

(12) BREVET D'INVENTION

(11) N° de publication : **MA 59093 B1** (51) Cl. internationale : **C07K 14/605; A61K 38/26**

(43) Date de publication :
31.05.2024

(21) N° Dépôt :
59093

(22) Date de Dépôt :
05.04.2019

(30) Données de Priorité :
05.04.2018 IN 201821013109

(71) Demandeur(s) :
Sun Pharmaceutical Industries Limited, Sun House Plot No. 201 B/1 Western Express Highway Goregaon (E) Mumbai, Maharashtra 400 063 (IN)

(72) Inventeur(s) :
THENNATI, Rajamannar ; CHATURVEDI, Nishith ; BURADE, Vinod Sampatrao ; SHAHI, Pradeep Dinesh ; NATARAJAN, Muthukumaran ; NAGARAJA, Ravishankara Madavati ; ZALAWADIA, Rishit Mansukhlal ; PANDYA, Kunal ; PATEL, Brijeshkumar ; JOSHI, Dhiren Rameshchandra ; SONI, Krunal Harishbhai ; TIWARI, Abhishek ; PATEL, Vipulkumar Shankarbai

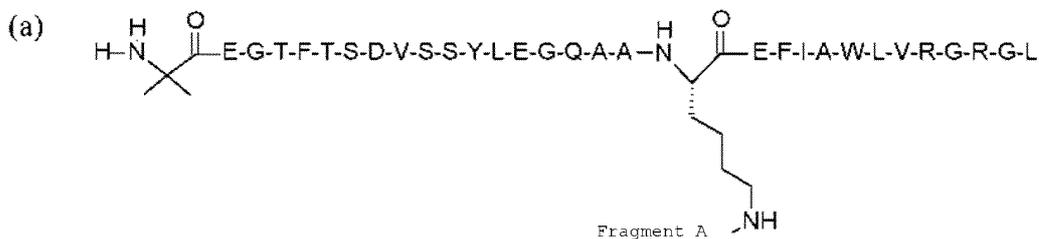
(74) Mandataire :
MOROCCO INTELLECTUAL PROPERTY SERVICES

(54) Titre : **NOUVEAUX ANALOGUES DE GLP-1**

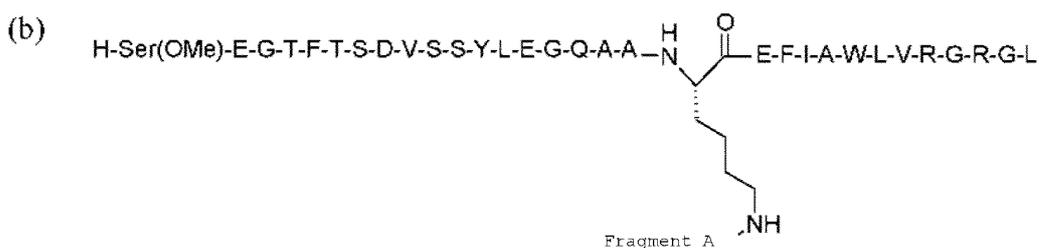
(57) Abrégé : La présente invention concerne de nouveaux analogues du Glucagon like Peptide-1 (GLP-1) (7-37) ayant une séquence d'acides aminés avec Leu ou Ile au niveau C-terminal. Les nouveaux analogues sont de puissants agonistes du GLP-1 avec des effets indésirables réduits et une durée d'action améliorée. La présente invention concerne en outre des dérivés acylés des nouveaux analogues qui ont une puissance et une durée d'action encore améliorées et sont adaptés à une administration orale. Les analogues de la présente invention peuvent être utiles dans le traitement du diabète et de l'obésité.

REVENDEICATIONS

Revendication 1. Polypeptide comprenant la séquence d'acides aminés :

