



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3518961 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 38/29 (2006.01)

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 47/34 (2006.01)

A61P 5/18 (2006.01)

A61P 5/20 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.06.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.02.22
(86)	European Application Nr.	17781427.4
(86)	European Filing Date	2017.09.28
(87)	The European Application's Publication Date	2019.08.07
(30)	Priority	2016.09.29, EP, 16191454 2017.02.13, EP, 17155846
(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 Validation States:	MA
(73)	Proprietor	Ascendis Pharma Bone Diseases A/S, Tuborg Boulevard 12, 2900 Hellerup, Danmark
(72)	Inventor	SPROGØE, Kennett, 2900 Hellerup, Danmark HOLTEN-ANDERSEN, Lars, 2900 Hellerup, Danmark KARPF, David Brian, Palo Alto California 94304, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	PTH COMPOUNDS WITH LOW PEAK-TO-TROUGH RATIOS
------	-------	---

(56)	References
------	------------

Cited:	WO-A1-2011/012719 WO-A1-2016/020373 WO-A1-2011/089214 WO-A1-2011/089216 WO-A1-2013/024051 WO-A1-2013/053856 WO-A1-2014/056923 WO-A1-2014/086961 WO-A1-2015/052155 WO-A1-2016/110577 WO-A1-2011/012721 WO-A1-2011/042450 WO-A1-2011/089215 WO-A1-2013/024049 WO-A1-2013/024053 WO-A1-2014/056915 WO-A1-2014/056926 WO-A1-2014/173759 WO-A1-2011/012723
--------	---

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/>

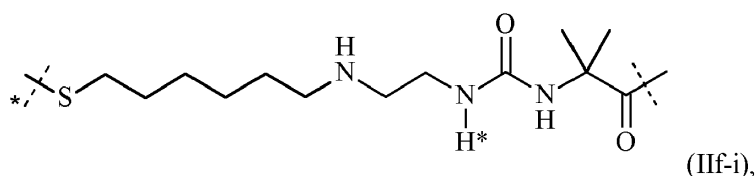
EP 3518961

1

Patentkrav

1. En farmasøytisk sammensetning som omfatter en PTH-forbindelse, hvor etter subkutan administrering til en ikke-human primat viser den farmakokinetiske profilen av PTH-forbindelsen et topp-til-bunn-forhold på mindre enn 4 i plasma innen ett injeksjonsintervall ved stabil tilstand, hvor tidsperioden mellom to påfølgende administreringer er 24 timer og

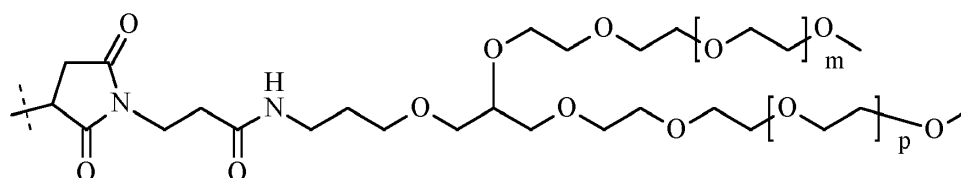
hvor PTH-forbindelsen har formel (IIf-i):



hvor

den umarkerte stiplede linjen indikerer bindingen til et nitrogen av -D som er en PTH-del ved å danne en amidbinding; og

den stiplede linjen markert med stjernen indikerer binding til en del



hvor

m og p er uavhengig et heltall som strekker seg fra og som inkluderer 400 til 500.

2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvor -D har sekvensen til SEKV ID NR:1, SEKV ID NR:2, SEKV ID NR:3, SEKV ID NR:4, SEKV ID NR:5, SEKV ID NR:6, SEKV ID NR:7, SEKV ID NR:8, SEKV ID NR:9, SEKV ID NR:10, SEKV ID NR:11, SEKV ID NR:12, SEKV ID NR:13, SEKV ID NR:14, SEKV ID NR:15, SEKV ID NR:16, SEKV ID NR:17, SEKV ID NR:18, SEKV ID NR:19, SEKV ID NR:20, SEKV ID NR:21, SEKV ID NR:22, SEKV ID NR:23, SEKV ID NR:24, SEKV ID NR:25,

