



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2352494 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/137 (2006.01)
A61K 9/107 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/24 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 9/50 (2006.01)
A61K 31/135 (2006.01)
A61K 31/35 (2006.01)
A61K 31/485 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 25/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.12.16
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.10.09
(86)	European Application Nr.	09840521.0
(86)	European Filing Date	2009.10.29
(87)	The European Application's Publication Date	2011.08.10
(30)	Priority	2008.10.30, US, 197625 P 2009.01.21, US, 205312 P 2009.06.15, US, 268630 P
(84)	Designated Contracting States:	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 ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Grünenthal GmbH, Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, Tyskland
(72)	Inventor	SESHA, Ramesh, 9113, Taylor Court, West Windsor, NJ 08550, USA
(74)	Agent or Attorney	Orsnes Patent ApS, Forskerparken 10, 5230 ODENSE, Danmark

(54)	Title	NOVEL AND POTENT TAPENTADOL DOSAGE FORMS
(56)	References Cited:	WO-A1-01/58447 US-A1- 2003 031 712 WO-A1-2008/128739 US-A1- 2004 024 004 EP-A1- 1 985 292 WO-A2-00/01377

US-A1- 2003 073 714

STEGMANN J.U ET AL.: 'The efficacy and tolerability of multiple-dose tapentado 1 immediate release for the relief of acute pain following orthopedic (bunio neotomy) surgery' CURR MED RES OPIN vol. 24, no. 11, 10 October 2008, pages 3185 - 3196, XP008111730
TZSCHENTKE THOMAS M ET AL: "(-)-(1R,2R)-3-(3-dimethylamino-1-ethyl-2- methyl-propyl)-phenol hydrochloride (tapentadol HCl): a novel mu-opioid receptor agonist/norepinephrine reuptake inhibitor with broad-spectrum analgesic properties.", THE JOURNAL OF PHARMACOLOGY AND EXPERIMENTAL THERAPEUTICS OCT 2007 LNKD-PUBMED:17656655, vol. 323, no. 1, October 2007 (2007-10), pages 265-276, XP002672360, ISSN: 0022-3565

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. Doseringsform med langsom frigjøring omfattende minst én form for tapentadol valgt fra gruppen som består av tapentadolbase, optisk aktive enantiomerer av tapentadol og farmasøytisk akseptable salter av tapentadol, og minst én opioidantagonist valgt fra gruppen som består av nalokson og naltrekson og farmasøytisk akseptable salter derav, hvori antagonisten forbedrer effektiviteten og/eller reduserer bivirkningene av tapentadol og hvori doseringsformen tilveiebringer effektiv smertelindring i minst 12 timer, når den administreres til en menneskepasient.
2. Doseringsform ifølge krav 1, hvori doseringsformen tilveiebringer effektiv smertelindring i opptil 24 timer når den administreres til en menneskepasient.
3. Doseringsform ifølge krav 1, hvori doseringsformen utviser en oppløsningsprofil, når målt i et skovlapparat av USP type II ved 100 opm ved 37 °C i 900 ml SGF/SIF-kombinasjon, slik at ca. 8 % av tapentadol ble frigjort etter to timer, ca. 22 % av tapentadol ble frigjort etter 4 timer, ca. 48 % av tapentadol ble frigjort etter 8 timer, ca. 70 % av tapentadol ble frigjort etter 12 timer, ca. 78 % av tapentadol ble frigjort etter 16 timer, og ikke mindre enn 80 % av tapentadol ble frigjort etter 20 timer.
4. Doseringsform ifølge krav 1, hvori doseringsformen, ved administrering, resulterer i en bivirkningsprofil som er bedre enn bivirkningsprofilen som er resultat av administrering av en doseringsform som er fri for en antagonist.
5. Doseringsform ifølge krav 1, hvori doseringsformen, ved administrering, resulterer i færre forekomster av svimmelhet eller vertigo enn det som ville resultere fra administrering av en doseringsform som er fri for en antagonist.
6. Doseringsform ifølge krav 1, hvori doseringsformen, ved administrering, resulterer i færre forekomster av kvalme enn det som ville resultere fra administrering av en doseringsform som er fri for en antagonist.

- 7.** Doseringsform ifølge krav 1, hvori doseringsformen, ved administrering, resulterer i færre forekomster av oppkast enn det som ville resultere fra administrering av en doseringsform som er fri for en antagonist.
- 8.** Doseringsform ifølge krav 1, hvori doseringsformen er et transdermalt avgivelsessystem, et oralt slimhinneavgivelsessystem, en doseringsform egnet for intranasal administrering, et bukkalt avgivelsessystem, en injiserbar doseringsform eller en fast oral doseringsform.