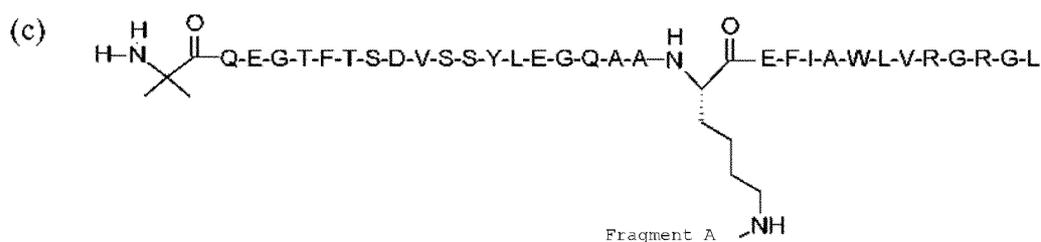


; ou

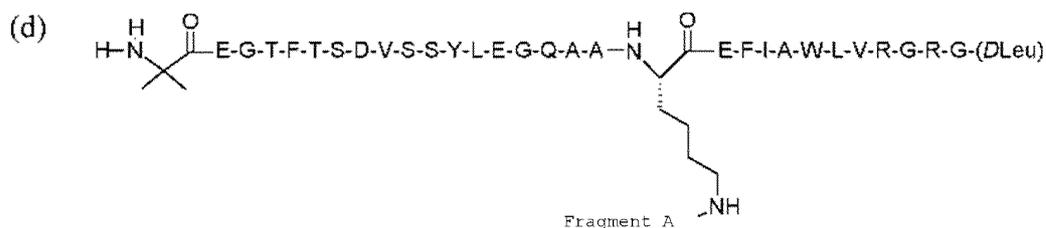


5

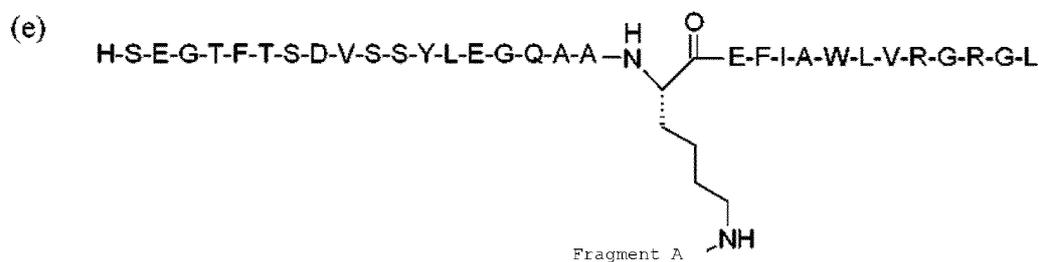
; ou



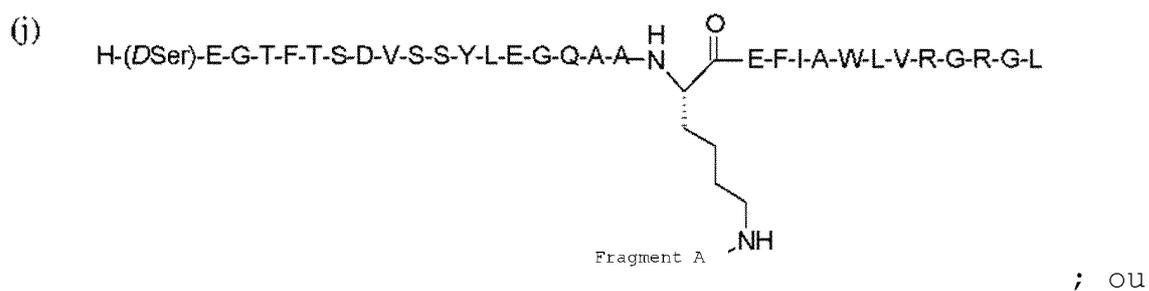
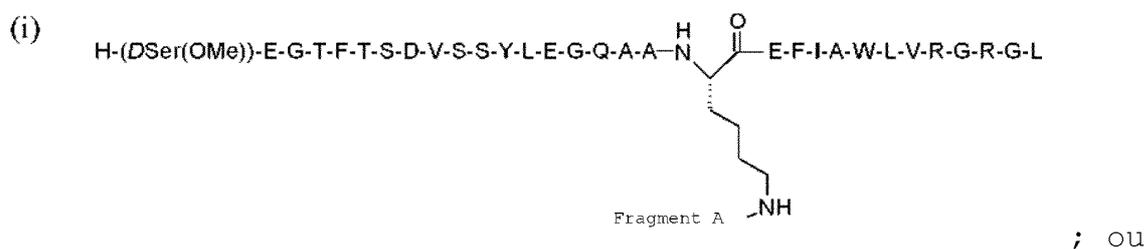
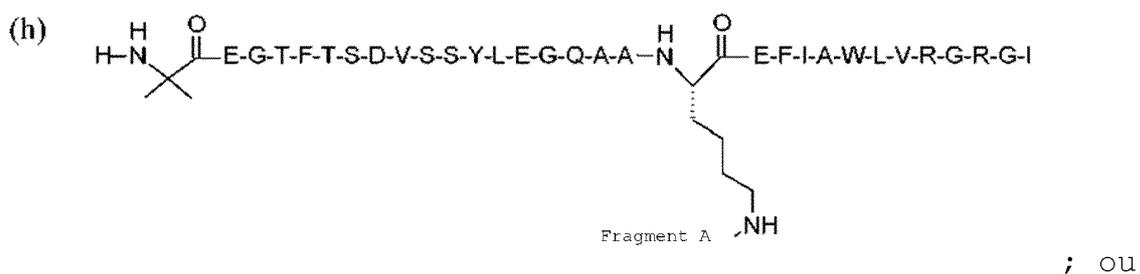
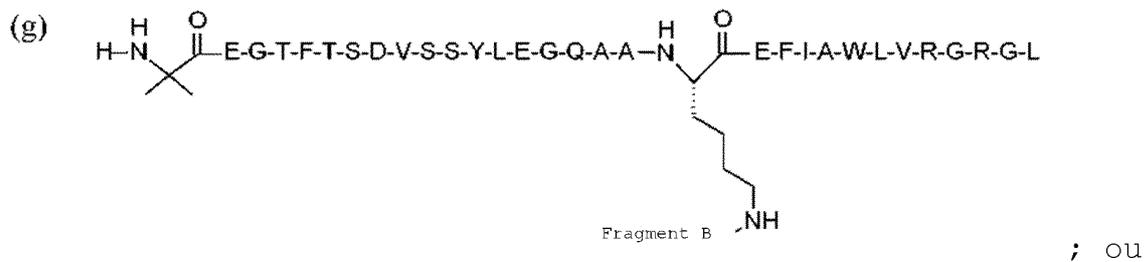
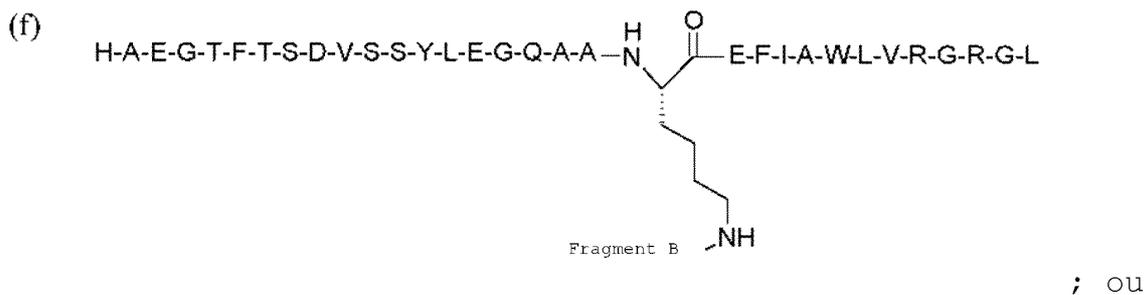
; ou



