

【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】令和 4 年 1 月 4 日 (2022.1.4)

【公表番号】特表 2021-505546 (P2021-505546A)

【公表日】令和 3 年 2 月 18 日 (2021.2.18)

【年通号数】公開・登録公報 2021-008

【出願番号】特願 2020-529346 (P2020-529346)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/455 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 31/455

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/30

A 6 1 P 25/30

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/26

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 11 月 19 日 (2021.11.19)

【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】

経口投与して 60 秒未満の期間内に崩壊するように設計され、或る量のニコチンと、pH 調節剤と、少なくとも 1 つのポリオールと、崩壊剤とを含む圧縮粉末製剤を備えるニコチン渴望軽減用の口腔内崩壊ニコチン錠であって、

前記ポリオールは、前記錠の 40 重量%より多い量であり、

前記錠が、前記錠の 1 ~ 10 重量%の量で前記崩壊剤を含む、前記口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 2】

前記少なくとも 1 つのポリオールは、ソルビトール、エリスリトール、キシリトール、マルチトール、マンニトール、ラクチトール、イソマルトおよびそれらの組み合わせからなるリストから選択される、請求項 1 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 3】

前記 pH 調節剤は、アルカリ性緩衝剤である、請求項 1 または 2 に記載の口腔内崩壊ニ

コチン錠。

【請求項 4】

経口投与して 30 秒未満の期間内に崩壊するように設計される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 5】

経口投与して 90 秒未満の期間内にニコチンの含有量が唾液中に溶解するように設計される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 6】

ニコチンを少なくとも 0.5 mg の量で含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 7】

前記ニコチンはニコチン塩として用意される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 8】

前記ニコチン塩はニコチン重酒石酸塩である、請求項 7 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 9】

前記ニコチンは、ニコチンとイオン交換樹脂との複合体として用意される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 10】

前記ニコチンは脂肪酸と会合したものとして用意される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 11】

前記ニコチンは少なくとも 1 つの粘膜付着性かつ水溶性のアニオン性ポリマーとのイオン複合体で用意される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 12】

舌下錠である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 13】

2 ~ 20 kN の圧力でプレスされたものである、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 14】

前記製剤は、経口投与して最初の 120 秒間に 0.3 mg / mL を超えるニコチンの唾液中ピーク濃度と 8 を超えるピーク唾液 pH とを与える、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 15】

前記崩壊剤は架橋ポリビニルピロリドンを含む、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 16】

前記架橋ポリビニルピロリドンの少なくとも 50 重量%が 50 マイクロメートル未満の粒子サイズを有する、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 17】

前記錠は、前記錠の少なくとも 2.7 重量パーセントの量で pH 調節剤を含む、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 18】

前記錠の重量は、25 ~ 200 mg である、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 19】

前記錠は、前記錠の 1 ~ 10 重量%の量の微結晶性セルロースを含む、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 20】

前記錠は、バルク甘味料としてマンニトールを含む、請求項 1 ～ 19 のいずれか一項に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【請求項 21】

ニコチン渴望の緩和に使用するための口腔内崩壊ニコチン錠であって、前記錠は、圧縮粉末製剤を備え、前記錠は、経口投与して 60 秒未満の期間内に崩壊するように設計され、前記粉末製剤は、或る量のニコチンと pH 調節剤とを含む、口腔内崩壊ニコチン錠。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0170

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0170】

表 10 からわかるように、市販製品と比較して大幅に速い緩和が得られた。

【付記 1】経口投与して 60 秒未満の期間内に崩壊するように設計され、或る量のニコチンと pH 調節剤とを含む圧縮粉末製剤を備えるニコチン渴望軽減用の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 2】経口投与して 45 秒未満の期間内に崩壊するように設計される、付記 1 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 3】経口投与して 30 秒未満の期間内に崩壊するように設計される、付記 1 または 2 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 4】経口投与して 90 秒未満の期間内にニコチンの含有量が唾液中に溶解するように設計される、付記 1 ～ 3 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 5】経口投与して 60 秒未満の期間内にニコチンの含有量が唾液中に溶解するように設計される、付記 1 ～ 4 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 6】経口投与して 45 秒未満の期間内にニコチンの含有量が唾液中に溶解するように設計される、付記 1 ～ 5 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 7】ニコチンを少なくとも 0.5 mg の量で含む、付記 1 ～ 6 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 8】ニコチンを 0.5 mg ～ 4 mg の間の量で含む、付記 1 ～ 7 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 9】前記ニコチンはニコチン塩として用意される、付記 1 ～ 8 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 10】前記ニコチン塩は水溶性ニコチン塩である、付記 9 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 11】前記ニコチン塩は、ニコチンアスコルビン酸塩、ニコチンアスパラギン酸塩、ニコチン安息香酸塩、ニコチンモノ酒石酸塩、ニコチン重酒石酸塩、ニコチン塩化物（例えば、ニコチン塩酸塩およびニコチン二塩酸塩）、ニコチンクエン酸塩、ニコチンフマル酸塩、ニコチンゲンチン酸塩、ニコチン乳酸塩、ニコチン粘液酸塩、ニコチンラウリン酸塩、ニコチンレブリン酸塩、ニコチンリンゴ酸塩、ニコチン過塩素酸塩、ニコチンピルビン酸塩、ニコチンサリチル酸塩、ニコチンソルビン酸塩、ニコチンコハク酸塩、ニコチン塩化亜鉛、ニコチン硫酸塩、ニコチントシラート、およびニコチン塩水和物（例えば、ニコチン亜鉛一水和物）から選択される、付記 10 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 12】前記ニコチン塩はニコチン重酒石酸塩である、付記 10 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 13】前記ニコチンは、ニコチンとイオン交換樹脂との複合体として用意される、付記 1 ～ 12 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 14】ニコチンとイオン交換樹脂との前記複合体はニコチンポラクリレックス樹脂（NPR）である、付記 13 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

