

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 18 年 6 月 29 日 (2006.6.29)

【公表番号】特表 2006-503046 (P2006-503046A)

【公表日】平成 18 年 1 月 26 日 (2006.1.26)

【年通号数】公開・登録公報 2006-004

【出願番号】特願 2004-536596 (P2004-536596)

【国際特許分類】

**A 6 1 K 47/26 (2006.01)**

**A 6 1 K 9/20 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/465 (2006.01)**

**A 6 1 K 47/10 (2006.01)**

**A 6 1 K 47/36 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/34 (2006.01)**

【F I】

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 31/465

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/36

A 6 1 P 25/34

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 5 月 11 日 (2006.5.11)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

a) ガラス状構造を形成可能な少なくとも 1 種の実質的に非吸湿性の糖アルコールを含むガラス状マトリックス；

b) 該ガラス状マトリックスの所望の口内溶解速度を得るのに十分な量の水溶性ゲル化ガム；および

c) 活性剤

を含む、該活性剤の経粘膜的な経口投与に有用な経口固形製剤。

【請求項 2】

前記活性剤が、薬剤、風邪薬、咳止め薬、喉薬、ビタミン、亜鉛、メントール、ユーカリ、ヘキシルレゾルシノール、カフェイン、歯用ホワイティング剤、歯垢防止剤、口臭清涼剤およびニコチンからなる群より選択される 1 種以上のものである、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 3】

前記活性剤がニコチン活性剤である、請求項 2 に記載の製剤。

【請求項 4】

前記水溶性ゲル化ガムが、キサンタンガム、グアーガム、アラビアゴム、アルギン酸塩およびカラギーナンからなる群より選択される 1 種以上のものである、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 5】

前記ガムがキサンタンガムである、請求項 4 に記載の製剤。

【請求項 6】

前記溶解速度が、前記ニコチンの少なくとも 50% を胃内に取り込まれる前に口腔粘膜を介して送達させるのに十分な速度である、請求項 3 に記載の製剤。

【請求項 7】

前記ニコチンの少なくとも 75% が口腔粘膜を介して送達される、請求項 6 に記載の製剤。

【請求項 8】

前記ガムが、前記製剤を約 10～15 分間にわたって口内で溶解させるのに十分な量で存在する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 9】

前記ガムが、約 0.5～約 5.0 重量 % の量で存在する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 10】

前記ガムが、約 1.0～約 4.0 重量 % の量で存在する、請求項 9 に記載の製剤。

【請求項 11】

前記ガムが、約 1.0～約 3.5 重量 % の量で存在する、請求項 10 に記載の製剤。

【請求項 12】

前記糖アルコールが、約 99:1～約 1:99 の重量比で 1,6-GPS(6-O-β-D-グルコピラノシル-D-ソルビトール)および 1,1-GPM(1-O-β-D-グルコピラノシル-D-マンニトール)の混合物を含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 13】

製剤の重量に基づき少なくとも約 50% の糖アルコールを含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 14】

製剤の重量に基づき少なくとも約 70% の糖アルコール混合物を含む、請求項 13 に記載の製剤。

【請求項 15】

製剤の重量に基づき少なくとも約 85% の糖アルコール混合物を含む、請求項 14 に記載の製剤。

【請求項 16】

前記ニコチン活性剤が、ニコチン、ニコチン誘導体、およびそれらの組合せから選択される、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 17】

前記ニコチン活性剤が、ニコチン油、重酒石酸ニコチン、ニコチン・ポラクリレックス(nicotine polacrilex)、およびそれらの組合せから選択される、請求項 16 に記載の製剤。

【請求項 18】

前記ニコチン活性剤を投薬量単位当たり約 0.5 mg～約 5 mg 含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 19】

前記糖アルコールが、約 70:30～約 30:70 の重量比で 1,6-GPS および 1,1-GPM の混合物を含む、請求項 12 に記載の製剤。

【請求項 20】

前記糖アルコールが、約 60:40～約 40:60 の重量比で 1,6-GPS および 1,1-GPM の混合物を含む、請求項 12 に記載の製剤。

【請求項 21】

前記糖アルコール混合物がイソマルト (ISOMALT) である、請求項 12 に記載の製剤。

【請求項 22】

アルカリ性の口内唾液 pH を得るのに有効な量の緩衝剤をさらに含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 23】

前記緩衝剤が、炭酸ナトリウム、重炭酸ナトリウム、炭酸カルシウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、二塩基性リン酸ナトリウム、三塩基性リン酸ナトリウム、二塩基性リン酸カリウム、三塩基性リン酸カリウム、およびそれらの組合せから選択される、請求項 2 に記載の製剤。

【請求項 2 4】

前記緩衝剤が、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよびそれらの組合せから選択される、請求項 2 3 に記載の製剤。

【請求項 2 5】

前記ガラス状マトリックスが、製剤の重量に基づき約 1 % ~ 約 20 % のショ糖、ソルビトールおよびキシリトールからなる群より選択される 1 つ以上の化合物をさらに含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 2 6】

急速なニコチン渴望緩和を得るのに有効な感覚信号をもたらす非薬理学的成分をさらに含む、請求項 3 に記載の製剤。

【請求項 2 7】

ロゼンジの形態である、請求項 3 に記載の製剤。

【請求項 2 8】

ニコチン活性剤の経粘膜的な経口投与に有用な経口固形製剤であって、製剤の経口投与の開始後に少なくとも約 6 ng/ml のニコチン活性剤血漿濃度をもたらす、製剤。

【請求項 2 9】

ニコチン活性剤の経粘膜的な経口投与に有用な経口固形製剤であって、製剤の経口投与の開始後に約 6 ng/ml ~ 約 35 ng/ml の持続したニコチン活性剤血漿濃度をもたらす、製剤。