



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3155017 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**C07K 19/00 (2006.01)**  
**A61K 38/26 (2006.01)**  
**A61K 47/50 (2017.01)**  
**A61P 31/10 (2006.01)**  
**C07K 14/605 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

(45) Translation Published 2024.04.15

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2024.01.10

(86) European Application Nr. 15798956.7

(86) European Filing Date 2015.05.28

(87) The European Application's Publication Date 2017.04.19

(30) Priority 2014.05.28, US, 201462004156 P

(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 Mederis Diabetes, LLC, 7515 Guinevere Drive, Sugar Land, Texas 77479, USA

(72) Inventor NESTOR, John, J., 725 Lynwood Drive, Encinitas, CA 92024, USA

(74) Agent or Attorney RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

---

(54) Title **IMPROVED PEPTIDE PHARMACEUTICALS FOR INSULIN RESISTANCE**

(56) References Cited:  
WO-A1-2014/081864  
WO-A1-2014/170496  
WO-A1-2016/065090  
WO-A2-2006/121860  
US-B2- 6 864 069  
WO-A2-2012/158965  
US-A1- 2008 200 390  
US-A1- 2015 307 550  
WO-A2-2009/155258

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**

1. Peptidprodukt valgt blant:

- 5 1)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH<sub>2</sub> (SEKV ID NR. 819);
- 10 2)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Asp15-Glu\*16-Lys(N-omega(1-heksadekyl-alfa-D-melibiouroyl))17-Ala18-Ala19-  
Lys\*20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH<sub>2</sub> (SEKV ID NR.  
820);
- 3)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Asp15-Glu\*16-Lys(N-omega(1-oktadekyl-alfa-D-melibiouroyl))17-Ala18-Ala19-Lys\*20-  
Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH<sub>2</sub> (SEKV ID NR. 821);
- 15 4)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Asp15-Glu\*16-Lys(N-omega(1-(13-karboksyl-tridekyloksy)beta-D-glukuronyl))17-Ala18-  
Ala19-Lys\*20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH<sub>2</sub> (SEKV  
ID NR. 1117);
- 20 5)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Asp15-Glu\*16-Lys(N-omega(1-(15-karboksyl-pentadekyloksy)beta-D-glukuronyl))17-  
Ala18-Ala19-Lys\*20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH<sub>2</sub>  
(SEKV ID NR. 1118);
- 25 6)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Asp15-Glu\*16-Lys(N-omega(1-(17-karboksyl-heptadekyloksy)beta-D-glukuronyl))17-  
Ala18-Ala19-Lys\*20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH<sub>2</sub>  
(SEKV ID NR. 1119);
- 7)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Asp15-Glu\*16-Gln17Ala18-Ala19-Lys\*20Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(13-  
karboksyl-tridekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH<sub>2</sub>  
(SEKV ID NR. 1120);
- 30 8)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Asp15-Glu\*16-Gln17-Ala18-Ala19-Lys\*20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(15-  
karboksyl-pentadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH<sub>2</sub>  
(SEKV ID NR. 1121);
- 35 9)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Asp15-Glu\*16-Gln17-Ala18-Ala19-Lys\*20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(17-  
karboksyl-pentadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH<sub>2</sub>  
(SEKV ID NR. 1122);

- 10)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Lys(N-omega(1-(13-karboksyl-tridekyloksy)beta-D-glukuronyl))17-Ala18-  
Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2 (SEKV ID  
NR. 1102, EU-A1865);
- 5 11)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Lys(N-omega(1-(15-karboksyl-pentadekyloksy)beta-D-glukuronyl))17-  
Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1103, EU-A1866);
- 10 12)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Lys(N-omega(1-(17-karboksyl-heptadekyloksy)beta-D-glukuronyl))17-  
Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1104, EU-A1867);
- 15 13)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Gln17-Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(13-  
karboksyl-tridekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1105, EU-A1868);
- 20 14)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Gln17-Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(15-  
karboksyl-pentadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1106, EU-A1869); og
- 25 15)His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Gln17-Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(17-  
karboksyl-heptadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1107, EU-A1870);
- eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette, der rester markert med en asterisk (\*) er  
forbundet slik at de danner et syklisk laktam i sekvensen.

2. Peptidprodukt ifølge krav 1, som er:

His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
30 Asp15-Glu\*16-Lys(N-omega(1-(17-karboksyl-heptadekyloksy)beta-D-glukuronyl))17-  
Ala18-Ala19-Lys\*20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1119), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.

3. Peptidprodukt ifølge krav 1, som er:

35 His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Gln17-Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(15-  
karboksyl-pentadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1106, EU-A1869), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.

4. Peptidprodukt ifølge krav 1, som er:

His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Gln17-Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(17-

5 karboksyl-heptadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1107, EU-A1870), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.

5. Farmasøytisk sammensetning som omfatter et peptidprodukt ifølge krav 1 eller et  
farmasøytisk akseptabelt salt av dette, og minst én farmasøytisk akseptabel bærer eller  
10 ett farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff.

6. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, der peptidproduktet er:

His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-  
Asp15-Glu\*16-Lys(N-omega(1-(17-karboksyl-heptadekyloksy)beta-D-glukuronyl))17-

15 Ala18-Ala19-Lys\*20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1119), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.

7. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, der peptidproduktet er:

His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
20 Asp15-Ser16-Gln17-Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(15-

karboksyl-pentadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1106, EU-A1869), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.

8. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, der peptidproduktet er:

25 His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Gln17-Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(17-

karboksyl-heptadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1107, EU-A1870), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.

30 9. Peptidprodukt til bruk i behandling av insulinresistens, diabetes, metabolsk  
syndrom, fedme eller hjerte- og karsykdom, der peptidproduktet er et peptidprodukt ifølge  
krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.

10. Peptidprodukt til bruk ifølge krav 9, der peptidproduktet er:

35 His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Tyr10-Ser11-Lys12-Tyr13-Leu14-

Asp15-Glu\*16-Lys(N-omega(1-(17-karboksyl-heptadekyloksy)beta-D-glukuronyl))17-  
Ala18-Ala19-Lys\*20-Glu21-Phe22-Ile23-Gln24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2

(SEKV ID NR. 1119), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.

11. Peptidprodukt til bruk ifølge krav 9, der peptidproduktet er:  
His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
Asp15-Ser16-Gln17-Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(15-  
5 karboksyl-pentadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1106, EU-A1869), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.
12. Peptidprodukt til bruk ifølge krav 9, der peptidproduktet er:  
His1-Aib2-Gln3-Gly4-Thr5-Phe6-Thr7-Ser8-Asp9-Glu\*10-Ser11-Lys12-Tyr13-Lys\*14-  
10 Asp15-Ser16-Gln17-Ala18-Ala19-Gln20-Glu21-Phe22-Ile23-Lys(N-omega(1-(17-  
karboksyl-heptadekyloksy)beta-D-glukuronyl))24-Trp25-Leu26-Leu27-Gln28-Thr29-NH2  
(SEKV ID NR. 1107, EU-A1870), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette.
13. Peptidprodukt til bruk ifølge krav 9, der peptidproduktet er forårsaker vekttap.  
15
14. Farmasøytisk sammensetning til bruk i behandling av insulinresistens, diabetes, metabolsk syndrom, fedme eller hjerte- og karsykdom, der sammensetningen omfatter et peptidprodukt ifølge krav 1 og minst én farmasøytisk akseptabel bærer eller ett farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff.