



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3137081 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**A61K 31/485 (2006.01)**  
**A61K 31/137 (2006.01)**  
**A61K 31/167 (2006.01)**  
**A61P 25/04 (2006.01)**  
**C07C 233/16 (2006.01)**  
**C07D 489/00 (2006.01)**  
**C07D 489/02 (2006.01)**  
**C07D 489/08 (2006.01)**  
**C07D 489/12 (2006.01)**  
**C07D 519/00 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

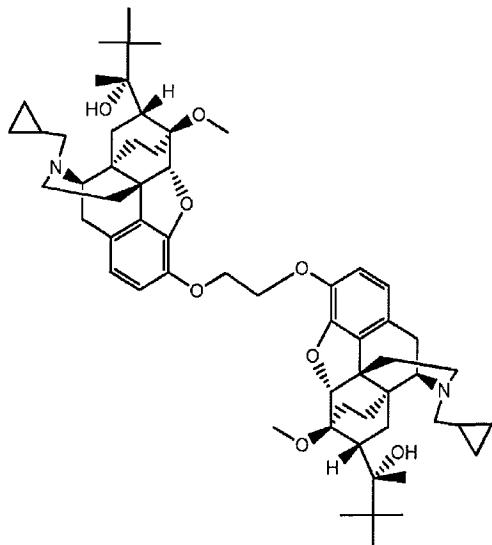
(21)	Translation Published	2018.01.29
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.11.15
(86)	European Application Nr.	15720244.1
(86)	European Filing Date	2015.04.27
(87)	The European Application's Publication Date	2017.03.08
(30)	Priority	2014.04.28, US, 201461985207 P 2015.01.09, US, 201562101768 P 2015.01.09, US, 201562176883 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
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Orphomed, Inc., 806 Denise Court, Mill Valley, CA 94941, US-USA
(72)	Inventor	SINGH, Nikhilesh, 806 Denise Court, Mill Valley, California 94941, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Protector Intellectual Property Consultants AS, Oscarsgate 20, 0352 OSLO, Norge
(54)	Title	<b>BUPRENORPHINE DIMER AND ITS USE IN TREATMENT OF GASTROINTESTINAL DISORDERS</b>
(56)	References Cited:	S. ZAKKO ET AL: "Randomised clinical trial: the clinical effects of a novel neurokinin receptor antagonist, DNK333, in women with diarrhoea-predominant irritable bowel syndrome", ALIMENTARY PHARMACOLOGY & THERAPEUTICS, vol. 33, no. 12, 20 April 2011 (2011-04-20), pages 1311-1321, XP055195900, ISSN: 0269-2813, DOI: 10.1111/j.1365-2036.2011.04656.x, CAMILLERI M: "Current and future pharmacological treatments for diarrhoea-predominant irritable bowel syndrome", EXPERT OPINION ON PHARMACOTHERAPY 2013

INFORMA HEALTHCARE GBR, vol. 14, no. 9, June 2013 (2013-06), pages 1151-1160, XP009184884, ISSN: 1465-6566, WO-A2-03/032990, SUSHAMA A. BHOUNSULE ET AL: "Gastrointestinal actions of buprenorphine: are different receptors involved?", EUROPEAN JOURNAL OF PHARMACOLOGY, vol. 316, no. 2-3, 1 December 1996 (1996-12-01), pages 253-256, XP055196066, ISSN: 0014-2999, DOI: 10.1016/S0014-2999(96)00668-1, US-A1- 2005 075 361, US-A1- 2011 245 287, WO-A2-2004/103317

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.patentsstyret.no/>

## Patentkrav

1. En buprenorfin dimer forbindelse med formel (I):



Formel (I)

5

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

2. Buprenorfin dimer forbindelse i henhold til krav 1, hvor forbindelsene er i form av et farmasøytisk akseptabelt salt.
3. Buprenorfin dimer forbindelse i henhold til krav 1, hvor forbindelsene er i fri base form.
4. En farmasøytisk sammensetning innbefattende en farmasøytisk akseptabel bærer eller eksipient og en buprenorfin dimer forbindelse i henhold til hvilke som helst av kravene 1-3.
5. Buprenorfin dimer forbindelse i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 3, for bruk ved en fremgangsmåte for behandling eller håndtering av gastrointestinal hyperalgesi, hvor fremgangsmåten innbefatter administrering til en pasient med behov for dette, av en terapeutisk effektiv mengde av buprenorfin dimer forbindelsen i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 3.
- 20 6. Buprenorfin dimer forbindelse i henhold til hvilke som helst av

- kravene 1 til 3, for bruk ved en fremgangsmåte for behandling diaré-predominant colon irritabile syndrom (IBS-D) hos en pasient med behov for dette, hvilken fremgangsmåte innbefatter administrering av en terapeutisk effektiv mengde av buprenorfin dimer forbindelsen i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 3 til en pasient.
- 5
7. Buprenorfin dimer forbindelsen for bruk i henhold til krav 6, hvor pasienten er et menneske og hvor dosen som administreres er 0,1 mg/kg av pasientens kroppsvekt til 7,2 mg/kg av pasientens kroppsvekt.
- 10 8. Buprenorfin dimer forbindelse for bruk i henhold til krav 6, hvor pasienten er et menneske og hvor den administrerte dosen er 10 til 50 mg daglig.