



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2661266 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/4709 (2006.01)
A61K 31/155 (2006.01)
A61K 31/194 (2006.01)
A61K 31/198 (2006.01)
A61K 31/201 (2006.01)
A61K 31/353 (2006.01)
A61K 31/575 (2006.01)
A61K 31/7016 (2006.01)
A61K 31/7032 (2006.01)
A61K 31/704 (2006.01)
A61P 1/00 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
A61P 7/12 (2006.01)
A61P 19/10 (2006.01)
A61P 21/00 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.01.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.09.16
(86)	European Application Nr.	12732408.5
(86)	European Filing Date	2012.01.06
(87)	The European Application's Publication Date	2013.11.13
(30)	Priority	2011.01.07, US, 201161430914 P
(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
(73)	Proprietor	Anji Pharma (US) LLC, 4 Dana Road, Boxford, MA 01921, USA
(72)	Inventor	BARON, Alain D., 12863 Baywind Point, San Diego, CA 92130, USA BROWN, Martin R., 834 Tolita Avenue, Coronado, CA 92118, USA JONES, Christopher R. G., 13713 Freeport Road, San Diego, CA 92129, USA BEELEY, Nigel R. A., 227 Loma Corta Drive, Solana Beach, CA 92075, USA FINEMAN, Mark S., 12444 Oakfort Place, San Diego, CA 92130, USA
(74)	Agent or Attorney	CURO AS, Vestre Rosten 81, 7075 TILLER, Norge

(54) Title **CHEMOSENSORY RECEPTOR LIGAND-BASED THERAPIES**

(56) References

Cited:

WO-A1-2004/110422
 WO-A2-2008/057470
 WO-A2-2013/103919
 WO-A2-2008/057968
 WO-A2-2006/086727
 US-A1- 2010 254 916
 WO-A2-2011/160093
 US-A1- 2010 184 796
 US-A1- 2010 331 420
 EP-A1- 1 591 114
 WO-A2-2007/007189
 WO-A2-2010/123930
 US-A1- 2008 038 739
 US-A1- 2010 267 643

E. ROZENGURT: "Taste Receptors in the Gastrointestinal Tract. I. Bitter taste receptors and -gustducin in the mammalian gut", AMERICAN JOURNAL OF PHYSIOLOGY: GASTROINTESTINAL AND LIVER PHYSIOLOGY, vol. 291, no. 2, 18 May 2006 (2006-05-18), pages G171-G177, XP55127077, ISSN: 0193-1857, DOI: 10.1152/ajpgi.00073.2006

GERAEDTS M ET AL: "136 Release of Satiety Hormones Induced By the Five Basic Tastants Is Controlled By the Influx of Calcium", GASTROENTEROLOGY, ELSEVIER, PHILADELPHIA, PA, vol. 136, no. 5, 1 May 2009 (2009-05-01), pages A-25, XP026110666, ISSN: 0016-5085, DOI: 10.1016/S0016-5085(09)60119-0 [retrieved on 2009-05-01]

BHOYAR P K ET AL: "Formulation and In vitro Evaluation of Sustained Release Dosage Form with Taste Masking of Metformin Hydrochloride", INDIAN JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES, MEDKNOW PUBLICATIONS PVT LTD, IN, vol. 72, no. 2, 1 March 2010 (2010-03-01), pages 184-190, XP009162200, ISSN: 0250-474X

JOHN B. BUSE ET AL: "The Primary Glucose-Lowering Effect of Metformin Resides in the Gut, Not the Circulation. Results From Short-term Pharmacokinetic and 12-Week Dose-Ranging Studies", DIABETES CARE, 18 August 2015 (2015-08-18), page dc150488, XP055556060, US ISSN: 0149-5992, DOI: 10.2337/dc15-0488

JOHN HB SCARPELLO ET AL: "Metformin therapy and clinical uses", DIABETES & VASCULAR DISEASE RESEARCH : OFFICIAL JOURNAL OF THE INTERNATIONAL SOCIETY OF DIABETES AND VASCULAR DISEASE, vol. 5, no. 3, 1 January 2008 (2008-01-01) , page 157, XP55126366, ISSN: 1479-1641, DOI: 10.3132/dvdr.2008.027