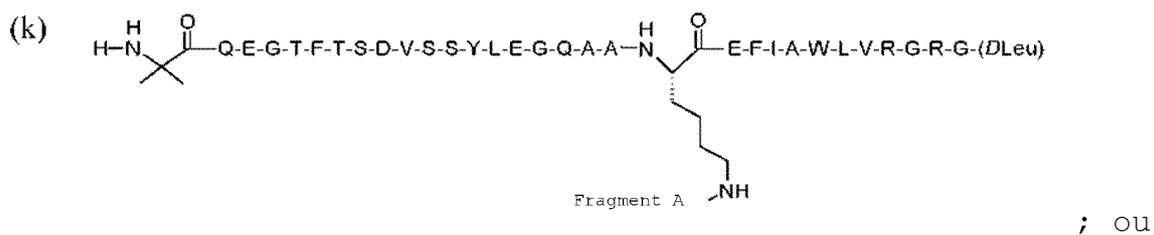
; ou

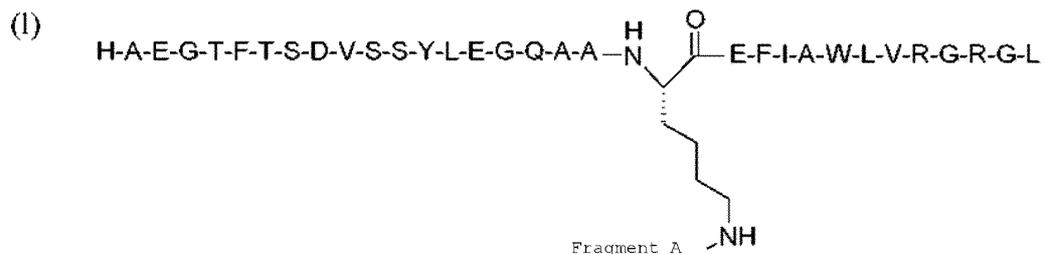


; ou

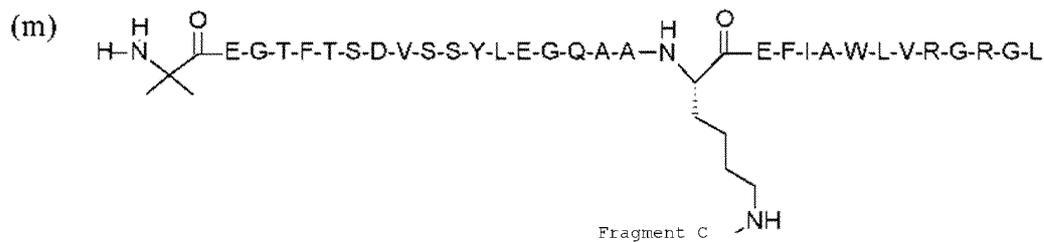


5

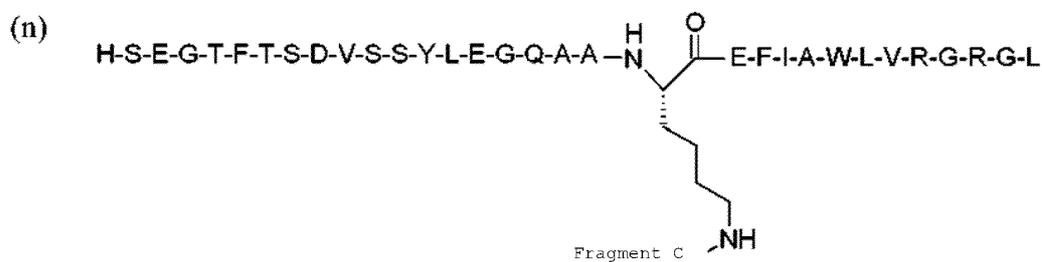




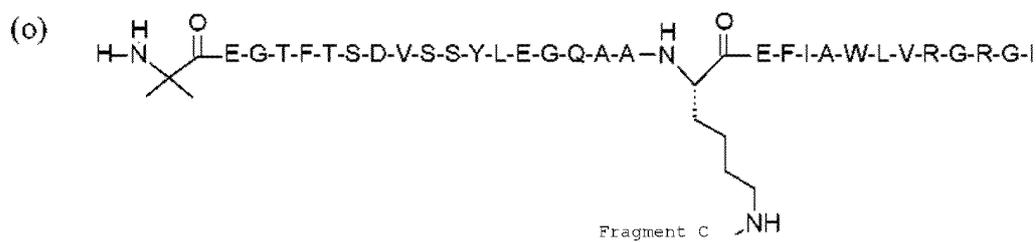
; ou



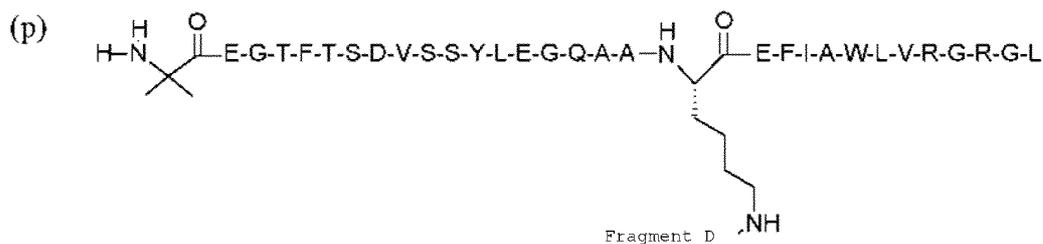
; ou



; ou

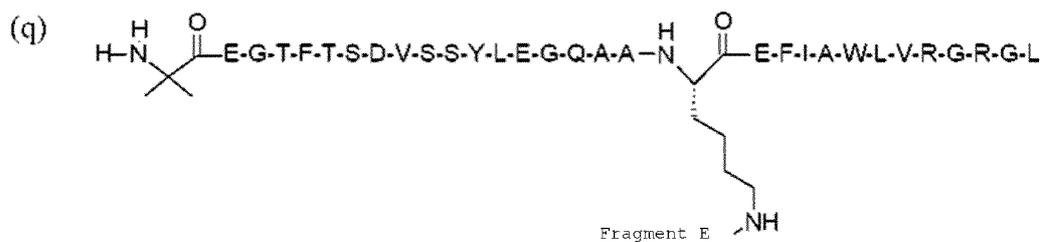


; ou

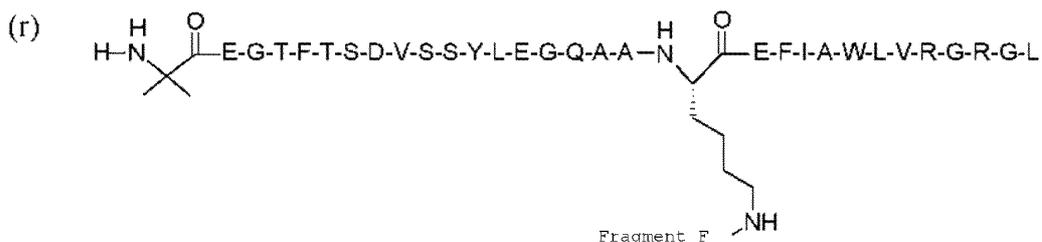


; ou

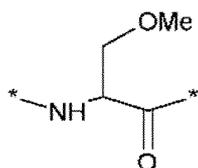
5



; ou

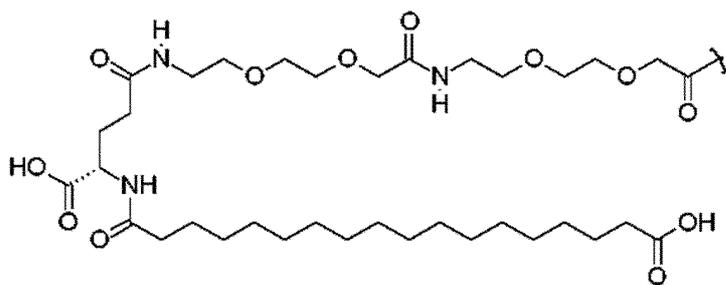


dans lequel *DSer* est un résidu sérine ayant une configuration D
 et *DLeu* est un résidu leucine ayant une configuration D ;
 dans lequel Ser(OMe) est un résidu sérine ayant la structure :

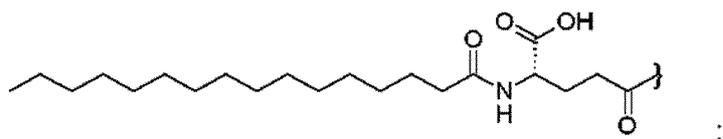


5

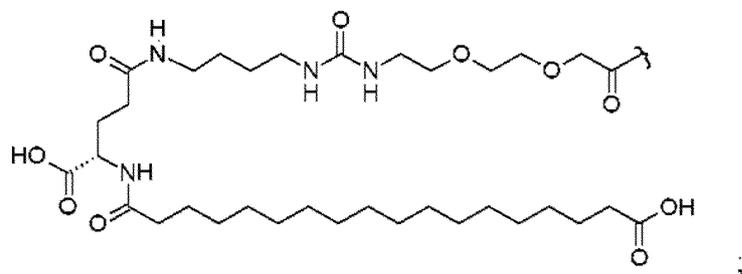
dans lequel le fragment A a la structure :



