



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20100543 T1

HR P20100543 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

A61K 47/48 (2006.01)
C07K 14/605 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 30.11.2010.

(21) Broj predmeta: P20100543T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 05.10.2010.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2006018284
Datum podnošenja međunarodne prijave: 11.05.2006.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 06759598.3
Datum podnošenja europske prijave patenta: 11.05.2006.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2006124529
Datum međunarodne objave: 23.11.2006.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1881850 A1
Datum objave europske prijave patenta: 30.01.2008.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1881850 B1
Datum objave europskog patenta: 29.09.2010.

(31) Broj prve prijave: 680688 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 13.05.2005.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**ELI LILLY AND COMPANY, Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN
46285, US**

(72) Izumitelji:

Lianshan Zhang, 13244 Snow Owl Drive, Carmel, IN 46033, US
Andrew Mark Vick, 10736 Gateway Drive, Fishers, IN 46037, US
**Rohn Lee Junior Millican, 8145 Grassy Meadow Court, Indianapolis, IN
46259, US**
**John Philip Mayer, 5839 North Washington Boulevard, Indianapolis, IN
46220, US**

(74) Zastupnik:

Wolfgang Glaesner, 3808 Carwinion Way, Carmel, IN 46032, US
Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **GLP-1 PEGILIRANI SPOJEVI**

HR P20100543 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Di-PEGilirani GLP-1 spoj s aminokiselinskim slijedom formule:

**His-Xaa₈-Glu-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Val-Ser-Ser-Tyr-Leu-Glu-Xaa₂₂-Gln-
Ala-Ala-Lys-Glu-Phe-Ile-Ala-Trp-Leu-Xaa₃₃-Lys-Gly-Gly-Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-
Pro-Pro-Pro-Cys₄₅- Xaa₄₆ Formula I (SEQ ID NO: 1)**

naznačen time što

10 Xaa₈ je: D-Ala, Gly, Val, Leu, Ile, Ser ili Thr;

Xaa₂₂ je: Gly, Glu, Asp ili Lys;

15 Xaa₃₃ je: Val ili Ile;

Xaa₄₆ je: Cys ili Cys-NH₂;

te gdje jedna molekula PEG je kovalentno vezana na Cys₄₅, a jedna molekula PEG je kovalentno vezana na Cys₄₆ ili Cys₄₆-NH₂.

- 20 2. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što Xaa₈ je Gly ili Val, a Xaa₂₂ je Gly ili Glu.
3. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili zahtjevom 2, **naznačen time** što Xaa₈ je Val, a Xaa₂₂ je Glu.
- 25 4. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** što Xaa₈ je Val, Xaa₂₂ je Glu, Xaa₃₃ je Ile, i Xaa₄₆ je Cys-NH₂.
5. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što molekule PEG imaju molekulsku težinu između 5.000 i 40.000 Da.
6. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što molekule PEG imaju molekulsku težinu između 20.000 i 60.000 Da.
- 30 7. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što molekule PEG imaju molekulsku težinu između 20.000 i 40.000 Da.
8. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što svaka od molekula PEG upotrijebljena u reakciji PEGilacije je 20.000 Da velika nerazgranati metoksi-PEG-maleimid.
9. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što molekule PEG su vezane istodobno.
- 35 10. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što spojnicu koju čine PEGilacijska mjesta Cys₄₅ i Cys₄₆ ili Cys₄₆-NH₂ je vezana na C-kraj GLP-1 spoja.
11. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 10, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi kao medikament.
- 40 12. Di-PEGilirani GLP-1 spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 10, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju dijabetesa neovisnog o inzulinu ili pretilosti.
13. Upotreba di-PEGiliranog GLP-1 spoja u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 10, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje dijabetesa neovisnog o inzulinu ili pretilosti.