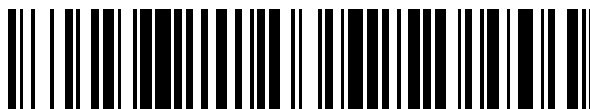


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 952 674**

51 Int. Cl.:

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 47/18 (2007.01)

A61K 9/14 (2006.01)

A61K 31/465 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **08.12.2016 PCT/IB2016/057452**

87 Fecha y número de publicación internacional: **29.06.2017 WO17109625**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **08.12.2016 E 16812864 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.07.2023 EP 3393451**

54 Título: **Polvo de nicotina saborizada**

30 Prioridad:

24.12.2015 EP 15202728

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

03.11.2023

73 Titular/es:

**PHILIP MORRIS PRODUCTS S.A. (100.0%)
Quai Jeanrenaud 3
2000 Neuchâtel, CH**

72 Inventor/es:

ZUBER, GERARD

74 Agente/Representante:

FERNÁNDEZ POU, Felipe

ES 2 952 674 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Polvo de nicotina saborizada

- 5 Esta descripción se refiere a sistemas de polvos que comprenden partículas de nicotina y partículas saborizantes, en los que las partículas saborizantes son mayores que las partículas de nicotina.

10 Los inhaladores de polvo seco (DPI) se conocen y se usan para tratar enfermedades respiratorias suministrando un polvo seco que comprende un producto farmacéutico, en forma de aerosol a través de la inhalación hacia las vías aéreas del paciente. Para la entrada en los pulmones, se prefieren partículas en el intervalo de 1 a 5 micrómetros. En polvos secos farmacéuticos, el ingrediente farmacéutico activo (API) puede aglomerarse en la superficie de partículas portadoras más grandes, tales como la lactosa. Los DPI operan mecanismos complejos para garantizar que tales aglomerados se dispersen, se descomponen o se desagreguen antes de que el API pueda inhalarse hacia los pulmones. Los polvos secos farmacéuticos que contienen lactosa como portador pueden estar en el intervalo de 15 20 a 100 micrómetros.

20 Los DPI dependen de la fuerza de la inhalación del paciente para arrastrar el polvo desde el dispositivo, para dividir subsecuentemente el polvo en partículas que son lo suficientemente pequeñas para entrar en los pulmones. Se requieren velocidades de inhalación lo suficientemente altas para establecer la dosis correcta y la desintegración completa del polvo. Típicamente una cantidad grande de API se mantiene unida a la superficie del portador y se deposita en las vías aéreas superiores debido a una desagregación completa del polvo. Las velocidades de inhalación de los DPI existentes suelen estar en el intervalo de 20-100 litros/min (l/min). Los DPI existentes son por lo tanto solamente adecuados para suministrar polvos secos a los usuarios de una manera que es diferente a la velocidad de inhalación asociada con los artículos para fumar.

25 El documento WO-A-2015/166350 describe un inhalador de polvo de nicotina que comprende un receptáculo de polvo de nicotina y un elemento de suministro de sabor. El receptáculo de polvo de nicotina comprende una dosis de polvo de nicotina que puede inhalarse en los pulmones de un usuario a una velocidad de inhalación de menos de aproximadamente 5 l/min.

30 Sería conveniente proporcionar un sistema de polvos estable que proporcione partículas de nicotina a los pulmones de un usuario y partículas saborizantes a preferentemente la cavidad bucal o bucal de un usuario. Es conveniente que los tamaños relativos de partículas de la nicotina y el sabor permanezcan estables incluso cuando se combinan entre sí. Es conveniente suministrar este sistema de polvos estables a un usuario a velocidades de inhalación por el usuario o de flujo de aire que estén dentro de las velocidades de inhalación por el usuario o de flujo de aire del régimen convencional para fumar.

35 Un sistema de polvos incluye una primera pluralidad de partículas que tienen un diámetro aerodinámico mediano de masa de 5 micrómetros o menos, la primera pluralidad de partículas comprende partículas de nicotina, las partículas de nicotina comprenden partículas de sal de nicotina recubiertas, en donde el material de recubrimiento es L-leucina, y una segunda pluralidad de partículas que tienen un diámetro aerodinámico mediano de masa en un intervalo de 50 micrómetros a 150 micrómetros y comprenden sabor. La primera pluralidad de partículas es del 50 % en peso al 99 % en peso y la segunda pluralidad es del 1 % en peso al 50 % en peso del peso total del sistema de polvos, y la primera pluralidad de partículas y la segunda pluralidad de partículas constituyen al menos el 99 % en peso del sistema de polvos. Las partículas del sistema de polvos son preferentemente de flujo libre.

