



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3377049 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/00 (2006.01)
A61P 25/04 (2006.01)
C07C 215/54 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

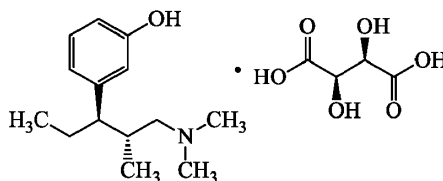
(45)	Translation Published	2021.06.14
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.01.06
(86)	European Application Nr.	16865892.0
(86)	European Filing Date	2016.11.16
(87)	The European Application's Publication Date	2018.09.26
(30)	Priority	2015.11.17, IN, 6191CH2015
(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	MSN Laboratories Private Limited, Sy. No: 317&323 Rudraram (Vil) Patancheru (Mdl) Medak (Dist), Hyderabad, Telangana 502329, India
(72)	Inventor	THIRUMALAI RAJAN, Srinivasan, Sy. No: 317&323 Rudraram (Vil) Patancheru (Mdl) Medak (Dist), Hyderabad Telangana, India KISHORE KUMAR, Muppa, Sy. No: 317&323 Rudraram (Vil) Patancheru (Mdl) Medak (Dist), Hyderabad Telangana, India VENKATESH, Mummadi, Sy. No: 317&323 Rudraram (Vil) Patancheru (Mdl) Medak (Dist), Hyderabad Telangana, India PRANEETH KUMAR, Anugu, Sy. No: 317&323 Rudraram (Vil) Patancheru (Mdl) Medak (Dist), Hyderabad Telangana, India
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	CRYSTALLINE FORMS OF TAPENTADOL SALTS AND PROCESS FOR PREPARATION THEREOF
(56)	References Cited:	WO-A1-2014/108514 US-A1- 2011 071 120 US-B2- 8 981 154 CN-A- 103 553 940 WO-A1-2012/051246

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. Krystallinsk tapentadoltartratforbindelse ifølge formel-1b



Formula-1b.

2. Krystallinsk tapentadoltartrat ifølge krav 1, hvor nevnte krystallinske form er **karakterisert av** dens pulverrøntgendiffraksjonsmønster med topper ved 12,7, 14,1, 18,6, 20,0, 21,1, 21,6, 22,1, 23,7, 25,6 og $28,5 \pm 0,2$ grader av 2-teta.
3. Krystallinske tapentadoltartrat ifølge krav 2, har endotermen ved $132^\circ\text{C} \pm 3^\circ\text{C}$ i sitt differensialskanningskalorimetriske (DSC) termogram.
4. Krystallinsk tapentadoltartrat ifølge krav 2 eller 3, **karakterisert av** absorpsjonstopper ved 3319, 3237, 2960, 1731, 1597, 1305, 1263, 1213, 791, 679 og 485 cm^{-1} i sitt infrarøde spektrum.
5. Krystallinsk tapentadoltartrat ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor det krystallinske tapentadoltartratet har en renhet på $>99\%$ ved HPLC.
6. Fremgangsmåte for fremstilling av det krystallinske tapentadoltartratet som definert i krav 1, nevnte fremgangsmåte omfatter trinnet: å behandle tapentadolfri base med vinsyre i et egnet løsningsmiddel for å tilveiebringe tapentadoltartrat ifølge formel-1b.
7. Fremgangsmåte ifølge krav 6, nevnte fremgangsmåte omfatter trinnene:
 - a) å behandle (2R,3R)-3-(3-metoksyfenyl)-N,N,2-trimetylpentan-1-aminhydrokloridet med vandig hydrogenbromidløsning for å tilveiebringe tapentadolfri base,
 - b) eventuelt å isolere tapentadolfri base,
 - c) å behandle tapentadolfri base tilveiebragt i trinn-a) eller trinn-b) med vinsyre i et egnet løsningsmiddel for å tilveiebringe tapentadoltartrat ifølge formel-1b,

d) eventuelt å rense forbindelsen tilveiebragt i trinn-c) fra et egnet løsningsmiddel.

5 8. Fremgangsmåte for fremstilling av krystallinsk tapentadoltartrat som definert i krav 2, nevnte fremgangsmåte omfatter trinnet: å behandle tapentadolfri base med L-(+)-vinsyre i aceton for å tilveiebringe det krystallinske tapentadoltartratet ifølge formel-1b.

10 9. Fremgangsmåte for fremstilling av krystallinsk tapentadoltartrat ifølge krav 8, nevnte fremgangsmåte omfatter trinnene:

a) å behandle (2R,3R)-3-(3-metoksyfenyl)-N, N,2-trimetylpentan-1-aminhydrokloridet med vandig hydrogenbromidløsning for å tilveiebringe tapentadolfri base,

15 b) å behandle tapentadolfri base in situ med L-(+)-vinsyre i aceton for å tilveiebringe den krystallinske tapentadoltartratforbindelsen ifølge formel-1b.

20 10. Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 6 og 7, hvor det egnede løsningsmiddelet er valgt blant alkoholløsningsmidler, ketonløsningsmidler, esterløsningsmidler, hydrokarbonløsningsmidler, eterløsningsmidler, klorløsningsmidler og blandinger derav eller eventuelt i kombinasjon med vann.

11. Krystallinsk tapentadoltartrat som definert i et hvilket som helst av kravene 2 til 5, i en farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen av smerte.

25 12. Farmasøytisk sammensetning omfattende det krystallinske tapentadoltartratet som definert i et hvilket som helst av kravene 2 til 5, og en farmasøytisk akseptabel bærer.