



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2600839 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/407 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.06.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.01.10
(86)	European Application Nr.	11746175.6
(86)	European Filing Date	2011.08.04
(87)	The European Application's Publication Date	2013.06.12
(30)	Priority	2010.08.04, EP, 10008116 2010.08.04, US, 201161370643 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	Grünenthal GmbH, Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, DE-Tyskland
(72)	Inventor	SCHILLER, Marc, Max-Pechstein-Strasse 4, 52076 Aachen, DE-Tyskland GRÜNING, Nadja, Kleinmarschierstr. 37, 52062 Aachen, DE-Tyskland FRIEDRICH, Ingo, Im Gödersfeld 28, 52078 Aachen, DE-Tyskland KIRBY, Chris, Pharmaterials5 Boulton Road, Reading RG2 0NH, GB-Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

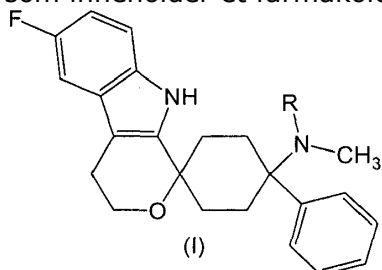
(54)	Title	PHARMACEUTICAL DOSAGE FORM COMPRISING 6'-FLUORO-(N-METHYL- OR N,N-DIMETHYL-)-4-PHENYL-4',9'-DIHYDRO-3'H-SPIRO[CYCLOHEXANE-1,1'-PYRANO[3,4,B]INDOL]-4-AMINE
(56)	References Cited:	WO-A1-2004/043967, US-A1- 2007 048 228, WO-A1-2008/040481, WO-A1-2006/082099

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. Farmasøytisk doseringsform for administrering to ganger daglig, én gang daglig eller sjeldnere,

som inneholder et farmakologisk aktivt middel ifølge generell formel (I)



hvor R eller -H er -CH₃,

eller et fysiologisk akseptabelt salt derav;

som frisetter i samsvar med Ph. Eur. under *in vitro*-betingelser i 900 ml kunstig magesyre ved pH 1,2 og 37 ± 0,5 °C etter 30 minutter ifølge Paddle-fremgangsmåten med synkeinnretning ved 100 rpm minst 50 vekt-% av det farmakologisk aktive middelet, basert på den totale mengden av det farmakologisk aktive middelet opprinnelig inneholdt i den farmasøytiske doseringsformen; og

som omfatter et fast polymert matriksmateriale i hvilket det farmakologisk aktive middelet ifølge den generelle formelen (I) dispergeres og immobiliseres i en amorf eller semi-amorf tilstand, og hvor polymeren er valgt fra gruppen bestående av polyvinylpyrrolidon, vinylpyrrolidon-polyvinylacetatkopolymerer og en hvilken som helst kombinasjon derav; og

hvor det relative vektforholdet av polymeren i forhold til det farmakologisk aktive middelet ifølge den generelle formelen (I) er minst 6:1.

2. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge krav 1, som ytterligere omfatter en surfaktant.

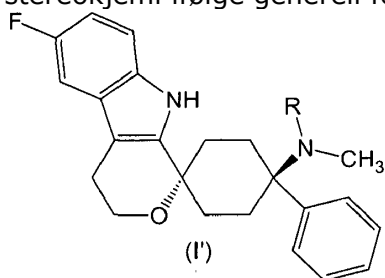
3. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge krav 2, hvor

- surfaktanten har en HLB-verdi på minst 10; og/eller

- innholdet av surfaktanten er minst 0,001 vekt-%, basert på den totale vekten til den farmasøytiske doseringsformen.

4. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge krav 2 eller 3, hvori surfaktanten er valgt fra gruppen bestående av polyoksyetylenfettsyreestere, delvis fettsyreestere av polyoksyetylen-sorbitan og svovelsyreestere.

5. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge hvilke som helst av de foregående kravene, hvori det farmakologisk aktive middelet ifølge generell formel (I) har en stereokjemi ifølge generell formel (I')



hvor R er som definert i krav 1.

6. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge hvilke som helst av de foregående kravene, hvori det farmakologisk aktive middelet ifølge generell formel (I) er (1*r*,4*r*)-6'-fluor-*N,N*-dimetyl-4-fenyl-4',9'-dihydro-3'*H*-spiro[sykloheksan-1,1'-pyrano[3,4,*b*]indol]-4-amin, (1*r*,4*r*)-6'-fluor-*N*-metyl-4-fenyl-4',9'-dihydro-3'*H*-spiro[sykloheksan-1,1'-pyrano-[3,4,*b*]indol]-4-amin eller et fysiologisk akseptabelt salt derav.

7. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge hvilke som helst av de foregående kravene, som frigjør under *in vitro*-betingelser i 900 ml kunstig magesaft ved pH 1,2 etter 30 minutter minst 80 vekt-% av det farmakologisk aktive middelet ifølge generell formel (I), basert på den totale mengden av det farmakologisk aktive middelet ifølge generell formel (I) opprinnelig inneholdt i doseringsformen.

8. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge hvilke som helst av de foregående kravene, som inneholder det farmakologisk aktive middelet ifølge generell formel (I) i en dose fra 10 µg til 50 µg eller fra 300 µg til 500 µg.

9. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge hvilke som helst av de foregående kravene for anvendelse i behandlingen av smerte.

10. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge krav 9, hvori smerten er valgt fra akutt, visceral, nevropatisk eller kronisk smerte.