【付記 15】前記ニコチンは脂肪酸と会合したものとして用意される、付記 1 ～ 8 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 1 6] 前記ニコチンは少なくとも 1 つの粘膜付着性かつ水溶性のアニオン性ポリマーとのイオン複合体で用意される、付記 1 ~ 8 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 1 7] 前記ニコチンは合成ニコチンとして用意される、付記 1 ~ 1 6 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 1 8] 舌下錠である、付記 1 ~ 1 7 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 1 9] 前記圧縮粉末は少なくとも 1 つのポリオールを含み、前記ポリオールは、前記錠の 4 0 重量 % より多い量である、付記 1 ~ 1 8 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 0] 2 ~ 2 0 k N の圧力でプレスされたものである、付記 1 ~ 1 9 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 1] 前記製剤は、経口投与して最初の 1 2 0 秒間に 0 . 3 m g / m L を超えるニコチンの唾液中ピーク濃度と 8 を超えるピーク唾液 p H とを与える、付記 1 ~ 2 0 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 2] 前記製剤は、経口投与して最初の 1 2 0 秒間に 0 . 5 m g / m L を超えるニコチンの唾液中ピーク濃度と 8 を超えるピーク唾液 p H とを与える、付記 1 ~ 2 1 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 3] 前記製剤は、経口投与して 9 0 秒未満の期間内にニコチンの含有量が口腔唾液に溶解するように設計され、ニコチンの少なくとも 4 0 重量 % が口腔粘膜から吸収される、付記 1 ~ 2 2 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 4] 前記製剤は、経口投与して 9 0 秒未満の期間内にニコチンの含有量が口腔唾液に溶解するように設計され、ニコチンの少なくとも 5 0 重量 % が口腔粘膜から吸収される、付記 1 ~ 2 3 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 5] 前記錠は崩壊剤をさらに含む、付記 1 ~ 2 4 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 6] 前記崩壊剤は架橋ポリビニルピロリドンを含む、付記 1 ~ 2 5 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 7] 前記架橋ポリビニルピロリドンの少なくとも 5 0 重量 % が 5 0 マイクロメートル未満の粒子サイズを有する、付記 1 ~ 2 6 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 8] 前記架橋ポリビニルピロリドンの少なくとも 2 5 重量 % が 1 5 マイクロメートル未満の粒子サイズを有する、付記 1 ~ 2 7 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 2 9] 前記錠が、前記錠の 1 ~ 1 0 重量 % の量で崩壊剤を含む、付記 1 ~ 2 8 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 0] 前記錠が滑沢剤としてフマル酸ステアリルナトリウム (S S F) を含む、付記 1 ~ 2 9 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 1] 前記錠は、前記錠の少なくとも 2 . 7 重量パーセントの量で p H 調節剤を含む、付記 1 ~ 3 0 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 2] 前記錠の重量は、2 5 ~ 2 0 0 m g 、例えば 5 0 ~ 1 5 0 m g 、例えば 7 0 ~ 1 2 0 m g 、例えば約 7 5 m g または約 1 0 0 m g である、付記 1 ~ 3 1 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 3] 前記錠は、前記錠の 1 ~ 1 0 重量 % の量の微結晶性セルロースを含む、付記 1 ~ 3 2 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 4] 前記錠は、バルク甘味料としてマンニトールを含む、付記 1 ~ 3 3 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 5] 前記錠は、圧縮粉末製剤を備え、前記錠は、経口投与して 6 0 秒未満の期間内に崩壊するように設計され、前記粉末製剤は、或る量のニコチン塩と p H 調節剤とを含み、前記錠は、経口投与して 9 0 秒未満の期間内にニコチンの含有量が唾液に溶解する

ように設計される、付記 1 ~ 3 4 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 6] 前記錠は、圧縮粉末製剤を備え、前記錠は、経口投与して 6 0 秒未満の期間内に崩壊するように設計され、前記粉末製剤は、或る量のニコチン塩と p H 調節剤とを含み、前記錠は、経口投与して 9 0 秒未満の期間内にニコチンの含有量が唾液に溶解するように設計され、前記ニコチン塩が水溶性である、付記 1 ~ 3 5 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 7] ニコチン渴望の緩和に使用するための口腔内崩壊ニコチン錠であって、前記錠は、圧縮粉末製剤を備え、前記錠は、経口投与して 6 0 秒未満の期間内に崩壊するように設計され、前記粉末製剤は、或る量のニコチンと p H 調節剤とを含む、口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 8] 前記錠は、圧縮粉末製剤を備え、前記錠は、経口投与して 6 0 秒未満の期間内に崩壊するように設計され、前記圧縮粉末製剤は或る量のニコチン塩と p H 調節剤とを含み、前記錠は、経口投与して 9 0 秒未満の時間内にニコチン含有量が溶解するように設計され、ニコチン渴望の緩和に使用するための圧縮粉末製剤を含む、付記 3 7 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 3 9] 付記 1 ~ 3 6 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊錠を備える、ニコチン渴望の緩和に使用するための付記 3 7 または 3 8 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 4 0] 付記 1 ~ 3 6 のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠を投与することによってニコチン渴望を緩和する方法。