EP 3518961

2

SEKV ID NR:26, SEKV ID NR:27, SEKV ID NR:28, SEKV ID NR:29, SEKV ID NR:30,
 SEKV ID NR:31, SEKV ID NR:32, SEKV ID NR:33, SEKV ID NR:34, SEKV ID NR:35,
 SEKV ID NR:36, SEKV ID NR:37, SEKV ID NR:38, SEKV ID NR:39, SEKV ID NR:40,
 SEKV ID NR:41, SEKV ID NR:42, SEKV ID NR:43, SEKV ID NR:44, SEKV ID NR:45,
 5 SEKV ID NR:46, SEKV ID NR:47, SEKV ID NR:48, SEKV ID NR:49, SEKV ID NR:50,
 SEKV ID NR:51, SEKV ID NR:52, SEKV ID NR:53, SEKV ID NR:54, SEKV ID NR:55,
 SEKV ID NR:56, SEKV ID NR:57, SEKV ID NR:58, SEKV ID NR:59, SEKV ID NR:60,
 SEKV ID NR:61, SEKV ID NR:62, SEKV ID NR:63, SEKV ID NR:64, SEKV ID NR:65,
 10 SEKV ID NR:66, SEKV ID NR:67, SEKV ID NR:68, SEKV ID NR:69, SEKV ID NR:70,
 SEKV ID NR:71, SEKV ID NR:72, SEKV ID NR:73, SEKV ID NR:74, SEKV ID NR:75,
 SEKV ID NR:76, SEKV ID NR:77, SEKV ID NR:78, SEKV ID NR:79, SEKV ID NR:80,
 SEKV ID NR:81, SEKV ID NR:82, SEKV ID NR:83, SEKV ID NR:84, SEKV ID NR:85,
 SEKV ID NR:86, SEKV ID NR:87, SEKV ID NR:88, SEKV ID NR:89, SEKV ID NR:90,
 SEKV ID NR:91, SEKV ID NR:92, SEKV ID NR:93, SEKV ID NR:94, SEKV ID NR:95,
 15 SEKV ID NR:96, SEKV ID NR:97, SEKV ID NR:98, SEKV ID NR:99, SEKV ID
 NR:100, SEKV ID NR:101, SEKV ID NR:102, SEKV ID NR:103, SEKV ID NR:104,
 SEKV ID NR:105, SEKV ID NR:106, SEKV ID NR:107, SEKV ID NR:108, SEKV ID
 NR:109, SEKV ID NR:110, SEKV ID NR:111, SEKV ID NR:112, SEKV ID NR:113,
 SEKV ID NR:114, SEKV ID NR:115, SEKV ID NR:116, SEKV ID NR:117, SEKV ID
 20 NR:118, SEKV ID NR:119, SEKV ID NR:120 eller SEKV ID NR:121.

3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvor -D har
 sekvensen til SEKV ID NR:47, SEKV ID NR:48, SEKV ID NR:49, SEKV ID NR:50,
 SEKV ID NR:51, SEKV ID NR:52, SEKV ID NR:53, SEKV ID NR:54, SEKV ID NR:55,
 25 SEKV ID NR:107, SEKV ID NR:108, SEKV ID NR:109, SEKV ID NR:110, SEKV ID
 NR:111, SEKV ID NR:112, SEKV ID NR:113, SEKV ID NR:114 eller SEKV ID
 NR:115.

4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene
 30 1 til 3, hvor -D har sekvensen til SEKV ID NR:51.

5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene
 1 til 4, hvor -D er festet til PTH-forbindelsen med formel (IIf-i) gjennom den N-
 terminale aminfunksjonelle gruppen til PTH-delen.

EP 3518961

3

- 6.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvor den subkutane administreringen er via subkutan injeksjon.
- 5 **7.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvor den subkutane administreringen skjer med en pennanordning.
- 8.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor topp-til-bunn-forholdet er mindre enn 3.
- 10 **9.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvor topp-til-bunn-forholdet er mindre enn 2,6.
- 10.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 15 1 til 9, hvor topp-til-bunn-forholdet er mindre enn 2,4.
- 11.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10, hvor topp-til-bunn-forholdet er mindre enn 2,2.
- 20 **12.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, hvor topp-til-bunn-forholdet er mindre enn 2.
- 13.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 12, hvor den ikke-humane primaten er en krabbemakak.
- 25 **14.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, hvor den farmasøytiske sammensetningen har en pH som strekker seg fra og som inkluderer pH 3 til pH 8.
- 30 **15.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, hvor den farmasøytiske sammensetningen har en pH som strekker seg fra og som inkluderer pH 4 til pH 5.