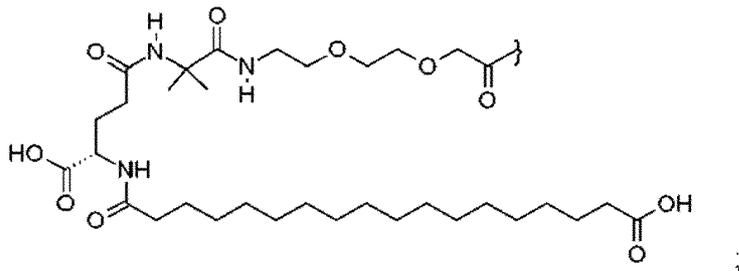
dans lequel le fragment B a la structure :



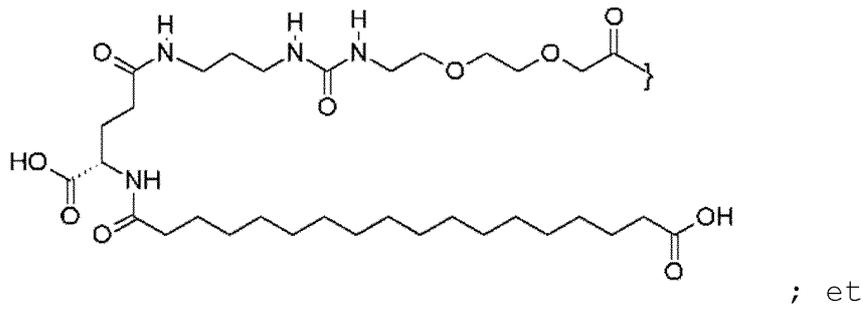
10 dans lequel le fragment C a la structure :



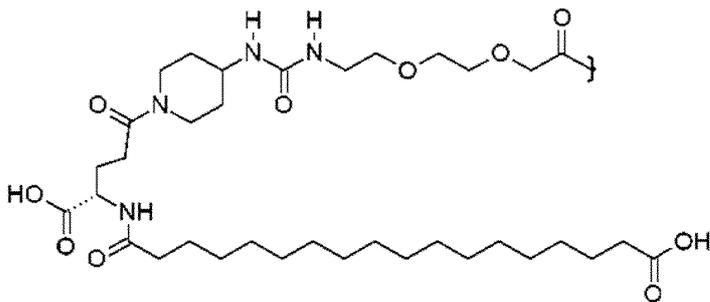
dans lequel le fragment D a la structure :



dans lequel le fragment E a la structure :

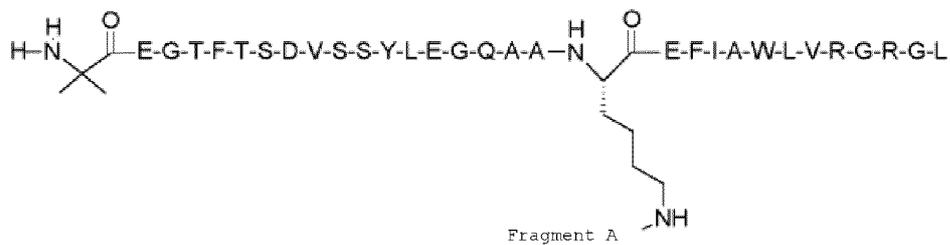


dans lequel le fragment F a la structure :



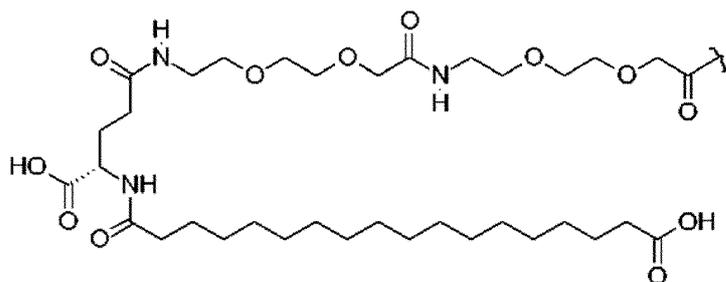
5

Revendication 2. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :

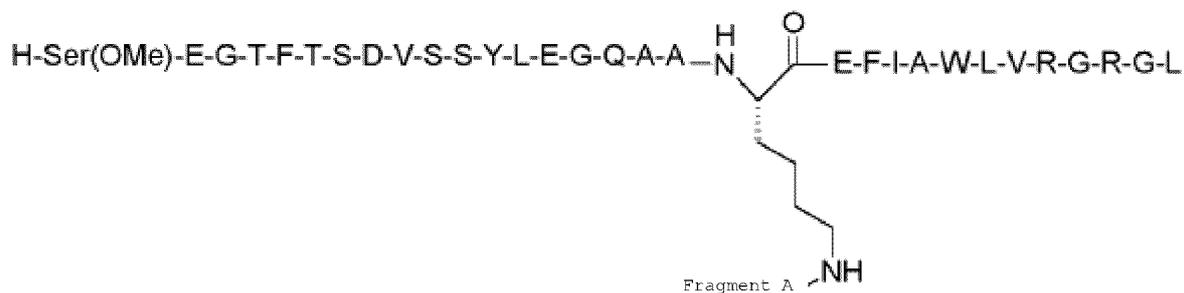


Fragment A

10 dans lequel le fragment A a la structure :

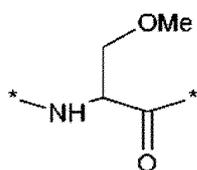


Revendication 3. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :



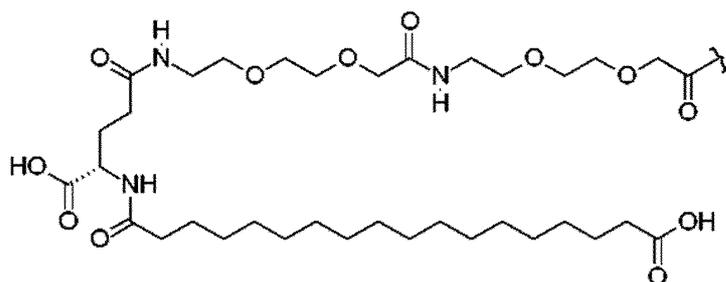
5

dans lequel Ser(OMe) est un résidu sérine ayant la structure :



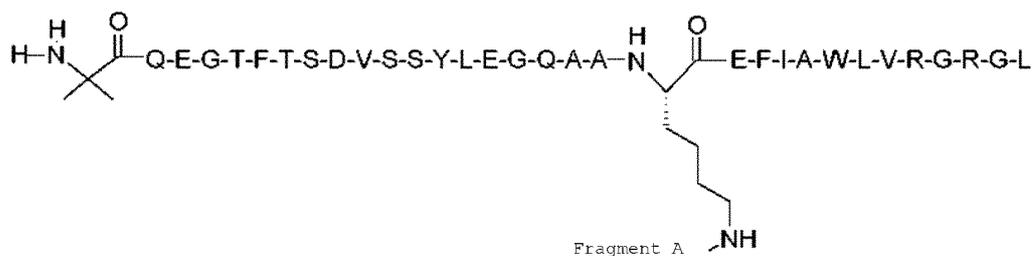
; et

dans lequel le fragment A a la structure :

