



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3568126 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/137 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 47/10 (2017.01)
A61K 47/18 (2017.01)
A61K 47/38 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.01.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.11.01
(86)	European Application Nr.	18704591.9
(86)	European Filing Date	2018.01.10
(87)	The European Application's Publication Date	2019.11.20
(30)	Priority	2017.01.11, IN, 201721001203
(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	Torrent Pharmaceuticals Limited, Torrent House Off Ashram Road Near Dinesh Hall, Ahmedabad, Gujarat 380009, India
(72)	Inventor	ABRAHAM, Jaya, Torrent Research Centre Tal&Dist Gandhinagar, Bhat Gujarat 382428, India MISHRA, Vivek, Torrent Research Centre Tal&Dist Gandhinagar, Bhat Gujarat 382428, India MITTAL, Vipul, Torrent Research Centre Tal&Dist Gandhinagar, Bhat Gujarat 382428, India CHAUDHARI, Kiran, Torrent Research Centre Tal&Dist Gandhinagar, Bhat Gujarat 382428, India
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, C. J. Hambros plass 2, 0164 OSLO, Norge

(54) Title **TAPENTADOL NASAL COMPOSITION**

(56) References
Cited: WO-A1-2013/011477
DALE O ET AL: "Nasal Administration of opioids for pain management in adults", ACTA
ANAESTHESIOLOGICA SCANDINAVICA, WILEY-BLACKWELL MUNKSGAARD, DK, vol. 46,
no. 7, 1 August 2002 (2002-08-01) , pages 759-770, XP002470504, ISSN: 0001-5172, DOI:
10.1034/J.1399-6576.2002.460702.X

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. Intranasal sammensetning for anvendelse hos menneske omfattende tapentadol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og minst én nasal bærer; hvori en enhetsdose av sammensetningen omfatter tapentadol eller et farmasøytisk akseptabelt salt i en mengde som er ekvivalent med omtrent 19,3 mg tapentadolfri base hvori volumet av en enhetsdose er fra omtrent 25 µl til omtrent 150 µl.
2. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori etter intranasal administrering til mennesket, er en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med enhetsdosen ekvivalent med eller større enn en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med oral administrering til mennesket av en enkelt dose av en sammensetning med umiddelbar frigjøring omfattende tapentadol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde som er ekvivalent med 50 mg tapentadolfri base.
3. Sammensetningen ifølge krav 2, hvori etter intranasal administrering til mennesket, varierer en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med enhetsdosen fra omtrent 40 ng/ml til omtrent 65 ng/ml.
4. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori etter intranasal administrering til mennesket, varierer en gjennomsnittlig AUC₀₋₆-verdi for tapentadol oppnådd med enhetsdosen fra omtrent 115 timer*ng/ml til omtrent 182 timer*ng/ml.
5. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori etter intranasal administrering av enhetsdosen til hvert nesebor hos mennesket, er en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med enhetsdosen ekvivalent med eller større enn en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med oral administrering til et menneske av en enkelt dose av en sammensetning med umiddelbar frigjøring omfattende tapentadol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde som er ekvivalent med omtrent 100 mg tapentadolfri base.

6. Sammensetningen ifølge krav 5, hvori etter intranasal administrering av enhetsdosen til hvert nesebor hos mennesket, varierer en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med enhetsdosen fra omtrent 98 ng/ml til omtrent 155 ng/ml.

7. Sammensetningen ifølge krav 5, hvori etter intranasal administrering av enhetsdosen til hvert nesebor hos mennesket, varierer en tapentadol gjennomsnittlig AUC₀₋₆-verdi oppnådd med enhetsdosen fra omtrent 230 timer*ng/ml til omtrent 365 timer*ng/ml.

8. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori etter intranasal administrering til mennesket, er den gjennomsnittlige T_{max}-verdien oppnådd med enhetsdosen omtrent 1 time eller mindre.

9. Sammensetningen ifølge krav 8, hvori etter intranasal administrering til mennesket, er den gjennomsnittlige T_{max}-verdien oppnådd med enhetsdosen omtrent 0,2 timer til omtrent 0,8 timer.

10. Intranasal sammensetning omfattende tapentadol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og minst én nasal bærer; hvori en enhetsdose av sammensetningen omfatter tapentadol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde som er ekvivalent med omtrent 19,3 mg tapentadolfri base hvori volumet av en enhetsdose er fra omtrent 25 µl til omtrent 150 µl, for anvendelse i behandlingen av smerte hos mennesker, hvori sammensetningen administreres intranasalt.

11. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 10, hvori etter intranasal administrering til mennesket, er en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med enhetsdosen ekvivalent med eller større enn en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med oral administrering til et menneske av en enkelt dose av en sammensetning med umiddelbar frigjøring omfattende tapentadol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde som er

ekvivalent med 50 mg tapentadolfri base.

12. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 10, hvori etter intranasal administrering av enhetsdosen til hvert nesebor hos mennesket, er en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med enhetsdosen ekvivalent med eller større enn en gjennomsnittlig C_{max}-verdi for tapentadol oppnådd med oral administrering til et menneske av en enkelt dose av en sammensetning med umiddelbar frigjøring omfattende tapentadol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde som er ekvivalent med omtrent 100 mg tapentadolfri base.

13. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den nasale bæreren velges fra omtrent 0,05 til omtrent 5 % vekt/volum av et slimhinneklebende middel; fra omtrent 0,2 til omtrent 10,0 % vekt/volum av et solubiliseringmiddel; fra omtrent 0,1 % til omtrent 1 % av et søtningsmiddel; fra omtrent 0,01 til omtrent 1 % vekt/volum av et konserveringsmiddel, fra omtrent 0,01 % vekt/volum til omtrent 0,5 % vekt/volum av et smaksmiddel og en tilstrekkelig mengde av en vannbærer.

14. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 13, hvori det slimhinneklebende midlet velges fra hydroksypropylmetylcellulose og karboksymetylcellulose eller dets farmasøytisk akseptable salt, solubiliseringsmidlet omfatter en poloksamer, søtningsmidlet velges fra sukralose og neotam, konserveringsmidlet omfatter benzalkoniumklorid og smaksstoffet omfatter en grønnyntesmak.