40 El sistema de polvos puede tener al menos un 60 % en peso de la nicotina del sistema de polvos comprendida en partículas con un tamaño de partícula de aproximadamente 5 micrómetros o menos. El sistema de polvos puede tener al menos un 80 % en peso de la nicotina del sistema de polvos comprendida en partículas con un tamaño de partícula de aproximadamente 5 micrómetros o menos. El sistema de polvos puede tener al menos un 90 % en peso de la nicotina del sistema de polvos comprendida en partículas con un tamaño de partícula de aproximadamente 5 micrómetros o menos.

45 El sistema de polvos puede tener al menos aproximadamente 40 % en peso de la nicotina del sistema de polvos comprendida en partículas con un tamaño de aproximadamente 1 micrómetro a aproximadamente 3 micrómetros o menos. El sistema de polvos puede tener al menos aproximadamente un 60 % en peso de la nicotina del sistema de polvos comprendida en partículas con un tamaño de aproximadamente 1 micrómetro a aproximadamente 3 micrómetros o menos. El sistema de polvos puede tener al menos aproximadamente un 80 % en peso de la nicotina del sistema de polvos comprendida en partículas con un tamaño de aproximadamente 1 micrómetro a aproximadamente 3 micrómetros o menos. El sistema de polvos puede tener al menos aproximadamente el 90 % en peso de la nicotina del sistema de polvos comprendida en partículas con un tamaño de aproximadamente 1 micrómetro a aproximadamente 3 micrómetros o menos.

50 El tamaño de una partícula, como se indica en la presente descripción, se refiere preferentemente al diámetro aerodinámico de la partícula. El diámetro aerodinámico de un sistema de polvos se mide preferentemente con un impactador en cascada.

Ventajosamente, el sistema de polvos descrito en la presente descripción proporciona un sistema de polvos estable y que fluye libremente, que suministra nicotina selectivamente a los pulmones del usuario y saborizante selectivamente a la boca del usuario. Ventajosamente, el sistema de polvos descrito en la presente descripción posee preferentemente un tamaño de partículas relativo estable de cada componente del polvo, incluso cuando se combinan las partículas de nicotina y las partículas saborizantes. Ventajosamente, un inhalador que utiliza este sistema de polvos puede no necesitar reducir el tamaño de las partículas de polvo y puede suministrar el sistema de polvos a velocidades de flujo de aire o inhalación que están dentro de las velocidades de flujo de aire o inhalación del régimen convencional de fumar.

El término "nicotina" se refiere a sales de nicotina.