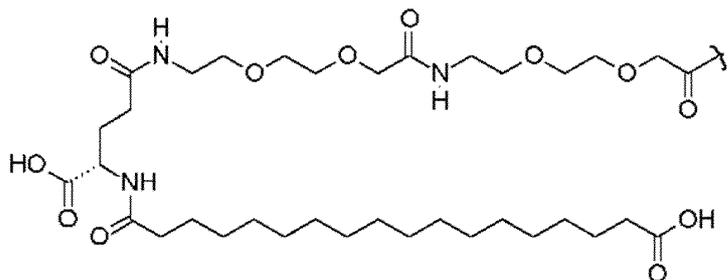


10

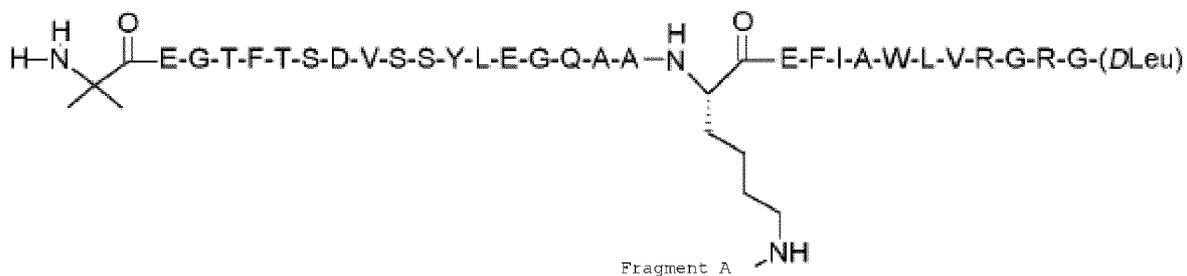
Revendication 4. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :



dans lequel le fragment A a la structure :

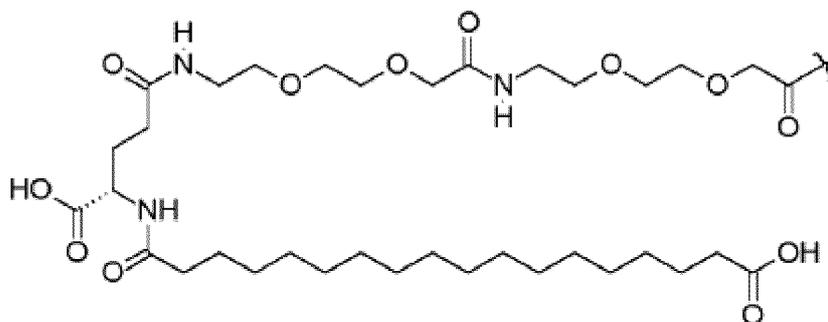


5 Revendication 5. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :

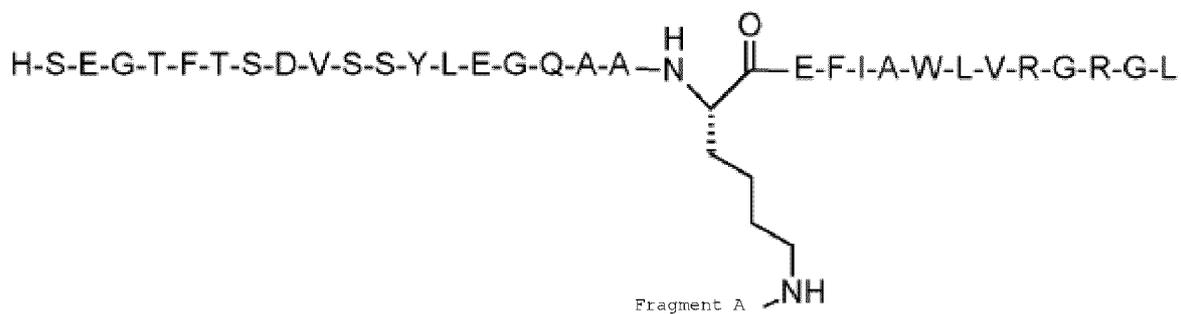


dans lequel *D*Leu est un résidu leucine ayant une configuration D ; et

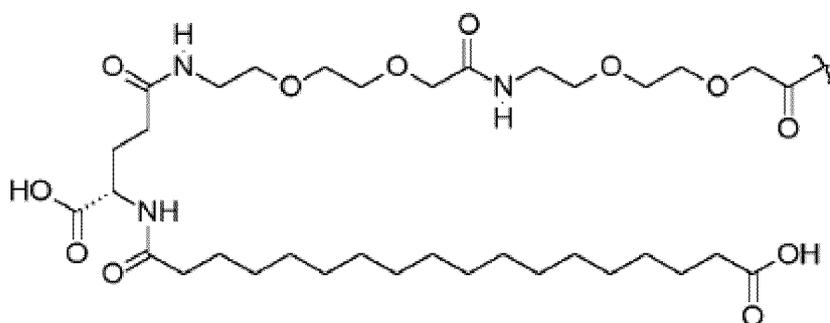
10 dans lequel le fragment A a la structure :



Revendication 6. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :

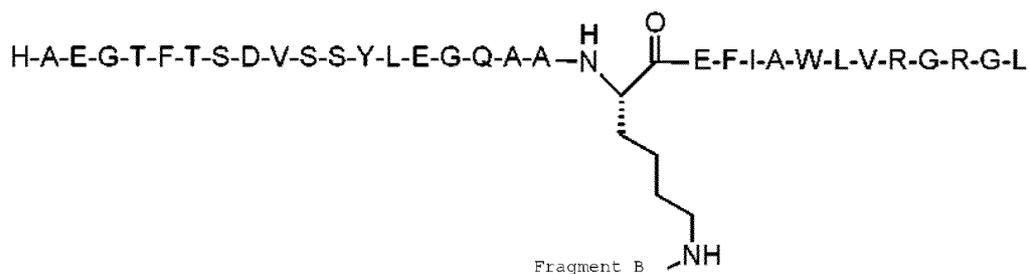


dans lequel le fragment A a la structure :

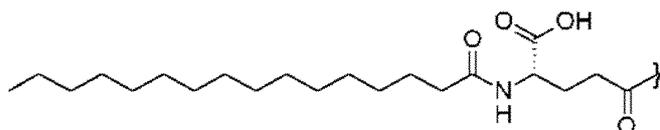


5

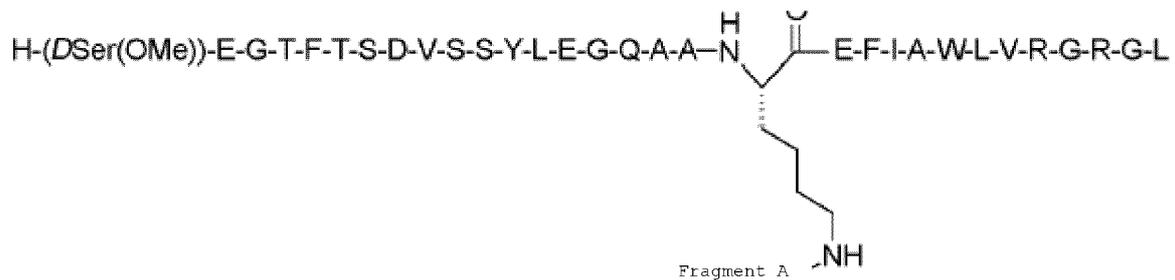
Revendication 7. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :



