



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3495380 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 38/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.06.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.03.30
(86)	European Application Nr.	18182274.3
(86)	European Filing Date	2013.12.10
(87)	The European Application's Publication Date	2019.06.12
(30)	Priority	2012.12.11, US, 201261735823 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
	Designated Extension States:	BA ; ME
(62)	Divided application	EP2931745, 2013.12.10
(73)	Proprietor	MedImmune Limited, Milstein Building Granta Park, Cambridge Cambridgeshire CB21 6GH, Storbritannia
(72)	Inventor	AGORAM, Balaji, Milstein Building Granta Park, Cambridge, CB21 6GH, Storbritannia ANTONSSON, Madeleine, c/o AstraZeneca AB, SE-151 85 Södertälje, Sverige BEDNAREK, Maria, A, MedImmune Limited Milstein Building, Granta Park, Cambridge, Cambridgeshire CB21 6GH, Storbritannia BURMEISTER, Nicole, Milstein Building Granta Park, Cambridge, CB21 6GH, Storbritannia BENTHEM, Lambertus, c/o AstraZeneca AB, SE-151 85 Södertälje, Sverige FAIRMAN, David, Milstein Building Granta Park, Cambridge, CB21 6GH, Storbritannia FRITSCH-FREDIN, Maria, c/o AstraZeneca AB, SE-151 85 Södertälje, Sverige JACKSON, Ronald Henry, Milstein Building Granta Park, Cambridge, CB21 6GH, Storbritannia LOFMARK, Rasmus Jansson, c/o AstraZeneca AB, SE-151 85 Södertälje, Sverige METCALFE, Jaqueline, Milstein Building Granta Park, Cambridge, CB21 6GH, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54)	Title	GLUCAGON AND GLP-1 CO-AGONISTS FOR THE TREATMENT OF OBESITY
(56)	References Cited:	WO-A2-2004/022004

DATABASE Geneseq [Online] 5 January 2012 (2012-01-05), "Glucagon analog peptide sequence, SEQ ID 524.", XP002726912, retrieved from EBI accession no. GSP:AZP67221 Database accession no. AZP67221 & WO 2011/143209 A1 (UNIV INDIANA RES & TECH CORP [US]; DIMARCHI RICHARD D [US]; YANG BIN [CN]) 17 November 2011 (2011-11-17) HJORTH S A ET AL: "GLUCAGON AND GLUCAGON-LIKE PEPTIDE 1: SELECTIVE RECEPTOR RECOGNITION VIA DISTINCT PEPTIDE EPITOPES", JOURNAL OF BIOLOGICAL CHEMISTRY, AMERICAN SOCIETY FOR BIOCHEMISTRY AND MOLECULAR BIOLOGY, US, vol. 269, no. 48, 1 January 1994 (1994-01-01), pages 30121-30124, XP000919379, ISSN: 0021-9258

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. Isolert peptid til bruk i en framgangsmåte for å behandle fedme, der peptidet omfatter aminosyresekvensen:

HX2QGTFTSDX10SX12X13LX15X16X17X18AX20X21FX23X24W LX27

5 X28GX30;

der X2 er G eller S, X10 er K, X12 er K, E, R eller S, X13 er K eller Y, X15 er D eller E, X16 er S eller G, X17 er E, R, Q eller K, X18 er R, S eller A, X20 er R, K eller Q, X21 er D eller E, X23 er V eller I, X24 er A eller Q, X27 er E eller V, X28 er A eller K, og X30 er G eller R (SEKV ID NR: 4), der lysinresten ved X10 er modifisert ved å legge til en palmitoyl-

10 gruppering på (N)epsilon-gruppen av lysinresten.

2. Isolert peptid til bruk ifølge krav 1, der palmitoyl-gruppen er bundet til lysinet via en linker.

15 3. Isolert peptid til bruk ifølge krav 2, der linkeren er gammaglutamat.

4. Isolert peptid til bruk ifølge et foregående krav, der peptidet binder seg til en glukagonreseptor, binder seg til en GLP-1-reseptor, eller binder seg til både en glukagon- og en GLP-1-reseptor.

20

5. Isolert peptid til bruk ifølge et av kravene 1 til 4, som binder seg til en glukagonreseptor.

6. Isolert peptid til bruk ifølge et av kravene 1 til 5, der karboksylgruppen X30 er amidert eller er den umodifiserte syren.

25

7. Isolert peptid til bruk ifølge et foregående krav, der det isolerte peptidet binder seg til en human glukagonreseptor med en EC50 i cAMP-assay 1 på mindre enn 10 000 pM, mindre enn 5000 pM, mindre enn 2500 pM, mindre enn 1000 pM, mindre enn 900 pM, mindre enn 800 pM, mindre enn 700 pM, mindre enn 600 pM, mindre enn 500 pM, mindre enn 400 pM, mindre enn 300 pM, mindre enn 200 pM, mindre enn 100 pM, mindre enn 50 pM, mindre enn 25 pM, mindre enn 20 pM, mindre enn 15 pM, mindre enn 10 pM, mindre enn 5 pM, mindre enn 4 pM, mindre enn 3 pM eller mindre enn 2 pM.

30

8. Isolert peptid til bruk ifølge et foregående krav, der det isolerte peptidet binder seg til en GLP-1-reseptor.

35

9. Isolert peptid til bruk ifølge krav 8, der GLP-1-reseptoren er en GLP-1-reseptor hos mus eller en human GLP-1-reseptor.

10. Isolert peptid til bruk ifølge krav 8 eller 9, som binder seg til en human GLP-1-reseptor med en EC50 i cAMP-assay 1 på mindre enn 10 000 pM, mindre enn 5000 pM, mindre enn 2500 pM, mindre enn 1000 pM, mindre enn 900 pM, mindre enn 800 pM, mindre enn 700 pM, mindre enn 600 pM, mindre enn 500 pM, mindre enn 400 pM, mindre enn 300 pM, mindre enn 200 pM, mindre enn 100 pM, mindre enn 50 pM, mindre enn 25 pM, mindre enn 20 pM, mindre enn 15 pM, mindre enn 10 pM, mindre enn 5 pM, mindre enn 4 pM, mindre enn 3 pM eller mindre enn 2 pM.

11. Isolert peptid til bruk ifølge et foregående krav, der det isolerte peptidet er en agonist til GLP-1-aktivitet, en agonist til glukagonaktivitet, eller en agonist til både GLP-1- og glukagonaktivitet.

12. Isolert peptid til bruk ifølge et foregående krav, der det isolerte peptidet binder seg til både en glukagonreseptor og en GLP-1-reseptor, der peptidet oppviser minst om lag 2 ganger, 5 ganger eller 10 ganger større aktivitet i forhold til den naturlige liganden ved GLP-1-reseptoren enn ved glukagonreseptoren.

13. Isolert peptid til bruk ifølge et foregående krav, som ytterligere omfatter en heterolog gruppering som er assosiert med peptidet, eventuelt der den heterologe grupperingen er et protein, et peptid, et proteindomene, en linker, en organisk polymer, en uorganisk polymer, en polyetylenglykol (PEG), biotin, et albumin, et humant serumalbumin (HSA), en HSA-FcRn-bindingsdel, et antistoff, et domene av et antistoff, et antistofffragment, et enkeltkjedet antistoff, et domeneantistoff, et albuminbindingsdomene, et enzym, en ligand, en reseptor, et bindingspeptid, et ikke-FnIII-skjelett, en epitop-tag, en rekombinant polypeptidpolymer, et cytokin, eller en kombinasjon av to eller flere av de nevnte grupperingene.