



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3875077 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 9/20 (2006.01)

A61K 31/137 (2006.01)

A61P 25/04 (2006.01)

A61K 9/50 (2006.01)

A61P 25/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.01.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.12.13
(86)	European Application Nr.	20160419.6
(86)	European Filing Date	2020.03.02
(87)	The European Application's Publication Date	2021.09.08
(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, Tyskland
(72)	Inventor	BERTRAM, Ulrike, Schönrathstrasse 82, 52066 Aachen, Tyskland REINHOLD, Ulrich, I. Rote-Haag Weg 44a, 52076 Aachen, Tyskland GROSSE, Christian, Grünenthalerstr. 42, 52072 Aachen, Tyskland HARTMANN, Carmen, Zum Dammfelde 9a, 50859 Köln, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	Budde Schou A/S, Dronningens Tværgade 30, 1302 KØBENHAVN K, Danmark

(54)	Title	DOSAGE FORM PROVIDING PROLONGED RELEASE OF TAPENTADOL PHOSPHORIC ACID SALT
(56)	References Cited:	WO-A1-2012/051246 WO-A1-2017/182438 WO-A2-2008/051617 US-A1- 2020 038 344 BASF ET AL: "Kollidon SR - Technical Information BASF, September 2015.", BASF, 1 September 2015 (2015-09-01), pages 4-10, XP055972547, Retrieved from the Internet: URL:https://pharma.basf.com/technicalinformation/30071321/kollidon-sr [retrieved on 2022-10-18] Rowe C Raymond ET AL: "Handbook of pharmaceutical excipients, sixth edition", , 1 January 2009 (2009-01-01), page 122-126, 262-267; 286-288, 298-300, 326-329, 525-5, XP055972578, Retrieved from the Internet: URL:https://adiyugutama.files.wordpress.com/2012/03/handbook-of-pharmaceutical-excipients-6th-ed.pdf [retrieved on 2022-10-18] CHI L LI ET AL: "The use of hypromellose in oral drug delivery", JOURNAL OF PHARMACY AND PHARMACOLOGY : JPP, JOHN WILEY & SONS LTD, LONDON, GB, vol. 57, no. 5, 1 May 2005 (2005-05-01), pages 533-546, XP002693776, ISSN: 0022-3573, DOI: 10.1211/0022357055957 [retrieved on 2010-02-18] JAIN ARUN KUMAR ET AL: "The influence of hydroxypropyl methylcellulose (HPMC) molecular weight, concentration and effect of food on in vivo erosion behavior of HPMC matrix tablets", JOURNAL OF CONTROLLED RELEASE, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 187, 10 May 2014 (2014-05-10), pages 50-58, XP028860086, ISSN: 0168-3659, DOI: 10.1016/J.JCONREL.2014.04.058

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 omfattende Tapentadol for oral administrering to ganger daglig;

hvor Tapentadol er til stede som et salt med fosforsyre, som er en krystallinsk form og/eller amorf form av dihydrogenfosfatsaltet av Tapentadol, et solvat, et ansolvat og/eller en polymorf derav;

hvor vektequivivalentdosen av Tapentadol som inneholdes i den farmasøytiske doseringsformen er innen området fra 10 til 300 mg basert på den frie basen av Tapentadol;

hvor doseringsformen er en tablett;

hvor doseringsformen tilveiebringer forlenget frigjøring av Tapentadol; og

hvor Tapentadol er innebygd i en matriks med forlenget frigjøring omfattende et matriksmateriale med forlenget frigjøring valgt fra hydroksypropylmetylcellulose (HPMC).

2. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge krav 1, hvor tablettene er monolittiske.

3. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor tablettene har en bruddstyrke på minst 100 N, bestemt i henhold til Ph. Eur. 2.9.8.

4. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor vektequivivalentdosen av Tapentadol som inneholdes i den farmasøytiske doseringsformen utgjør 25 mg, 50 mg eller 100 mg, i hvert tilfelle i forhold til den frie basen av Tapentadol; og hvor doseringsformen har en totalvekt innen området fra 150 til 750 mg.

5. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor vektequivivalentdosen av Tapentadol som inneholdes i den farmasøytiske doseringsformen utgjør 150 mg, 200 mg eller 250 mg, i hvert tilfelle basert på den frie basen av Tapentadol; og hvor doseringsformen har en totalvekt innen området fra 300 til 1200 mg.

6. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori innholdet av matriksmateriale med forlenget frigjøring er innen området 15 ± 10 vekt-%, eller 20 ± 10 vekt-% eller 25 ± 10 vekt-%, eller 30 ± 10 vekt-%, eller 35 ± 10 vekt-%, eller 40 ± 10 vekt-%, eller 45 ± 10 vekt-%, eller 50 ± 10 vekt-%, eller 55 ± 10 vekt-%, eller 60 ± 10 vekt-%, eller 65 ± 10 vekt-%, eller 70 ± 10 vekt-%, eller 75 ± 10 vekt-% eller 80 ± 10 vekt-%, i hvert tilfelle i forhold til totalvekten av doseringsformen.

7. Den farmasøytiske doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse i behandlingen av smerte.

8. Den farmasøytiske doseringsformen for anvendelse ifølge krav 7, hvori doseringsformen administreres oralt.

9. Den farmasøytiske doseringsformen for anvendelse ifølge krav 7 eller 8, hvori doseringsformen administreres to ganger daglig.

10. Den farmasøytisk doseringsformen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 9, som, etter oral administrering tilveiebringer plasmanivåer av Tapentadol som tilveiebringer smertelindring i en varighet på minst 6 timer.

11. Den farmasøytiske doseringsformen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 10, hvori smerten er kronisk smerte.

12. Fremgangsmåte for fremstillingen av en farmasøytisk doseringsform ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, fremgangsmåten omfattende trinnene:

(a) tilveiebringelse av en blanding som inneholder hovedsakelig den totale mengden av Tapentadol som skal inneholdes i doseringsformen og minst ett matriksmateriale med forlenget frigjøring valgt fra hydroksypropylmetylcellulose (HPMC), eventuelt sammen med ett eller flere hjelpestoffer;

(b) eventuelt granulering av blandingen tilveiebrakt i trinn (a), for derved å oppnå et granulat;

(c) eventuelt blanding av granulatet oppnådd i trinn (b) med ett eller flere hjelpestoffer, for derved å oppnå en granulatblanding;

- (d) komprimering av blandingen tilveiebrakt i trinn (a) eller granulatet oppnådd i trinn (b) eller granulatblandingen oppnådd i trinn (c) til tabletter;
- (e) eventuelt filmbelegging av tablettene komprimert i trinn (d).

13. Fremgangsmåten ifølge krav 12, hvori komprimering i trinn (d) utføres med en kompresjonskraft på ikke mer enn 20 kN, mer foretrukket ikke mer enn 15 kN, enda mer foretrukket ikke mer enn 10 kN, enda mer foretrukket ikke mer enn 9,5 kN, enda mer foretrukket ikke mer enn 9,0 kN, mest foretrukket ikke mer enn 8,75 kN og spesielt ikke mer enn 8,5 kN.