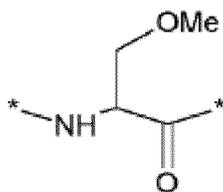
10 dans lequel le fragment B a la structure :



Revendication 10. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :

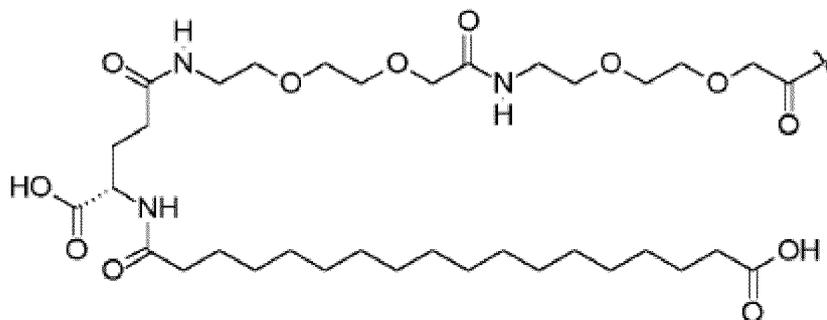


- 5 Dans lequel DSer est un résidu sérine ayant une configuration D et DLeu est un résidu leucine ayant une configuration D ; dans lequel Ser(OMe) est un résidu sérine ayant la structure :

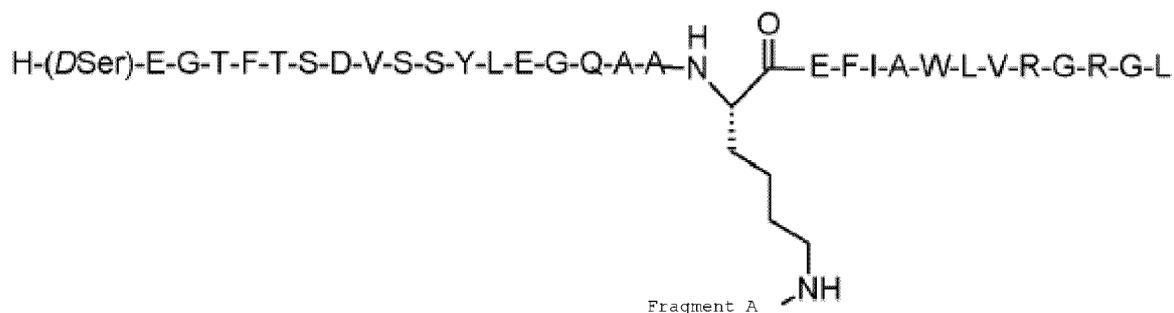


; et

Dans laquelle le fragment A a la structure suivante :

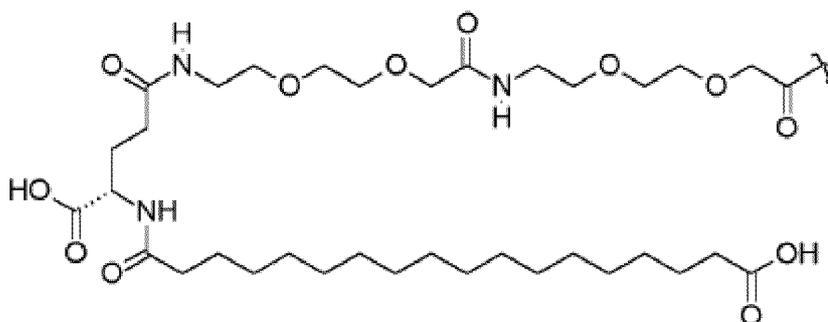


Revendication 11. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :



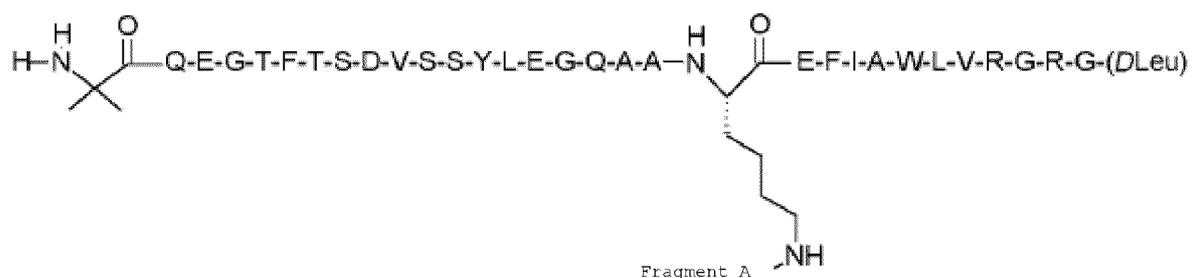
Dans lequel *DSer* est un résidu sérine ayant une configuration D ;
et

Dans laquelle le fragment A a la structure suivante :



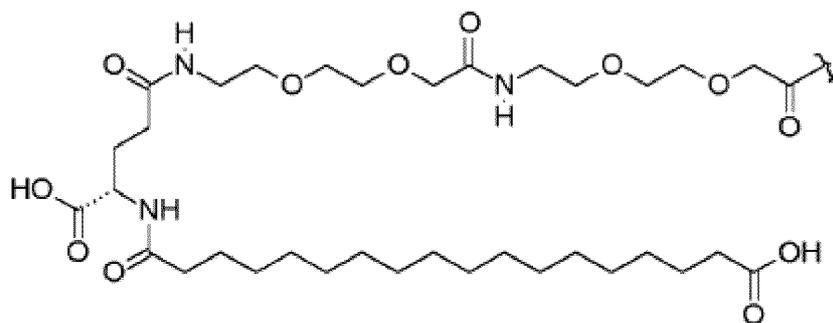
5

Revendication 12. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :

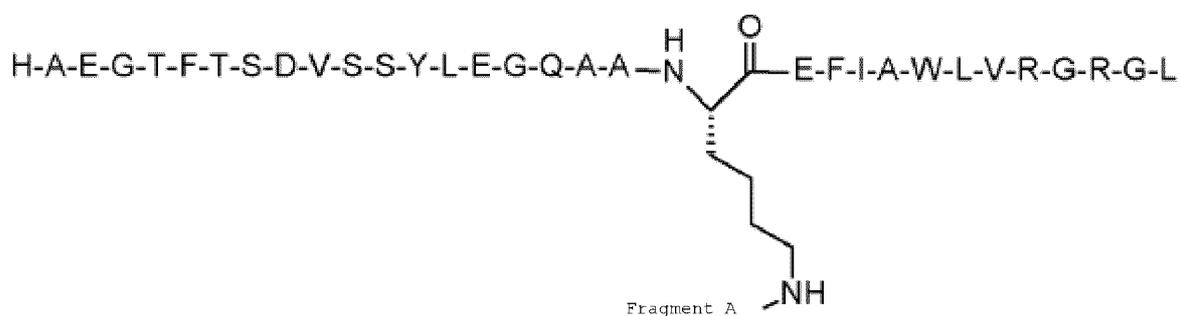


10 Dans lequel *DSer* est un résidu leucine ayant une configuration D ; et

Dans laquelle le fragment A a la structure suivante :

