(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国 际 局

(43) 国际公布日
2011 年 11 月 3 日 (03.11.2011)

PCT

(10) 国际公布号
WO 2011/134284 A1

(51) 国际专利分类号:
C07K 14/605 (2006.01) *A61P 3/10* (2006.01)
A61K 38/26 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2011/000764

(22) 国际申请日: 2011 年 4 月 29 日 (29.04.2011)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201010156732.1 2010 年 4 月 27 日 (27.04.2010) CN
201110078365.2 2011 年 3 月 30 日 (30.03.2011) CN

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): **浙江贝达药业有限公司 (ZHEJIANG BETA PHARMA INC.)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。

(72) 发明人; 及

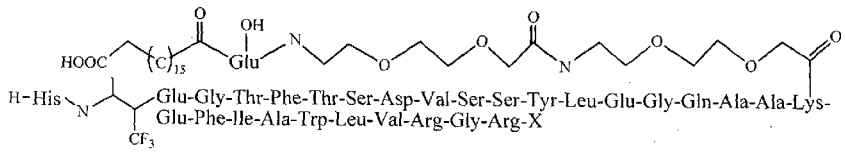
(75) 发明人/申请人 (仅对美国): **王印祥 (WANG, Yinxiang)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。 **谭芬来 (TAN, Fenlai)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。 **胡邵京 (HU, Shaojing)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。 **赵向东 (ZHAO, Xiangdong)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。 **马存波 (MA, Cunbo)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。 **王燕萍 (WANG, Yanping)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。 **沈晓燕 (SHEN, Xiaoyan)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。 **丁列明 (DING, Lieming)** [CN/CN]; 中国浙江省杭州市余杭经济开发区红丰路 589 号, Zhejiang 311100 (CN)。 **胡云雁 (HU, Yunyan)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。 **曹红 (CAO, Hong)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。 **龙伟 (LONG, Wei)** [CN/CN]; 中国北京市经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。

(81) 指定国 (除另有指明，要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL,

[见续页]

(54) **Title**: GLUCAGON-LIKE PEPTIDE-1 ANALOGUE AND USE THEREOF

(54) **发明名称** : 胰高血糖素样肽-1 类似物及其应用



(57) **Abstract**: Provided is a glucagon-like peptide-1 (GLP-1) analogue shown as the following formula, wherein X is selected from glycine and glycinamide. The GLP-1 analogue has a non-proteogenic amino acid residue in position 8 relative to the sequence GLP-1, and is acylated with a moiety comprising two acidic groups to the lysine residue in position 26. The GLP-1 analogue is resistant to dipeptidyl peptidase IV so as to have an extended half-life in vivo. Also provided is a use of the GLP-1 analogue in conquering blood sugar.

(57) **摘要**:

提供的是如下式所示的胰高血糖素样肽-1（GLP-1）类似物，其中 X 选自甘氨酸和甘氨酰胺。该 GLP-1 类似物在相对于 GLP-1 序列的第 8 位上具有一个非蛋白源性氨基酸残基，并在第 26 位的赖氨酸残基上用包含两个酸性基团的部分酰化。该 GLP-1 类似物抗二肽基肽酶 IV，从而具有延长的体内半衰期。还提供的是该 GLP-1 类似物的降血糖应用。

WO 2011/134284 A1

PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW。

(84) **指定国** (除另有指明，要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

本国际公布:

— 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。

— 包括关于请求恢复一项或多项优先权要求的信息(细则 26 之二.3 和 48.2(b)(vii))。