El término "saborizante" o "sabor" se refiere a compuestos, composiciones, o materiales organolépticos que modifican y se pretende que modifiquen las características de sabor o aroma de la nicotina durante su consumo o inhalación. El término "saborizante" o "sabor" se refiere preferentemente a los compuestos descritos en la Biblioteca de Ingredientes de Sabores de la Asociación de Fabricantes de Sabores y Extractos (FEMA) y, en particular, en las publicaciones 3 a 27 de las Sustancias Saborizantes GRAS. Estas publicaciones de la biblioteca de ingredientes de sabor de la FEMA incluyen: GRAS Flavoring Substances 3, Hall, R.L. & Oser, B.L., Food Technology, febrero de 1965 págs. 151-197; GRAS Flavoring Substances 4, Hall, R.L. & Oser, B.L., Food Technology, Vol. 24, Núm. 5 pág. 25-34; GRAS Substances 5, Hall, R.L. y Oser, B.L., Food Technology, 1972 pág. 25-37; GRAS Substances 6, Oser, B.L. y R.A. Ford, Food Technology, Vol. 27, Núm. 1, 1973 págs. 64-67; GRAS Substances 7, Oser, B.L. y R.A. Ford, Food Technology, Vol. 27, Núm. 11, 1973 págs. 56-57; Sustancias GRAS 8, Oser, B.L. y R.A. Ford, Tecnología alimentaria, Septiembre de 1974 págs. 76-80; Sustancias GRAS 9, Oser, B.L. y R.A. Ford, Tecnología alimentaria, Agosto de 1975 págs. 70-72; Sustancias GRAS 10, Oser, B.L. y R.A. Ford, Tecnología alimentaria, Enero de 1977 págs. 65-74; Sustancias GRAS 11, Oser, B.L. y R.A. Ford, Tecnología alimentaria, Febrero de 1978 págs. 60-70; Sustancias GRAS 12, Oser, B.L. y R.A. Ford, Tecnología alimentaria, Julio de 1979 págs. 65-73; Sustancias GRAS 13, Oser, B.L., y otros, Tecnología alimentaria, Octubre de 1984 págs. 66-89; Sustancias GRAS 14, Oser, B.L., y otros, Tecnología alimentaria, Noviembre de 1985 págs. 108-117; Sustancias GRAS 15, Oser, B.L., y otros, Tecnología alimentaria, Febrero de 1990 págs. 78-86; Sustancias GRAS 16, Smith, R.L. y Ford, R.A., Tecnología alimentaria, Junio de 1993 págs. 104-117; Sustancias con sabor a GRAS 17, Smith, y otros, Tecnología alimentaria, Octubre de 1996 págs. 72-81; Sustancias con sabor a GRAS 18, Newberne, P., y otros, Tecnología alimentaria, Vol. 52, Núm. 9, septiembre de 1998 págs. 68-92; GRAS Flavoring Substances 19, Newberne, P., y otros, Food Technology, Vol. 54, Núm. 6, junio de 2000 págs. 66-84; GRAS Flavoring Substances 20, Smith, R.L., et al., Food Technology, Vol. 55, Núm. 12, diciembre de 2001 págs. 34-55; GRAS Flavoring Substances 21, Smith, R.L., y otros, Food Technology, Vol. 57, Núm. 5, Mayo de 2003 págs. 46-59; Sustancias con sabor a GRAS 22, Smith, R.L., y otros, Tecnología alimentaria, Agosto de 2005 págs. 24-62; Sustancias con sabor a GRAS 23, Waddell, W.J., y otros, Tecnología alimentaria, Agosto de 2007 págs. 22-48; Sustancias con sabor a GRAS 24, Smith, R.L., y otros, Tecnología alimentaria, Junio de 2009 págs. 46-105; Sustancias con sabor a GRAS 25, Smith, R.L., y otros, Tecnología alimentaria, Julio de 2011 págs. 44-75; Sustancias con sabor a GRAS 26, Marnett, S.M., y otros, Tecnología alimentaria, Agosto de 2013 págs. 38-56; y sustancias saborizantes GRAS 27 S.M. Cohen y otros, Tecnología alimentaria, agosto de 2015 pág. 40-59. A los efectos de esta descripción, la nicotina no se considera un saborizante o sabor.

Esta descripción se refiere a sistemas de polvos que comprenden partículas de nicotina y partículas saborizantes. El sistema de polvos proporciona partículas de nicotina preferentemente a los pulmones de un usuario y partículas saborizantes preferentemente a la cavidad bucal o bucal de un usuario. Las partículas que comprenden nicotina comprenden además un aminoácido seleccionado de L-leucina y pueden incluir nicotina seleccionada del grupo que consiste en piruvato de nicotina, monopiruvato de nicotina, aspartato de nicotina y lactato de nicotina. Los tamaños relativos de partículas de las partículas que comprenden y las partículas que comprenden sabor permanecen estables incluso cuando se combinan entre sí.

El sistema de polvos puede tener al menos aproximadamente 60 %, o al menos aproximadamente 80 %, en peso de la nicotina del sistema de polvos comprendida en partículas que tienen un tamaño de partícula de aproximadamente 5 micrómetros o menos. El sistema de polvos puede tener al menos aproximadamente un 40 % o al menos aproximadamente 60 %, o al menos aproximadamente 80 %, en peso, de la nicotina del sistema de polvos comprendida en partículas que tienen un tamaño de partícula en un intervalo de aproximadamente 1 micrómetro a aproximadamente 3 micrómetros.

La nicotina es una sal de nicotina farmacéuticamente aceptable o un hidrato de sal de nicotina. Las sales de nicotina o hidratos de sal de nicotina útiles incluyen piruvato de nicotina, citrato de nicotina, aspartato de nicotina, lactato de nicotina, bitartrato de nicotina, salicilato de nicotina, fumarato de nicotina, monopiruvato de nicotina, glutamato de nicotina o hidrocloreto de nicotina, por ejemplo. Entre las sales de nicotina o hidratos de sal de nicotina preferidos se encuentran el piruvato de nicotina, el monopiruvato de nicotina, el aspartato de nicotina o el lactato de nicotina.

