

## (12) BREVET D'INVENTION

(11) N° de publication : **MA 58093 B1** (51) Cl. internationale : **C07K 14/62; A61K 38/28**

(43) Date de publication :  
**30.09.2024**

---

(21) N° Dépôt :  
**58093**

(22) Date de Dépôt :  
**10.12.2020**

(30) Données de Priorité :  
**11.12.2019 EP 19215315**

(86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT:  
**PCT/EP2020/085541 10.12.2020**

(71) Demandeur(s) :  
**Novo Nordisk A/S, Novo Allé 2880 Bagsværd (DK)**

(72) Inventeur(s) :  
**MADSEN, Peter ; KJELDTSEN, Thomas, Børglum ; NORRMAN, Mathias ; STURIS, Jeppe ; OLSEN, Helle, Birk ; HUBALEK, Frantisek**

(74) Mandataire :  
**H&H IP LAW**

(86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation :20820432.1

---

(54) Titre : **NOUVEAUX ANALOGUES D'INSULINE ET LEURS UTILISATIONS**

(57) Abrégé : La présente invention s'inscrit dans le domaine thérapeutique des médicaments pour traiter des états médicaux associés au diabète. Plus spécifiquement, l'invention concerne des analogues d'insuline de l'insuline humaine. L'invention concerne des compositions pharmaceutiques comprenant de tels analogues d'insuline et les utilisations de tels analogues pour le traitement ou la prévention d'états médicaux associés au diabète.

**NOUVEAUX ANALOGUES DE L'INSULINE ET LEURS UTILISATIONS****REVENDICATIONS**

1. Analogue d'insuline, dans lequel l'analogue comprend A9E ou A9D et comprend en outre B3E et/ou desB30 par rapport a l'insuline humaine.

2. Analogue d'insuline selon la revendication 1, dans lequel l'analogue comprend en outre au moins l'un parmi B26E, B27E etjou B28E.

3. Analogue d'insuline selon la revendication 2, lequel l'analogue comprend en supplement la substitution A21A.

4. Analogue d'insuline l'une quelconque des revendications precedentes, dans lequel l'analogue est

A9D, B3E;

A9E, B3E;

A9D, desB30 ;

A9E, desB30 ;

A9D, B3E, desB30 ;

A9E, B3E, desB30 ;

A9D, B3E, B26E ;

A9E, B3E, B26E ;

A9D, B26E, desB30 ;

A9E, B26E, desB30 ;

A9D, B3E, B26E, desB30 ;

A9E, B3E, B26E, desB30 ;

A9D, A21A, B3E, B26E ;

A9E,A21A, B3E, B26E;

**PCT/EP2020/085541****EP4073097/ 20820432.1**

A9D, A21A, B26E, desB30 ;  
A9E, A21A, B26E, desB30 ;  
A9D, A21A, B3E, B26E, desB30 ;  
A9E, A21A, B3E, B26E, desB30 ;  
A9D, B3E, B27E ;  
A9E, B3E, B27E ;  
A9D, B27E, desB30 ;  
A9E, B27E, desB30 ;  
A9D, B3E, B27E, desB30 ;  
A9E, B3E, B27E, desB30 ;  
A9D, A21A, B3E, B27E ;  
A9E, A21A, B3E, B27E ;  
A9D, A21A, B27E, desB30 ;  
A9E, A21A, B27E, desB30 ;  
A9D, A21A, B3E, B27E, desB30 ;  
A9E, A21A, B3E, B27E, desB30 ;  
A9D, B3E, B28E ;  
A9E, B3E, B28E ;  
A9D, B28E, desB30 ;  
A9E, B28E, desB30 ;  
A9D, B3E, B28E, desB30 ;  
A9E, B3E, B28E, desB30 ;  
A9D, A21A, B3E, B28E ;  
A9E, A21A, B3E, B28E ;  
A9D, A21A, B28E, desB30 ;  
A9E, A21A, B28E, desB30 ;  
A9D, A21A, B3E, B28E, desB30 ;

