



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3406264 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 45/06 (2006.01) A61P 1/16 (2006.01)

A61K 38/17 (2006.01) A61P 3/04 (2006.01)

A61K 38/26 (2006.01) A61P 3/06 (2006.01)

A61K 47/60 (2017.01) A61P 3/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.05.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.02.16
(86)	European Application Nr.	16881214.7
(86)	European Filing Date	2016.12.28
(87)	The European Application's Publication Date	2018.11.28
(30)	Priority	2015.12.29, CN, 201511017796
(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	Pegbio Co., Ltd., Suite 417 Building A3 Biobay 218 Xinghu Street Industrial Park, Suzhou City, Jiangsu 215123, Kina
(72)	Inventor	XU, Min, 6F, Building B7218 Xinghu Rd., Suzhou Industrial Park 215123, Kina LV, Wei, Suite 417 Building A3 Biobay 218 Xinghu Street Industrial Park, Suzhou City Jiangsu 215123, Kina ZHANG, Yinghui, 6F, Building B7 218 Xinghu Rd., Suzhou Industrial park 215123, Kina LUO, Xiaosu, 6F, Building B7 218 Xinghu Rd., Suzhou Industrial Park 215123, Kina
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	COMPOSITION COMPRISING GLP-1 RECEPTOR AGONIST AND GLUCAGON RECEPTOR AGONIST AND APPLICATION THEREOF
------	-------	--

(56)	References Cited:	CN-A- 103 338 790, CN-A- 104 902 920, WO-A2-2012/177443, EP-A1- 2 423 223, WO-A1-2012/167251, WO-A1-2009/155257, NIAN GONG ET AL: "Site-specific PEGylation of exenatide analogues markedly improved their glucoregulatory activity", BRITISH JOURNAL OF PHARMACOLOGY, vol. 163, no. 2, 1 May 2011 (2011-05-01), pages 399-412, XP55138200, ISSN: 0007-1188, DOI: 10.1111/j.1476- 5381.2011.01227.x PATEL, V. ET AL.: 'Co-Agonist of Glucagon and GLP-1 Reduces Cholesterol and Improves Insulin Sensitivity Independent of its Effect on Appetite and Body Weight in Diet-Induced Obese C57 Mice' CANADIAN JOURNAL PHYSIOL PHARMACOL vol. 91, no. 12, 31 December 2013, pages 1009 - 1015 T. M. TAN ET AL: "Coadministration of Glucagon-Like Peptide-1 During Glucagon Infusion in Humans Results in Increased Energy Expenditure and Amelioration of Hyperglycemia", DIABETES, vol. 62, no. 4, 17 December 2012 (2012-12-17), pages 1131-1138, XP55594768, US ISSN: 0012-1797, DOI: 10.2337/db12-0797
------	----------------------	---

CLEMMENSEN, C. ET AL.: 'GLP-1/Glucagon Coagonism Restores Leptin Responsiveness in Obese Mice Chronically Maintained on an Obesogenic Diet' DIABETES vol. 63, no. 4, 30 April 2014, pages 1422 - 1427, XP055395929

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/>

EP3406264

1

Patentkrav

- 5 **1.** Farmasøytisk sammensetning omfattende en farmasøytisk effektiv mengde av en GLP-1-reseptoragonist og en glukagonreseptoragonist, hver uavhengig konjugert med en hydrofil polymer, hvori
- GLP-1-reseptoragonisten er PB-105, og glukagonreseptoragonisten er valgt fra gruppen bestående av PB-702, PB-703, PB-740 og PB-741, hvori
- PB-105 har en sekvens angitt i SEQ ID NO: 1,
- PB-702 har en sekvens angitt i SEQ ID NO: 3,
- 10 PB-703 har en sekvens angitt i SEQ ID NO: 4,
- PB-740 har en sekvens angitt i SEQ ID NO: 5, og
- PB-741 har en sekvens angitt i SEQ ID NO: 6;
- den hydrofile polymeren er polyetylenglykol (PEG); og
- molforholdet mellom the GLP-1-reseptoragonisten og glukagonreseptoragonisten
- 15 er 1:1 til 1:15.
- 2.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, som ytterligere omfatter en farmasøytisk akseptabel bærer.
- 20 **3.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori polyetylenglykolen har en molekylvekt på 2 kDa til 60 kDa, 5 kDa til 50 kDa, foretrukket 10 kDa til 40 kDa, mer foretrukket 20 kDa til 40 kDa, spesielt 15 kDa til 30 kDa, nærmere bestemt 21 kDa til 29 kDa.
- 25 **4.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1 til 3, omfattende et element valgt fra gruppen bestående av: en kombinasjon av PB-721 og PB-119, en kombinasjon av PB-722 og PB-119 og en kombinasjon av PB-708 og PB-120, hvori:
- PB-721 er mPEG-23KD-ppMAL-PB-740, hvori PB-740 har en aminosyresekvens
- 30 ifølge SEQ ID NO: 5;
- PB-722 er mPEG-23KD-ppMAL-PB-741, hvori PB-741 har en aminosyresekvens ifølge SEQ ID NO: 6;

EP3406264

2

PB-119 er mPEG-23KD-ppMAL-PB-105, hvori PB-105 har en aminosyresekvens ifølge SEQ ID NO: 1;

PB-120 er mPEG-25KD-ppMAL-PB-105, hvori PB-105 har en aminosyresekvens ifølge SEQ ID NO: 1, og

5 PB-708 er mPEG-25KD-ppMAL-PB-703, hvori PB-703 har en aminosyresekvens ifølge SEQ ID NO: 4.

5. Kit omfattende sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4 og eventuelt bruksanvisning.

10

6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, for anvendelse i:

1) forebygging eller behandling av ikke-alkoholisk fettlevversykdom, til vekttap, senking av lipidnivå og/eller senking av blodsukkernivå; eller

15 2) hemming av appetitt hos et individ, senking av total kolesterolnivå i serum og/eller reduksjon av triglyseridinnholdet i leveren.