



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2020122405, 07.12.2018

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
08.12.2017 ДК РА 2017 70926

(43) Дата публикации заявки: 13.01.2022 Бюл. № 2

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 08.07.2020(86) Заявка РСТ:
ДК 2018/050336 (07.12.2018)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2019/110073 (13.06.2019)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

ФЕРТИН ФАРМА А/С (ДК)

(72) Автор(ы):

**НИЛЬСЕН, Бруно Провстгор (ДК),
НИЛЬСЕН, Кент Альбин (ДК)**(54) **ТВЕРДЫЙ ПЕРОРАЛЬНЫЙ НИКОТИНОВЫЙ СОСТАВ**

(57) Формула изобретения

1. Твердый пероральный никотиновый состав для быстрого наступления ослабления тяги к никотину, содержащий никотин и регулирующий рН агент, в котором состав предназначен для высвобождения содержания никотина в течение периода 90 секунд при взаимодействии со слюной ротовой полости и состав предназначен для высвобождения содержания регулирующего рН агента в течение периода 60 секунд при взаимодействии со слюной ротовой полости.

2. Твердый пероральный никотиновый состав по п.1, в котором состав содержит никотин в количестве, по меньшей мере, 0,5 мг.

3. Твердый пероральный никотиновый состав по п.1 или 2, в котором состав предназначен для высвобождения содержания никотина в течение периода 60 секунд при взаимодействии со слюной ротовой полости.

4. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-3, в котором состав предназначен для высвобождения содержания никотина в течение периода от 10 до 40 секунд при взаимодействии со слюной ротовой полости.

5. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-4, в котором состав содержит указанный регулирующий рН агент в количестве, по меньшей мере, 2,7% состава.

6. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-5, в котором состав предназначен для высвобождения содержания регулирующего рН агента в течение

периода 40 секунд при взаимодействии со слюной ротовой полости.

7. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-6, в котором содержание регулирующего рН агента высвобождается до содержания никотина.

8. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-7, в котором, по меньшей мере, 50 мас.% содержания регулирующего рН агента высвобождается до 50 мас.% содержания никотина.

9. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-8, в котором указанный пероральный никотиновый состав предоставлен в перорально распадающейся таблетке.

10. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-9, в котором указанный пероральный никотиновый состав предоставлен в сублингвальной перорально распадающейся таблетке.

11. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-10, в котором состав предназначен для распадаемости в течение периода менее 60 секунд после перорального введения.

12. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-11, в котором состав предназначен для содержания никотина для растворения в слюне в течение периода менее 90 секунд после перорального введения.

13. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-12, в котором указанный пероральный никотиновый состав предоставлен в виде порошкового состава.

14. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-13, в котором указанный пероральный никотиновый состав предоставлен в саше.

15. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-14, в котором указанный никотин предоставлен в виде соли никотина.

16. Твердый пероральный никотиновый состав по п.15, в котором соль никотина выбрана из аскорбата никотина, аспартата никотина, бензоата никотина, монотартрата никотина, битартрата никотина, хлорида никотина (например, гидрохлорида никотина и дигидрохлорида никотина), цитрата никотина, фумарата никотина, гензитата никотина, лактата никотина, муката никотина, лаурата никотина, левулината никотина, малата никотина, перхлората никотина, пирувата никотина, салицилата никотина, сорбата никотина, сукцината никотина, хлорида цинка никотина, сульфата никотина, тозилата никотина и их гидратов (например, хлорида цинка никотина моногидрата).

17. Твердый пероральный никотиновый состав по п.15, в котором соль никотина содержит битартрат никотина.

18. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-14, в котором указанный никотин предоставлен в виде свободного основания никотина.

19. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-14, в котором указанный никотин предоставлен в виде комплекса между никотином и ионообменной смолой.

20. Твердый пероральный никотиновый состав по п.19, в котором указанный комплекс между никотином и ионообменной смолой представляет собой никотин-полиакрилексную смолу (NPR).

21. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-14, в котором указанный никотин предоставлен в комбинации с жирной кислотой.

22. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-14, в котором указанный никотин предоставлен в ионном комплексе, по меньшей мере, с одним мукоадгезивным водорастворимым анионным полимером.

23. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-22, в котором указанный никотин предоставлен в виде синтетического никотина.

24. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-23, в котором

состав предоставляет пиковую концентрацию никотина в слюне более 0,3 мг/мл и пиковый рН в слюне более 8 в течение первых 120 секунд после перорального введения.

25. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-24, в котором состав предоставляет пиковую концентрацию никотина в слюне более 0,5 мг/мл и пиковый рН в слюне более 8 в течение первых 120 секунд после перорального введения.

26. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-25, в котором состав предназначен для содержания никотина для растворения в слюне ротовой полости в течение периода менее 90 секунд после перорального введения и в котором, по меньшей мере, 40 мас.% никотина всасывается через слизистую оболочку ротовой полости.

27. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-26, в котором состав предназначен для содержания никотина для растворения в слюне ротовой полости в течение периода менее 90 секунд после перорального введения и в котором, по меньшей мере, 50 мас.% никотина всасывается через слизистую оболочку ротовой полости.

28. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-27, в котором указанный состав дополнительно содержит дезинтегрант.

29. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-28, в котором состав содержит дезинтегрант в количестве 1-10 мас.% состава.

30. Твердый пероральный никотиновый состав по п.28 или 29, в котором дезинтегрант выбран из крахмала, предварительно желатинизированного крахмала, модифицированного крахмала (включая картофельный крахмал, кукурузный крахмал, крахмал 1500, натрия крахмала гликолят и производные крахмала), целлюлозы, микрокристаллической целлюлозы, альгинатов, ионообменной смолы и супердезинтегрантов, таких как сшитая целлюлоза (такая как натрий карбоксиметилцеллюлоза), сшитый поливинилпирролидон (ПВП), сшитый крахмал, сшитая альгиновая кислота, природные супердезинтегранты и силикат кальция, и их комбинаций.

31. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.28-30, в котором дезинтегрант содержит сшитый поливинилпирролидон.

32. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.28-31, в котором, по меньшей мере, 50 мас.% сшитого поливинилпирролидона имеет размер частиц менее 50 микрометров.

33. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.28-32, в котором, по меньшей мере, 25 мас.% сшитого поливинилпирролидона имеет размер частиц менее 15 микрометров.

34. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-33, в котором твердый пероральный никотиновый состав предоставлен в виде таблетки, имеющей массу от 25 до 200 мг, такую как от 50 до 150 мг, такую как 70-120 мг, такую как приблизительно 75 мг или приблизительно 100 мг.

35. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-33, в котором твердый пероральный никотиновый состав предоставлен в виде порошкового состава в количестве от 100 до 800 мг, таком как от 200 до 600 мг, таком как приблизительно 400 мг.

36. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-35, в котором состав содержит стеарилфумарат натрия (SSF) в качестве скользящего вещества.

37. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-36, в котором состав содержит микрокристаллическую целлюлозу в количестве 1-10 мас.% состава.

38. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-37, в котором состав содержит маннит в качестве объемного подсластителя.

39. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.1-38, в котором композиция дополнительно содержит количество нерастворимой композиции.

40. Твердый пероральный никотиновый состав по п.39, в котором нерастворимая композиция содержит, по меньшей мере, один, выбранный из двухосновного фосфата кальция, карбоната кальция DC, моно-, диглицеридного порошка, гидрогенизированного растительного масла и их комбинаций.

41. Твердый пероральный никотиновый состав по любому из пп.39-40, в котором количество нерастворимой композиции составляет от 5 до 50 мас.% состава, такое как от 10 до 30 мас.% состава.

42. Твердый пероральный никотиновый состав для применения для ослабления тяги к никотину, содержащий никотин и регулирующий рН агент, в котором состав предназначен для высвобождения содержания никотина в течение периода 90 секунд при взаимодействии со слюной ротовой полости и состав предназначен для высвобождения содержания регулирующего рН агента в течение периода 60 секунд при взаимодействии со слюной ротовой полости.

43. Твердый пероральный никотиновый состав по п.42 и любому из пп.1-41 для применения для ослабления тяги к никотину.

44. Способ ослабления тяги к никотину с помощью введения эффективного количества указанного твердого перорального никотинового состава по любому из пп.1-43.

45. Саше для ротовой полости, содержащее порошковую композицию по любому из пп.1-43.

46. Саше для ротовой полости по п.45, в котором саше содержит порошковую композицию в количестве от 100 до 800 мг, таком как от 200 до 600 мг, таком как приблизительно 400 мг.