



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2721062 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07K 14/575 (2006.01)
A61K 38/26 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01)
C07K 17/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.04.15
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.11.14
(86)	European Application Nr.	12801247.3
(86)	European Filing Date	2012.06.15
(87)	The European Application's Publication Date	2014.04.23
(30)	Priority	2011.06.17, KR, 20110058852
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Hanmi Science Co., Ltd., 550, Dongtangiheung-ro Dongtan-myeon, Hwaseong-si, Gyeonggi-do 445-813, Sør-Korea
(72)	Inventor	JUNG, Sung Youb, 109-105 World Meridian Apt.Uman-dongPaldal-gu, Suwon-siGyeonggi-do 442-190, Sør-Korea KIM, Dae Jin, 506-1901 Anhwadong Maeul Jugong 5DanjiByeongjeom-dong, Hwaseong-siGyeonggi-do 445-764, Sør-Korea PARK, Sung Hee, 603-1804, 209, Pangyowon-ro, Bundang-gu,Seongnam-si, Gyeonggi-do 463-959, Sør-Korea WOO, Young Eun, 106-1307 Nuri Apt.Wolpyeong 3-dongSeo-gu, Daejeon 302-791, Sør-Korea CHOI, In Young, 105-1801 Byeoksan Apt.Jukjeon 2-dongSuji-gu, Yongin-siGyeonggi-do 448-755, Sør-Korea KWON, Se Chang, 408-1804 Dogok Rexle Apt.Dogok 2-dongGangnam-gu, Seoul 135-506, Sør-Korea
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vikå, 0125 OSLO, Norge

(54) Title **A CONJUGATE COMPRISING OXYNTOMODULIN AND AN IMMUNOGLOBULIN FRAGMENT, AND USE THEREOF**

(56) References
Cited: WO-A2-2007/100535, WO-A2-2009/069983, WO-A2-2010/107256, WO-A2-2012/011752,
K WYNNE ET AL: "Oxyntomodulin increases energy expenditure in addition to decreasing energy intake in overweight and obese humans: a randomised controlled trial", INTERNATIONAL JOURNAL OF OBESITY, vol. 30, no. 12, 18 April 2006 (2006-04-18), pages 1729-1736, XP055144033, ISSN: 0307-0565, DOI: 10.1038/sj.ijo.0803344, KR-A- 20060 106 486, KR-A- 20100 105 494, KR-A- 20110 039 230, KR-A- 20050 026 685

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

- 5 **1.** Antistoff omfattende et oksyntomodulinderivat omfattende
aminosyresekvensen SEQ ID NO: 24, 25 eller 26, en immunoglobulin Fc-region og
en ikke-peptidylpolymer, hvori ikke-peptidylpolymeren binder kovalent
oksyntomodulinderivatet og immunoglobulin Fc-regionen.
- 10 **2.** Konjugatet ifølge krav 1, hvori oksyntomodulinderivatet omfatter
aminosyresekvensen med SEQ ID NO: 24.
- 15 **3.** Konjugatet ifølge krav 1, hvori aminosyrene i posisjon 12 og 16 eller 16 og 20
i oksyntomodulinderivatet danner en ring.
- 4.** Konjugatet ifølge krav 3, hvori oksyntomodulinderivatet omfatter
aminosyresekvensen med SEQ ID NO: 25.
- 20 **5.** Konjugatet ifølge krav 3, hvori oksyntomodulinderivatet omfatter
aminosyresekvensen med SEQ ID NO: 26.
- 6.** Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori
oksyntomodulinderivatet er i stand til å aktivere GLP-1-reseptoren og
glukagonreseptoren.
- 25 **7.** Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvori konjugatet har
antifedmevirkninger.
- 30 **8.** Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori ikke-
peptidylpolymeren er polyetylglykol, polypropylglykol, en
etylenglykolpropylenglykolkopolymer, en polyoksyetylert polyol, polyvinylalkohol,
et polysakkarid, polyvinyletyleter, polymelkesyre (PLA), polymelke-glykolsyre
(PLGA), en lipidpolymer, hyaluronsyre eller en kombinasjon derav.
- 35 **9.** Konjugatet ifølge krav 8, hvori ikke-peptidylpolymeren er polyetylglykol.
- 10.** Konjugatet ifølge krav 8, hvori polysakkaridet er dekstran, et kitin eller en
kombinasjon derav.

11. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10, hvori én ende av ikke-peptidylpolymeren er bundet til en amingruppe eller en tiolgruppe til immunoglobulin Fc-regionen, og den andre enden av ikke-peptidylpolymeren er bundet til en amingruppe eller en tiolgruppe av oksyntomodulinderivatet.

5

12. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, hvori ikke-peptidylpolymeren har reaktive grupper som er i stand til å bindes sammen med immunoglobulin Fc-regionen og oksyntomodulinderivatet i begge ender.

10

13. Konjugatet ifølge krav 12, hvori den reaktive gruppen er valgt fra en aldehydgruppe, en propionaldehydgruppe, en butyraldehydgruppe, en maleimidgruppe eller et suksinimidderivat.

15

14. Konjugatet ifølge krav 12, hvori de reaktive gruppene i begge ender er de samme som eller forskjellige fra hverandre.

15. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, hvori immunoglobulin Fc-regionen er en ikke-glykosylert Fc-region.

20

16. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 15, hvori immunoglobulin Fc-regionen er et CH1-domene, et CH2-domene, et CH3-domene og et CH4-domene; et CH1-domene og et CH2-domene; et CH1-domene og et CH3-domene; et CH2-domene og et CH3-domene; en kombinasjon av ett eller flere domener og en immunoglobulin-hengselregion eller en del derav; eller en dimer til hvert domene av de konstante regionene i tungkjeden og den konstante regionen i lettkjeden.

25

17. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 16, hvori immunoglobulin Fc-regionen er et derivat i hvilket en region som er i stand til å danne en disulfidbinding, er deletert, visse aminosyrerester er eliminert ved N-terminalenden av en nativ Fc-form, en metioninrest er lagt til ved N-terminalenden av en nativ Fc-form, et komplementbindende sted er deletert eller et sted for antistoffavhengig celledmediert cytotoxiskitet (ADCC) er deletert.

30

35

18. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 17, hvori immunoglobulin Fc-regionen er en Fc-region avledet fra IgG, IgA, IgD, IgE eller IgM.

- 19.** Konjugatet ifølge krav 18, hvori immunoglobulin Fc-regionen er en IgG4 Fc-region.
- 5 **20.** Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 19, hvori immunoglobulin Fc-regionen er en human IgG4-avledet ikke-glykosylert Fc-region.
- 10 **21.** Farmasøytisk sammensetning for forebygging eller behandling av fedme, omfattende konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 20.
- 15 **22.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 21, ytterligere omfattende en farmasøytisk akseptabel bærer.
- 20 **23.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 21 eller 22, hvori sammensetningen administreres alene eller i kombinasjon med andre farmasøytiske formuleringer som har profylaktiske eller terapeutiske virkninger på fedme.
- 25 **24.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 21 til 23, hvori den farmasøytiske formuleringen er en GLP-1-reseptoragonist, en leptinreseptoragonist, en DPP-IV-inhibitor, en Y5-reseptorantagonist, et melaninkonsentrerende hormon- (MCH-) reseptorantagonist, en Y2/3-reseptoragonist, en MC3/4-reseptoragonist, en gastrisk/pankreatisk lipaseinhibitor, en 5HT2c-agonist, en β 3A-reseptoragonist, en amylinreseptoragonist, en grelinantagonist eller en grelinreseptorantagonist.
- 30 **25.** Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 20 eller den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 21 til 24, for anvendelse i forebygging eller behandling av fedme.