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/>

Patentkrav

1. En sammensetning omfattende metformin eller et salt derav for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av forstyrrelser av glukosemetabolisme hos et individ med
5 tilsvarende behov, idet sammensetningen er tilpasset for levering til enteroendokrine celler distalt av tolvfingertarmen for å minimere plasmaabsorpsjon hos individet, idet nevnte lidelse fortrinnsvis er hyperglykemi.
2. En sammensetning omfattende metformin eller et salt derav for bruk i en fremgangsmåte for behandling av diabetes, fedme eller pre-diabetes hos et individ med tilsvarende behov, idet
10 sammensetningen er tilpasset for levering til enteroendokrine celler distalt av tolvfingertarmen for å minimere plasmaabsorpsjon hos nevnte individ.
3. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, idet metforminet eller et salt derav er metforminhydroklorid.
4. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, idet nevnte en eller flere områder av
15 tarmen er jejunum, ileum og / eller nedre tarm.
5. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, idet metforminet eller et salt derav er belagt med et magesaftresistent belegg, idet sammensetningen fortrinnsvis frigjør metformin begynnende på pH ca.5,5, pH ca.6,0, pH ca.6,5, pH ca.7,0 eller en kombinasjon derav etter administrering til et individ.
- 20 6. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, idet den terapeutisk effektive mengden metformin eller et salt derav, er ca. 1 mg til ca. 2000 mg.
7. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, idet sammensetningen videre omfatter (i) et antidiabetisk middel eller (ii) et middel mot fedme, idet fortrinnsvis (i) det antidiabetiske midlet er valgt fra gruppen bestående av tiazolidindioner, sulfonylurea, DPP-IV hemmere, og
25 doble PPAR-agonister; eller hvor (ii) midlet mot fedme er valgt fra gruppen bestående av fentermin, fenfluramin, sibutramin, rimonabant, topiramat, zonisamid bupropion, naltrexon, lorcaserin og orlistat og kombinasjoner derav.
8. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, idet sammensetningen videre omfatter en kjemosensorisk reseptorligand valgt fra gruppen bestående av en søtreseptorligand, en
30 bitterreseptorligand, en umamireseptorligand, en fettreseptorligand, en surreseptorligand og en gallsyrereseptorligand.

9. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 2, idet metforminet eller et salt derav er metforminhydroklorid, og hvor pasienten har type II-diabetes.

10. Sammensetning omfattende metformin eller et salt derav for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en sykdom, forstyrrelse eller defekt i energihomeostasen hos et individ, idet
5 sammensetningen er tilpasset for levering til enteroendokrine celler distalt av tolvfingertarmen for å minimere plasmaabsorpsjon hos nevnte individ.

11. En farmasøytisk sammensetning omfattende metformin eller et salt derav og et annet antidiabetisk middel eller et middel mot fedme, eller en kjemosensorisk reseptorligand valgt fra gruppen bestående av en søtreseptorligand, en bitterreseptorligand, en umamireseptorligand, en
10 fettreseptorligand, en surreseptorligand og en gallsyrereseptorligand for bruk ved behandling av forstyrrelser av glukosemetabolisme, idet det farmasøytiske preparatet er tilpasset for levering til enteroendokrine celler distalt av tolvfingertarmen for å minimere plasmaabsorpsjon hos nevnte individ.

12. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 11, idet metformin eller saltet derav
15 er belagt med et magesaftresistent belegg, fortrinnsvis idet metformin frigjøres fra nevnte farmasøytiske sammensetning begynnende på ca. pH 5,5, ca. pH 6,0, ca. pH 6,5, ca. pH 7,0 eller en kombinasjon derav etter administrering til et individ.

13. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 11, idet det antidiabetiske middel er valgt fra gruppen bestående av tiazolidindioner, sulfonyurea, DPP-IV-hemmere og doble PPAR-
20 agonister eller idet midlet mot fedme er valgt fra gruppen bestående av fentermin, fenfluramin, sibutramin, rimonabant, topiramet, zonisamid bupropion, naltrexon, lorcaserin og orlistat og kombinasjoner derav.

14. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 11, idet sammensetningen er tilpasset for levering til enteroendokrine celler distalt av jejunum.