El compuesto combinado con nicotina para formar la sal o la sal hidratada puede elegirse en función de su efecto farmacológico esperado. Por ejemplo: el salicilato de nicotina puede administrarse para aliviar la fiebre, como un antiinflamatorio o analgésico; el fumarato de nicotina puede administrarse para tratar esclerosis múltiple; y el

monopiruvato de nicotina puede administrarse para tratar la enfermedad de obstrucción pulmonar crónica (COPD) o para perder peso.

Las partículas que comprenden nicotina incluyen un aminoácido seleccionado entre la L-leucina. El aminoácido cubre las partículas que comprenden nicotina. Proporcionar un aminoácido como la L-leucina con las partículas que comprenden nicotina, especialmente recubrir la nicotina con el aminoácido, puede reducir las fuerzas de adhesión de las partículas que comprenden nicotina y puede reducir la atracción entre las partículas de nicotina y reducir así la aglomeración de las partículas de nicotina. Del mismo modo, también pueden reducirse las fuerzas adhesivas a las partículas que comprenden sabor, con lo que también se reduce la aglomeración de partículas de nicotina con partículas saborizantes. El sistema de polvos descrito en la presente descripción puede ser un material que fluye libremente y posee un tamaño de partículas relativo estable de cada componente del polvo, incluso cuando se combinan las partículas de nicotina y las partículas saborizantes.

La nicotina es una sal de nicotina modificada en superficie en la que la partícula de sal de nicotina es una partícula recubierta. El material de recubrimiento es la L-leucina. Las partículas particularmente útiles que comprenden son una o más de bitartrato de nicotina recubierto de L-leucina, o piruvato de nicotina recubierto de L-leucina, o monopiruvato de L-leucina recubierto, o aspartato de L-leucina recubierto, o lactato de L-leucina recubierto.

Las partículas que tienen un tamaño de partícula de aproximadamente 5 micrómetros o menos pueden comprender al menos 50 % en peso de nicotina. El sistema de polvos puede tener al menos al menos de aproximadamente un 60 %, o al menos de aproximadamente un 80 %, en peso, del saborizante del sistema de polvos comprendido en partículas que tienen un tamaño de partícula en un intervalo de aproximadamente 50 micrómetros a aproximadamente 150 micrómetros.

Los saborizantes o sabores pueden proporcionarse como sabores sólidos (a temperatura ambiente de aproximadamente 22 grados centígrados y presión de una atmósfera) y pueden incluir formulaciones de sabor, materiales que contienen sabores y precursores de sabores. El saborizante puede incluir uno o más saborizantes naturales, uno o más saborizantes sintéticos, o una combinación de saborizantes naturales y sintéticos. Los saborizantes, tal como se describen en la presente descripción, son compuestos organolépticos, composiciones o materiales que se seleccionan y utilizan para alterar o están destinados a alterar las características de sabor o aroma de la nicotina durante su consumo o inhalación.

Los saborizantes o sabores se refieren a una variedad de materiales de sabor de origen natural o sintético. Estos incluyen compuestos simples y mezclas. Preferentemente, el aroma o saborizante tiene propiedades gustativas que mejoran la experiencia de la nicotina durante el consumo. El saborizante puede seleccionarse para proporcionar una experiencia similar a la resultante de fumar un artículo para fumar combustibles. Por ejemplo, el sabor o saborizante puede mejorar las propiedades de sabor tales como la plenitud y la complejidad en la boca. La complejidad se conoce generalmente como el equilibrio total del sabor que es más rico sin que dominen atributos sensoriales únicos. La plenitud de la bocanada se describe como la percepción de riqueza y volumen del humo en la boca y en la garganta del consumidor.

Los sabores adecuados incluyen, pero no se limitan a, cualquier sabor natural o sintético, tales como tabaco, humo, mentol, menta (tal como hierbabuena y menta verde), chocolate, regaliz, sabores de cítricos y otras frutas, gamma octalactona, vainillina, etil vainillina, sabores refrescantes del aliento, sabores de especias tales como canela, salicilato de metilo, linalol, esencia de bergamota, esencia de geranio, esencia de limón, y esencia de jengibre, y similares.

Otros sabores adecuados pueden incluir compuestos de sabores seleccionados a partir del grupo que consiste de un ácido, un alcohol, un éster, un aldehído, una cetona, una pirazina, sus combinaciones o mezclas y similares. Los compuestos saborizantes adecuados pueden seleccionarse, por ejemplo, a partir del grupo que consiste en ácido fenilacético, solanona, megastigmatrienona, 2-heptanona, alcohol bencílico, cis-3-hexenil acetato, ácido valérico, aldehído valérico, éster, terpeno, sesquiterpeno, nookatona, maltol, damascenona, pirazina, lactona, anetol, ácido valérico iso-s, sus combinaciones, y similares.

