴ je Asn;
 Y1 je Gly-Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Pro-Ser-Lys (SEQ. ID. No. 7);
 Y2 je odabran od:
 Lys-Lys-Lys-Lys-Lys-Lys (SEQ. ID. No. 3); i
 Arg-Arg-Gln-Arg-Arg-Lys-Lys-Arg-Gly-Tyr (SEQ. ID. No 4); i
 10 R² je -NH₂,
 ili farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat peptida.
2. Peptid prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što se sastoji od aminokiselinske sekvence:
 YXEGTFTSDYSIILDKQAAXEFVNWLLAGGPSSGAPPPSKKKKKK-NH₂ (SEQ. ID. No. 11)
 pri čemu X = aminoizomaslačna kiselina.
- 15 3. Peptid prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što se sastoji od aminokiselinske sekvence:
 YXEGTFTSDYSIILDKQAAXEFVNWLLAGGPSSGAPPPSKRRQRKRGY-NH₂ (SEQ. ID. No. 12)
 pri čemu X = aminoizomaslačna kiselina.
4. Peptid prema bilo kojem prethodnom patentnom zahtjevu, naznačen time što sadrži hidrofilni dio koji je kovalentno vezan za aminokiselinu.
- 20 5. Peptid prema patentnom zahtjevu 4, naznačen time što sadrži hidrofilni dio koji je kovalentno vezan za (i) aminokiselinu na položaju 24 ili (ii) aminokiselinu na položaju 39 ili 40.
6. Peptid prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 4 do 5, naznačen time što je hidrofilni dio vodotopivi polimer, pri čemu je izborno vodotopivi polimer dio polietilen glikola i izborno je dio polietilen glikola koji ima molekulsku masu između oko 20,000 Daltona i oko 60,000 Daltona.
- 25 7. Peptid prema bilo kojem prethodnom patentnom zahtjevu, naznačen time što je peptid konjugiran s lipofilnim supstituentom.
8. Peptid prema patentnom zahtjevu 7, naznačen time što lipofilni supstituent sadrži acilnu skupinu i izborno je molekula masne kiseline, te nadalje pri čemu je izborno molekula masne kiseline odabrana od C-8 oktanoilne skupine, C-10 dekanoilne skupine, C-12 lauroilne skupine, C-14 miristoilne skupine, C-16 palmitoilne skupine, C-18 stearoilne skupine i C-20 acilne skupine.
- 30 9. Peptid prema patentnom zahtjevu 7 ili zahtjevu 8, naznačen time što je lipofilni supstituent vezan za aminokiselinu na karboksilnom kraju peptida.
10. Peptid prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 7 do 9, naznačen time što sadrži razmaknicu koja konjugira lipofilni supstituent na aminokiselinski ostatak.
- 35 11. Peptid prema patentnom zahtjevu 10, naznačen time što je razmaknica ostatak prirodne ili neprirodne aminokiseline, pri čemu razmaknica sadrži ostatak Gly, Pro, Ala, Val, Leu, Ile, Met, Cys, Phe, Tyr, Trp, His, Lys, Arg, Gln, Asn, α-Glu, γ-Glu, ε-Lys, Asp, Ser, Thr, Gaba, Aib, β-aminoheksanil, 7-aminoheptanoil, 8-amino-oktanoil, 9-aminononanoil, 10-aminodekanoil ili 8-amino-3,6-dioksaoktanoil.
- 40 12. Peptid prema patentnom zahtjevu 11, naznačen time što je razmaknica γ-Glu ili pri čemu je razmaknica dipeptid, izborno gdje razmaknica sadrži dvije negativno nabijene aminokiseline i nadalje proizvoljno gdje je razmaknica γ-Glu-γ-Glu.
13. Peptid prema bilo kojem prethodnom patentnom zahtjevu, naznačen time što je za uporabu u liječenju i/ili profilaksi neurološkog poremećaja, kao što je neurološki poremećaj koji je uzrokovan ili povezan s taloženjem plaka beta-amiloidnog proteina u području pacijenta, ili neurološki poremećaj uzrokovan ili povezan s:
 a) disfunkcijom dugotrajnog potenciranja sinaptičkog prijenosa; ili
 b) upalom.
- 45 14. Peptid prema patentnom zahtjevu 13, naznačen time što je za uporabu u liječenju i/ili profilaksi neurološkog poremećaja koji utječe na kognitivnu funkciju, npr. demencija, moždani udar, shizofrenija i/ili bipolarni poremećaj, pri čemu je izborno poremećaj cerebralna ishemija povezana s moždanim udarom, ili za uporabu u liječenju i/ili profilaksi poremećaja odabranog od posttraumatskog stresnog poremećaja, epilepsije, Touretteovog sindroma i halucinacija; i disfunkcionalnih kognitivnih procesa, koji su izborno odabrani od pažnje, računanja, pamćenja, prosuđivanja, uvida, učenja i obrazloženja,
 55 ili za uporabu u liječenju i/ili profilaksi neurodegenerativnog poremećaja npr. Alzheimerove bolesti, Parkinsonove bolesti, amiotrofične lateralne skleroze, periferne neuropatije, Huntingtonove bolesti i Creutzfeldt-Jacobove bolesti,

ili za uporabu u liječenju i/ili profilaksi neurološkog poremećaja odabranog između kliničke ili predkliničke Alzheimerove bolesti, prodromalnog stadija Alzheimerove bolesti i kliničke ili pretkliničke amiloidne angiopatije (CAA).

15. Peptid za uporabu u liječenju i/ ili profilaksi kliničke Alzheimerove bolesti, te se peptid sastoji od slijedeće sekvence:

5

(a) YXEGTFTSDYSIILDKQAAXEFVNWLLAGGPSSGAPPPSKKKKKK-NH₂ (SEQ ID No. 11)

pri čemu X = aminoizomaslačna kiselina; ili

(b) YXEGTFTSDYSIILDKQAAXEFVNWLLAGGPSSGAPPPSKRRQRRKKRGY-NH₂ (SEQ ID No. 12)

pri čemu X = aminoizomaslačna kiselina.