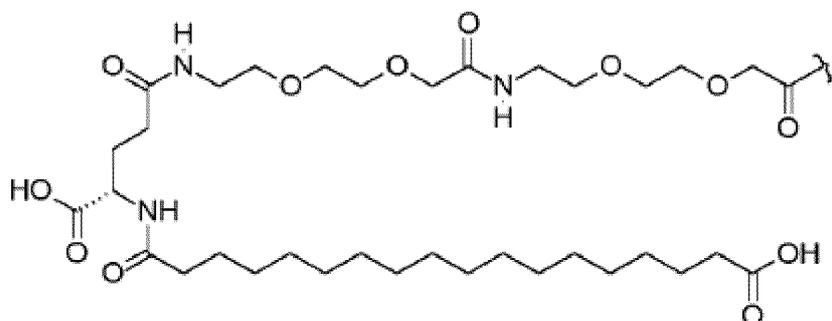


Revendication 13. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :

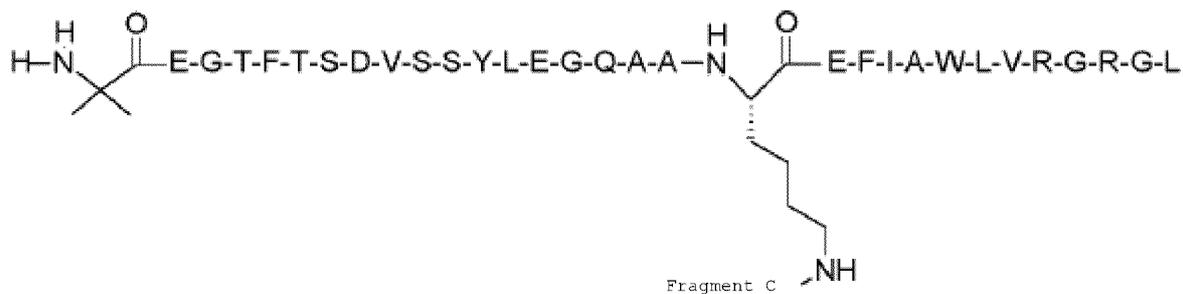


5

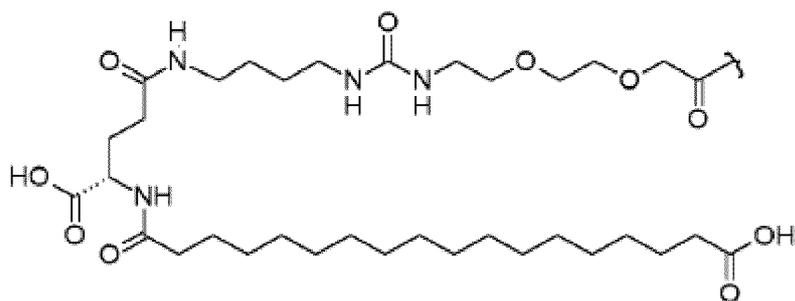
Dans laquelle le fragment A a la structure suivante :



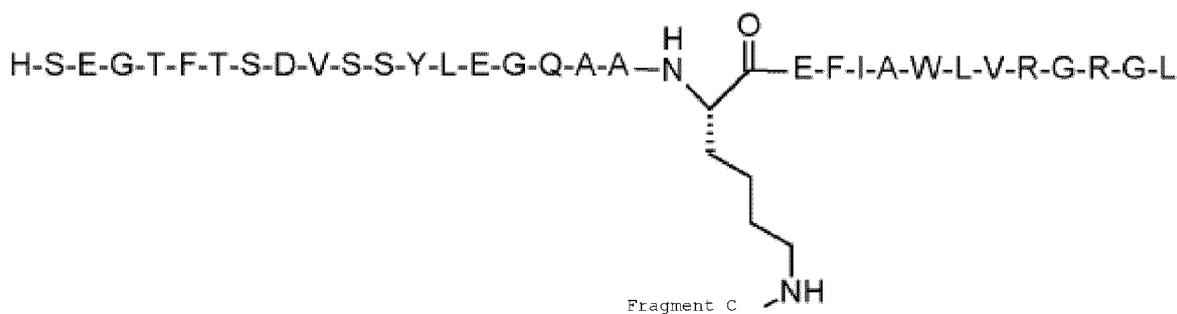
10 Revendication 14. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :



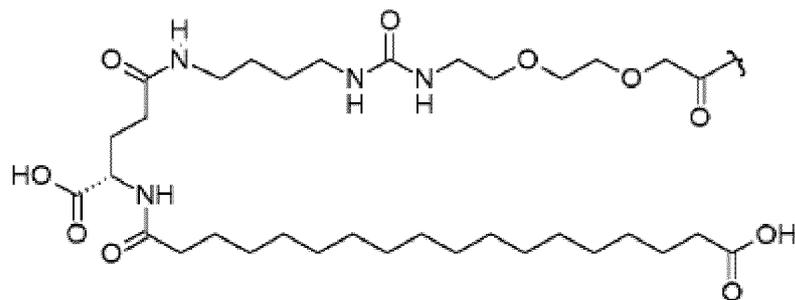
Dans lequel le fragment C a la structure :



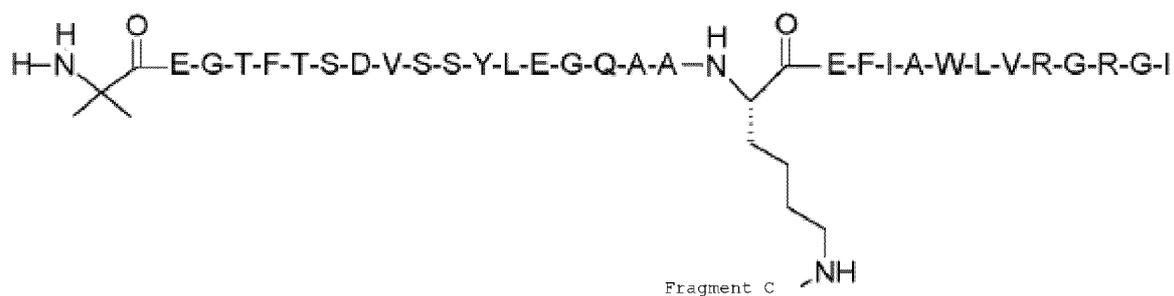
5 Revendication 15. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :



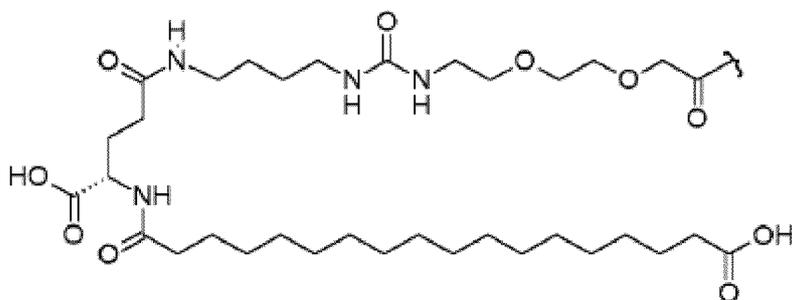
Dans lequel le fragment C a la structure :