Ejemplos específicos adicionales de sabores se pueden encontrar en la bibliografía actual, y son conocidos para los expertos en la técnica de los saborizantes, es decir, de impartir un olor o un gusto a un producto.

El saborizante puede ser un saborizante de alta potencia, y se puede usar y detectar a niveles que resultarían en menos de 200 partes por millón en el flujo de aire de inhalación. Los ejemplos de tales saborizantes son compuestos clave del aroma del tabaco, tales como beta-damascenona, 2-etil-3,5-dimetilpirazina, fenilacetaldéhid, guayacol, y furaneol. Otros saborizantes solo pueden ser detectados por humanos a niveles de concentración más altos. Estos saborizantes, que en la presente descripción se denominan saborizantes de baja potencia, se usan generalmente a niveles que resultan en cantidades superiores de órdenes de magnitud del saborizante liberado en el aire de inhalación. Los saborizantes de baja potencia adecuados incluyen, pero no se limitan a, mentol natural o sintético, menta piperita, hierbabuena, café, té, especias (tales como canela, clavo de olor y jengibre), cacao, vainilla, sabores a frutas, chocolate, eucalipto, geranio, eugenol y linalol.

Las partículas que comprenden sabor pueden incluir un compuesto para reducir las fuerzas adhesión o energía de superficie y aglomeración resultante. La partícula de sabor puede tener una superficie modificada con un compuesto reductor de la adhesión para formar una partícula de sabor recubierta. Un compuesto reductor de la adhesión preferido puede ser el estearato de magnesio. Proporcionar un compuesto reductor de la adhesión tal como estearato de magnesio con la partícula de sabor, especialmente recubriendo la partícula saborizante, puede reducir las fuerzas de adhesión de las partículas que comprenden el sabor y puede reducir la atracción entre las partículas saborizantes y así reducir la aglomeración de las partículas saborizantes. Por tanto, también puede reducirse la aglomeración de partículas saborizantes con partículas de nicotina. El sistema de polvos descrito en la presente por lo tanto puede poseer un tamaño de partícula relativo estable de las partículas que comprenden nicotina y las partículas que comprenden sabor incluso cuando las partículas de nicotina y las partículas saborizantes están combinadas. El sistema de polvos preferentemente fluye libremente.

La partícula de sabor puede tener al menos aproximadamente 10 % en peso de sabor, o al menos aproximadamente 20 % en peso de sabor, o al menos 30 % en peso de sabor, o al menos 40 % en peso de sabor. La partícula de sabor puede comprender sabor en un intervalo de aproximadamente 10 a aproximadamente 100 % en peso de sabor, o de aproximadamente 30 a aproximadamente 90 % en peso de sabor.

Las formulaciones convencionales para inhalación de polvo seco típicamente contienen partículas portadoras que sirven para aumentar la fluidificación de las partículas activas ya que las partículas activas pueden ser muy pequeñas para ser influenciadas por un flujo de aire simple a través del inhalador. Estas partículas portadoras suelen ser un sacárido como la lactosa o el manitol que tiene un tamaño de partícula superior a aproximadamente 50 micrómetros. Las partículas portadoras se utilizan para mejorar la uniformidad de la dosis actuando como diluyente o agente de carga en una formulación. Las partículas portadoras tales como lactosa o manitol no se consideran saborizantes o material de sabor en esta descripción.

El sistema de polvos descrito en la presente descripción puede estar exento o esencialmente exento de un sacárido como la lactosa o el manitol. Estar libre de un portador o esencialmente libre de un sacárido tal como lactosa o manitol puede permitir que la nicotina se inhale y se suministre a los pulmones de un usuario a velocidades de flujo de aire o de inhalación que son similares a las velocidades de flujo de aire o de inhalación típicas del régimen de fumado. Además, dado que la nicotina está libre de portador o esencialmente libre de un sacárido tal como lactosa o manitol, la trayectoria de flujo de aire del inhalador puede tener geometría simple o una configuración simple.

El sistema de polvos incluye partículas que comprenden nicotina y partículas que comprenden sabor. Las partículas de nicotina y las partículas saborizantes pueden combinarse en una sola cápsula. Como se describió anteriormente, las partículas de nicotina y las partículas saborizantes pueden tener cada una fuerzas de adhesión reducidas que dan lugar a una formulación en polvo estable en la que el tamaño de las partículas de nicotina y las partículas saborizantes no cambia esencialmente cuando se combinan. El sistema de polvos es preferentemente de flujo libre.