**PCT/EP2020/085541****EP4073097/ 20820432.1**

A9E, A21A, B3E, B28E, desB30 ;  
A9D, B3E, B26E, B27E;  
A9E, B3E, B26E, B27E ;  
A9D, B26E, B27E, desB30 ;  
A9E, B26E, B27E, desB30 ;  
A9D, B3E, B26E, B27E, desB30 ;  
A9E, B3E, B26E, B27E, desB30 ;  
A9D,A21A, B3E, B26E, B27E;  
A9E,A21A, B3E, B26E, B27E;  
A9D, A21A, B26E, B27E, desB30 ;  
A9E, A21A, B26E, B27E, desB30 ;  
A9D, A21A, B3E, B26E, B27E, desB30 ;  
A9E, A21A, B3E, B26E, B27E, desB30 ;  
A9D, B3E, B27E, B28E;  
A9E, B3E, B27E, B28E ;  
A9D, B27E, B28E, desB30 ;  
A9E, B27E, B28E, desB30 ;  
A9D, B3E, B27E, B28E, desB30 ;  
A9E, B3E, B27E, B28E, desB30 ;  
A9D, A21A, B3E, B27E, B28E ;  
A9E,A21A, B3E, B27E, B28E;  
A9D, A21A, B27E, B28E, desB30 ;  
A9E, A21A, B27E, B28E, desB30 ;  
A9D, A21A, B3E, B27E, B28E, desB30 ;  
A9E, A21A, B3E, B27E, B28E, desB30 ;  
A9D, B3E, B26E, B28E;  
A9E, B3E, B26E, B28E ;

PCT/EP2020/085541

EP4073097/ 20820432.1

A9D, B26E, B28E, desB30 ;

A9E, B26E, B28E, desB30 ;

A9D, B3E, B26E, B28E, desB30 ;

A9E, B3E, B26E, B28E, desB30 ;

A9D, A21A, B3E, B26E, B28E;

A9E, A21A, B3E, B26E, B28E;

A9D, A21A, B26E, B28E, desB30 ;

A9E, A21A, B26E, B28E, desB30 ;

A9D, A21A, B3E, B26E, B28E, desB30 ;

A9E, A21A, B3E, B26E, B28E, desB30 ;

A9D, B3E, B26E, B27E, B28E ;

A9E, B3E, B26E, B27E, B28E ;

A9D, B26E, B27E, B28E, desB30 ;

A9E, B26E, B27E, B28E, desB30 ;

A9D, B3E, B26E, B27E, B28E, desB30 ;

A9E, B3E, B26E, B27E, B28E, desB30 ;

A9D, A21A, B3E, B26E, B27E, B28E ;

A9E, A21A, B3E, B26E, B27E, B28E ;

A9D, A21A, B26E, B27E, B28E, desB30 ;

A9E, A21A, B26E, B27E, B28E, desB30 ;

A9D, A21A, B3E, B26E, B27E, B28E, desB30 ; OU

A9E, A21A, B3E, B26E, B27E, B28E, desB30.

5. Analogue d'insuline selon la revendication 4, dans lequel analogue est

A9E, B3E, B26E ;

A9E, B3E, B27E, B28E ;

A9E, B3E, B26E, desB30 ;

PCT/EP2020/085541

EP4073097/ 20820432.1

A9E, B3E, B27E, B28E, desB30 ;

A9D, B3E, B26E, desB30 ; OU

A9E,A21A, B3E, B26E, desB30.

6. Analogue d'insuline selon la revendication 5, dans lequel l'analogue est A9E, B3E, B26E, desB30.

7. Analogue d'insuline selon la revendication 5, dans lequel l'analogue est A9E, B3E, B27E, B28E, desB30.

8. Composition pharmaceutique comprenant un analogue d'insuline selon l'une quelconque des revendications 1 a 7, et un ou plusieurs excipients pharmaceutiquement acceptables.

9. Composition pharmaceutique selon la revendication 8, dans laquelle l'analogue d'insuline est a une concentration de 0,6 mM a 3 mM.

10. Composition pharmaceutique selon l'une quelconque des revendications 8 et 9, dans laquelle la composition est exempte de zinc.

11. Composition pharmaceutique selon l'une quelconque des revendications 8 a 10, comprenant un compose nicotinique, et en particulier de la nicotinamide.

12. Composition pharmaceutique selon l'une quelconque des revendications 8 a 10, 15 dans laquelle la composition est exempte d'un compose nicotinique, et en particulier de la nicotinamide.

13. Analogue d'insuline selon l'une quelconque des revendications 1 a 7, dans lequel l'analogue d'insuline est monomere dans une composition pharmaceutique exempte de zinc.

**PCT/EP2020/085541****EP4073097/ 20820432.1**

14. Analogue d'insuline selon l'une quelconque des revendications 1 à 7, dans lequel l'analogue d'insuline est chimiquement et/ou physiquement stable dans une composition pharmaceutique exempte de zinc.

15. Analogue d'insuline selon l'une quelconque des revendications 1 à 7 ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci ou composition pharmaceutique selon l'une quelconque des revendications 8 à 12, pour une utilisation en tant que médicament.