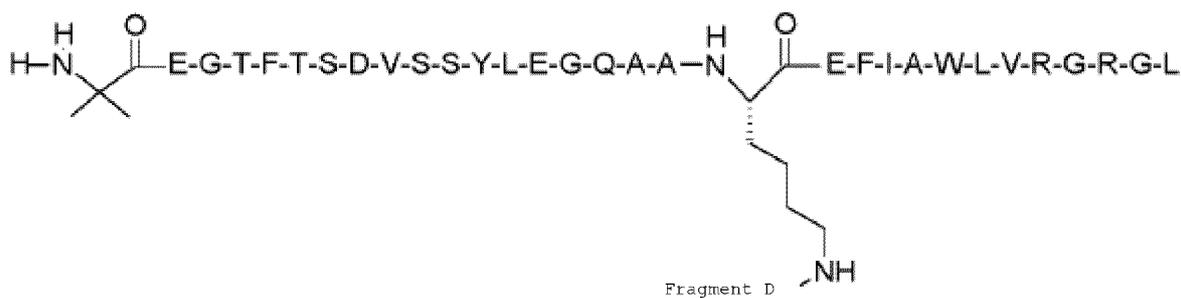
Revendication 16. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :



5 Dans lequel le fragment C a la structure :

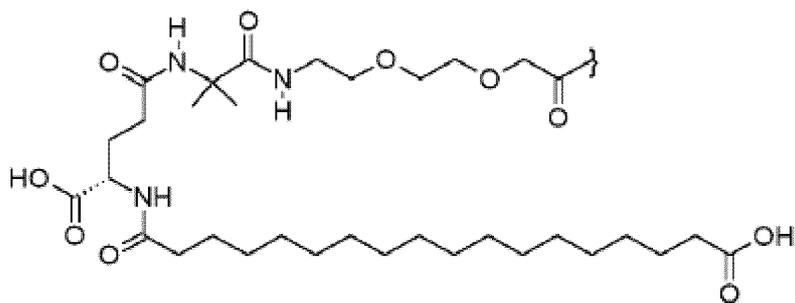


Revendication 17. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :

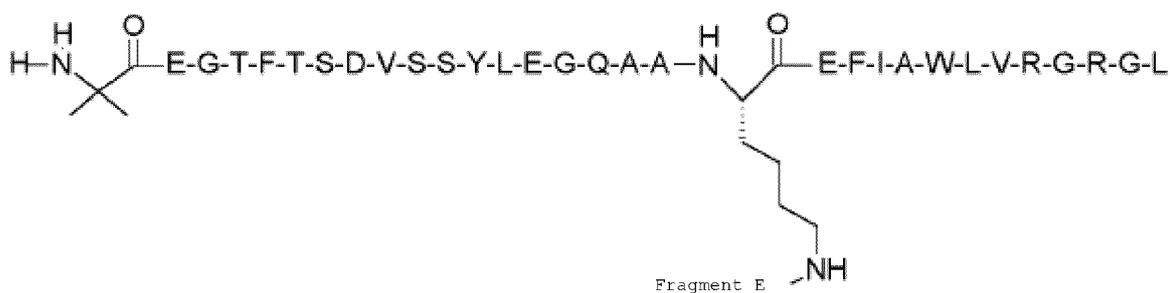


10

Dans lequel le fragment D a la structure :

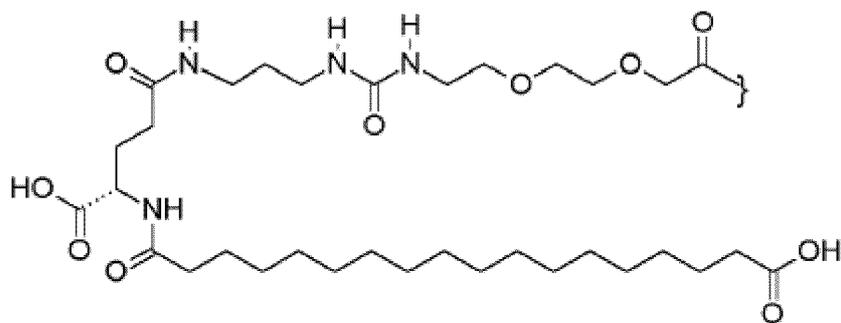


Revendication 18. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :



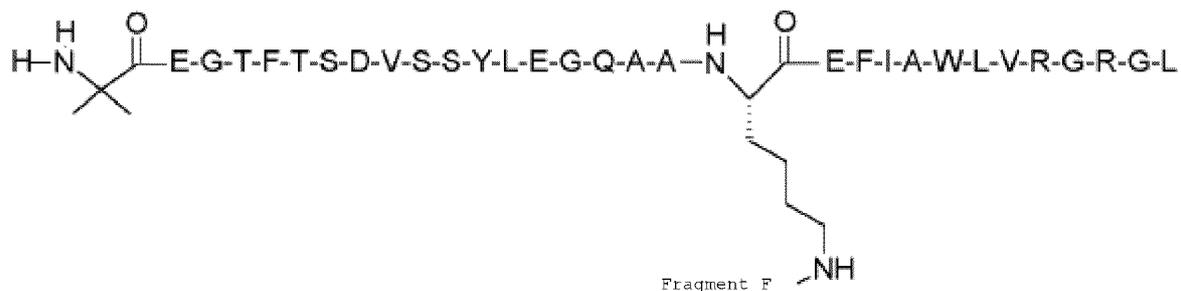
5

Dans lequel le fragment E a la structure :

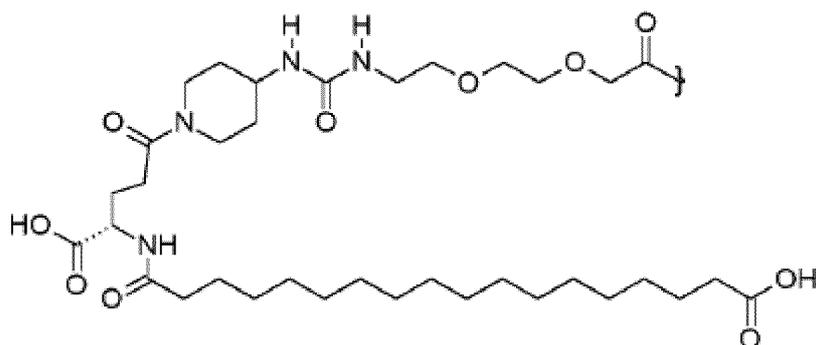


Revendication 19. Polypeptide selon la revendication 1, dans lequel le polypeptide comprend la séquence d'acides aminés :

10



Dans lequel le fragment F a la structure :



5 Revendication 20. Polypeptide selon l'une quelconque des revendications précédentes, destiné à être utilisé dans le traitement du diabète.

10 Revendication 21. Polypeptide selon l'une quelconque des revendications 1 à 19, destiné à être utilisé dans le traitement de l'obésité