Alternativamente, el sistema de polvos puede comprender las partículas que comprenden nicotina contenidas en una primera cápsula de nicotina y las partículas que comprenden sabor contenidas en una segunda cápsula de saborizante. La cápsula de nicotina y la cápsula de saborizante separada pueden estar en disposición de flujo de aire o conexión de fluido en paralelo o en disposición de flujo de aire o conexión de fluido en serie.

Preferentemente, las partículas de nicotina y las partículas saborizantes forman el 100 % en peso del peso total del sistema de polvos.

La trayectoria de flujo de aire o canal de flujo de aire a través del cuerpo del inhalador puede ser una simple trayectoria o canal. Preferentemente, la trayectoria de flujo de aire o canal de flujo de aire a través del cuerpo del inhalador puede ser paralela a un eje longitudinal del inhalador y puede extenderse linealmente a lo largo de todo el cuerpo del inhalador. El inhalador puede tener solo un único canal de flujo de aire principal con un receptáculo para cápsula única dispuesto en el mismo. Alternativamente, el inhalador puede incluir dos o tres canales de flujo de aire coextensivos o paralelos. Uno, dos o los tres canales de flujo de aire pueden incluir un receptáculo para cápsulas dispuesto en el mismo. El inhalador puede configurarse para suministrar las partículas de nicotina y las partículas saborizantes de manera simultánea.

Preferentemente, las partículas que comprenden nicotina y las partículas saborizantes pueden ser un polvo seco entremezclado y dentro de una misma cápsula. Alternativamente, las partículas que comprenden sabor pueden separarse de las partículas que comprenden nicotina antes de la inhalación o suministro a través de los canales de flujo de aire del inhalador. Las partículas que comprenden nicotina y las partículas que comprenden sabor pueden estar en disposición de flujo de aire en serie y dispuestas dentro de un único canal de flujo de aire y las partículas que comprenden sabor pueden estar corriente arriba o corriente abajo de las partículas que comprenden. Alternativamente, las partículas que comprenden nicotina y las partículas que comprenden sabor pueden estar en una disposición de flujo de aire paralela y dispuestas dentro de un par de canales de flujo de aire donde las partículas que comprenden y las partículas que comprenden sabor se combinan para formar una mezcla corriente abajo tanto del receptáculo como del receptáculo de sabor.

