

【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

コチニン錠。

【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ニン錠。

【請求項 5】

経口投与して 90 秒未満の期間内にニコチニ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ニン錠。

【請求項 6】

ニコチニンを少なくとも 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ニン錠。

【請求項 7】

前記ニコチニンはニコチニ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ニン錠。

【請求項 8】

前記ニコチニン塩はニコチニ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ニン錠。

【請求項 9】

前記ニコチニンは、ニコチニ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ニン錠。

【請求項 10】

前記ニコチニ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ニン錠。

【請求項 11】

前記ニコチニンは少なくとも 1 つの粘膜付着性かつ水溶性のアニオニ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ニン錠。

【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ニン錠。

【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ニン錠。

【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 を超えるニコチニ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ニン錠。

【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ニン錠。

【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ニン錠。

【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ニン錠。

【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ニン錠。

【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ニン錠。

【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、ニコチニアスコルビン酸塩、ニコチニアスパラギン酸塩、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）、ニコチングエン酸塩、ニコチングマル酸塩、ニコチングエンチ酸塩、ニコチング乳酸塩、ニコチング粘液酸塩、ニコチングラウリノ酸塩、ニコチングレブリン酸塩、ニコチングリンゴ酸塩、ニコチング過塩素酸塩、ニコチングルビン酸塩、ニコチングアリチル酸塩、ニコチングソルビン酸塩、ニコチングコハク酸塩、ニコチング塩化亜鉛、ニコチング硫酸塩、ニコチントシラート、およびニコチング塩水和物（例えば、ニコチング塩水和物）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グ重酒石酸塩である、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、ニコチング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] ニコチングイオン交換樹脂との前記複合体はニコチングラクリレックス樹脂（N P R）である、付記 13 に記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記 15] 前記ニコチング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16] 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17] 前記ニコチンは合成ニコチンとして用意される、付記1～16のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記18] 舌下錠である、付記1～17のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記19] 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40重量%より多い量である、付記1～18のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記20] 2～20kNの圧力でプレスされたものである、付記1～19のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記21] 前記製剤は、経口投与して最初の120秒間に0.3mg/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、付記1～20のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記22] 前記製剤は、経口投与して最初の120秒間に0.5mg/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、付記1～21のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記23] 前記製剤は、経口投与して90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40重量%が口腔粘膜から吸収される、付記1～22のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記24] 前記製剤は、経口投与して90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50重量%が口腔粘膜から吸収される、付記1～23のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記25] 前記錠は崩壊剤をさらに含む、付記1～24のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記26] 前記崩壊剤は架橋ポリビニルピロリドンを含む、付記1～25のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記27] 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、付記1～26のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記28] 前記架橋ポリビニルピロリドンの少なくとも25重量%が15マイクロメートル未満の粒子サイズを有する、付記1～27のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記29] 前記錠が、前記錠の1～10重量%の量で崩壊剤を含む、付記1～28のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記30] 前記錠が滑沢剤としてフマル酸ステアリルナトリウム(SSF)を含む、付記1～29のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記31] 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、付記1～30のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記32] 前記錠の重量は、25～200mg、例えば50～150mg、例えば70～120mg、例えば約75mgまたは約100mgである、付記1～31のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記33] 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、付記1～32のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記34] 前記錠は、バルク甘味料としてマンニトールを含む、付記1～33のいずれか一つに記載の口腔内崩壊ニコチン錠。

[付記35] 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、或る量のニコチン塩とpH調節剤とを含み、前記錠は、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 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、或る量のニコチン塩と pH 調節剤とを含み、前記錠は、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 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。

[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 60 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 pH 調節剤とを含み、前記錠は、経口投与して 90 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。