- El receptáculo para nicotina puede recibir una cápsula que contiene la nicotina y opcionalmente el sabor (cuando se combina dentro de una única cápsula). La cápsula puede contener una cantidad o dosis predeterminada de nicotina y un saborizante opcional. La cápsula puede contener nicotina suficiente para proporcionar al menos 2 inhalaciones o "bocanadas" de nicotina, o al menos aproximadamente 5 inhalaciones o "bocanadas" de nicotina, o al menos aproximadamente 10 inhalaciones o "bocanadas" de nicotina. Preferentemente, la cápsula puede contener nicotina suficiente para proporcionar de aproximadamente 5 a 50 inhalaciones o "bocanadas" de nicotina, o de aproximadamente 10 a 30 inhalaciones o "bocanadas" de nicotina. Cada inhalación o "bocanada" de nicotina puede suministrar de aproximadamente de aproximadamente 0,1 mg a aproximadamente 3 mg de partículas que comprenden nicotina a los pulmones por el usuario o de aproximadamente 0,2 mg a aproximadamente 2 mg de nicotina a los pulmones por el usuario o de aproximadamente 1 mg de nicotina a los pulmones por el usuario. Preferentemente, se suministran aproximadamente 50 a aproximadamente 150 microgramos de nicotina a los pulmones del usuario con cada "bocanada".
- La cápsula puede contener o contener al menos al menos aproximadamente 5 mg de nicotina o al menos aproximadamente 10 mg de nicotina. La cápsula puede contener menos de aproximadamente 30 mg de nicotina o menos de aproximadamente 25 mg de nicotina, o menos de 20 mg de nicotina. Preferentemente, la cápsula contiene o contiene de aproximadamente 5 mg a aproximadamente 30 mg de nicotina o de aproximadamente 10 mg a aproximadamente 20 mg de nicotina.
- Cuando las partículas que comprenden sabor se mezclan o combinan con las partículas que comprenden nicotina dentro de la cápsula, el sabor está presente en una cantidad que proporciona el sabor conveniente a cada inhalación o "bocanada" suministrada al usuario.
- La cápsula puede estar formada por un material impermeable al aire que pueda ser perforado o agujereado por el inhalador. La cápsula puede estar formada por un material metálico o polimérico que sirve para mantener los contaminantes fuera de la cápsula pero que puede ser perforado o agujereado por el inhalador durante su uso.
- Un inhalador de polvo de nicotina incluye un cuerpo que se extiende entre una porción de boquilla y una porción de extremo distal y un canal de flujo de aire que se extiende entre la porción de boquilla y la porción de extremo distal. Un receptáculo de polvo de nicotina se dispone a lo largo del canal de flujo de aire y el sistema de polvos descrito en la presente descripción se dispone dentro del receptáculo de polvo de nicotina.
- El sistema de polvos puede suministrarse con una construcción de inhalador simple a velocidades de flujo de aire o inhalación que estén dentro de las velocidades de flujo de aire o inhalación del régimen convencional para fumar.
- Un método para inhalar en los pulmones de un usuario incluye inhalar aire a través del inhalador de polvo de nicotina descrito en la presente descripción, a una velocidad de flujo de menos de aproximadamente 2 litros por minuto para suministrar a los pulmones del usuario. El sabor no puede suministrarse a los pulmones del usuario.
- El inhalador puede incluir un elemento perforador o un par de elementos perforadores opuestos configurados para perforar la cápsula. El elemento perforador o el par de elementos perforadores opuestos pueden acoplarse con la cápsula de polvo de nicotina al cargar la cápsula de polvo saborizante en el receptáculo de polvo de nicotina o a demanda de un accionador en el cuerpo del inhalador.
- Las partículas que comprenden sabor pueden separarse de las partículas que comprenden nicotina y las partículas que comprenden sabor pueden estar contenidas en una cápsula separada. La cápsula puede estar formada por un material impermeable al aire que pueda ser perforado o agujereado por el inhalador. La cápsula puede estar formada por un material metálico o polimérico que sirve para mantener los contaminantes fuera de la cápsula pero que puede ser perforado o agujereado por el inhalador durante su uso.
- El inhalador de nicotina de conformidad con esta invención puede funcionar usando una velocidad de flujo de menos de aproximadamente 5 l/min, o de menos de aproximadamente 3 l/min, o menos de aproximadamente 2 l/min o de aproximadamente 1,6 l/min. Preferentemente, la velocidad de flujo se encuentra en un intervalo de aproximadamente 1 l/min a aproximadamente 3 l/min, o de aproximadamente 1,5 l/min a aproximadamente 2,5 l/min. Con mayor preferencia, la velocidad de inhalación o velocidad de flujo es similar a la del régimen de fumar de Health Canada, aproximadamente 1,6 l/min. A diferencia de ello, un DPI convencional funciona con una velocidad de flujo de aproximadamente 20-100 l/min o superior, y a menudo requiere una fuente de energía o un propulsor que promueva el flujo de aire para alcanzar esta velocidad de flujo de aire.
- El inhalador de nicotina descrito en la presente descripción puede ser usado por un consumidor como quien fuma un cigarrillo convencional o vapea un cigarrillo electrónico. Esta acción de fumar o vapear se caracteriza por dos pasos: un primer paso durante el cual un pequeño volumen que comprende toda la cantidad de nicotina conveniente para el consumidor se aspira en la cavidad bucal, seguido de un segundo paso durante el cual este pequeño volumen que comprende la nicotina se diluye aún más con aire fresco y se aspira más profundamente en los pulmones. Ambas etapas se controlan por el consumidor. Durante la primera etapa de inhalación el consumidor puede determinar la cantidad de nicotina a inhalar. Durante la segunda etapa, el consumidor puede determinar el volumen para diluir el

primer volumen a extraer más profundo hacia dentro de los pulmones, maximizando la concentración del agente activo suministrado a la superficie epitelial de las vías aéreas. Este mecanismo de fumado es a veces llamado "bocanada-inhalar-exhalar".

5 Todos los términos científicos y técnicos usados en la presente descripción tienen significados que se usan comúnmente en la técnica a menos que se especifique de otra manera. Las definiciones proporcionadas en la presente descripción son para facilitar el entendimiento de ciertos términos usados frecuentemente en la presente descripción.

10 Los términos "corriente arriba" y "corriente abajo" se refieren a las posiciones relativas de los elementos del inhalador descrito en relación con la dirección de flujo de aire de inhalación cuando se arrastra a través del cuerpo del inhalador desde una porción de extremo distal hacia la porción de boquilla.

15 Como se usa en la presente descripción, el término "y/o" se refiere a uno o todos los elementos enumerados o a una combinación de dos o más de los elementos enumerados.

20 Como se usa en la presente descripción, "tiene", "que tiene", "incluye", "que incluye", "comprende", "que comprende" o similares se usan en su sentido amplio, y generalmente implican "que incluyen, pero no se limitan a". Se entenderá que la expresión "que consiste esencialmente en", "consiste en" y similares se incluyen en "que comprende" y similares.

25 Las palabras "preferido" y "preferentemente" se refieren a modalidades de la invención que pueden lograr ciertos beneficios, bajo ciertas circunstancias. Sin embargo, otras modalidades pueden también preferirse, bajo la misma u otras circunstancias. Además, la enumeración de una o más modalidades preferidas no implica que otras modalidades no sean útiles, y no se prevé excluir otras modalidades del alcance de la descripción, que incluye las reivindicaciones.

30 Las Figuras 1-5 son diagramas esquemáticos de inhaladores de nicotina en polvo ilustrativos 10. Los dibujos esquemáticos no están necesariamente a escala y se presentan con fines ilustrativos y no taxativos. Los dibujos representan uno o más aspectos descritos en esta descripción.

35 Refiriéndonos ahora a las Figura 1 y Figura 2, los inhaladores de nicotina en polvo 10 incluyen una porción de boquilla 12 y una porción de extremo distal 14 y una cápsula de nicotina 20 dispuesta entre ellas. Los elementos perforadores 11A y 11B se configuran para perforar la cápsula 20 y conectar de manera continua el canal de flujo de aire 13 de la porción de boquilla 12 con el canal de flujo de aire 15 de la porción de extremo distal 14. El canal de flujo de aire se extiende de manera lineal a lo largo de una longitud del inhalador de polvo de nicotina 10. La Figura 2 ilustra además la cápsula 20 dentro de un receptáculo 25 que puede ser reutilizable.

40 Las Figuras 3-5 ilustran diagramas esquemáticos de inhaladores 10. La Figura 3 muestra un inhalador de nicotina 10 que tiene una única trayectoria de flujo y una única cápsula 120 que contiene tanto las partículas de nicotina como las partículas saborizantes. La trayectoria de flujo de aire incluye una porción corriente arriba 15 y una porción corriente abajo 13.

45 La Figura 4 muestra un inhalador de nicotina 10 que tiene una única trayectoria de flujo y una cápsula de nicotina 20 que contiene partículas de nicotina en disposición de flujo en serie con la cápsula de saborizante 100 que contiene partículas saborizantes. La cápsula saborizante 100 puede perforarse como se describió anteriormente para la cápsula de nicotina 20. La trayectoria de flujo de aire incluye una porción corriente arriba 15 y una porción corriente abajo 13.

50 La Figura 5 muestra un inhalador de nicotina 10 que tiene una trayectoria de flujo paralela y una cápsula de nicotina 20 que contiene partículas de nicotina en disposición de flujo paralelo con la cápsula de saborizante 100 que contiene partículas saborizantes. La cápsula saborizante 100 puede perforarse como se describió anteriormente para la cápsula de nicotina 20. La trayectoria de flujo de aire incluye una porción corriente arriba 15 y una porción corriente abajo 13.

55

REIVINDICACIONES

1. Un sistema de polvos, que comprende:

una primera pluralidad de partículas que tienen un diámetro aerodinámico mediano de masa de 5 micrómetros o menos, la primera pluralidad de partículas comprende partículas de nicotina, las partículas de nicotina comprenden partículas de sal de nicotina recubiertas, en donde el material de recubrimiento es L-leucina; y

una segunda pluralidad de partículas que tienen un diámetro aerodinámico mediano de masa en un intervalo de 50 micrómetros a 150 micrómetros y que comprenden sabor, en donde la primera pluralidad de partículas es de 50 % en peso a 99 % en peso y la segunda pluralidad de partículas es de 1 % en peso a 50 % en peso del peso total del sistema de polvos, y en donde la primera pluralidad de partículas y la segunda pluralidad de partículas constituyen al menos 99 % en peso del sistema de polvos.

2. El sistema de polvos de conformidad con la reivindicación 1, en donde al menos 90 % en peso de la nicotina del sistema de polvos se compone de partículas que tienen un tamaño de partícula de 5 micrómetros o menos.

3. El sistema de polvos de conformidad con cualquier reivindicación anterior, en donde al menos 80 % en peso del sabor del sistema de polvos se compone de partículas que tienen un tamaño de partícula en un intervalo de 50 micrómetros a 150 micrómetros.

4. El sistema de polvos de conformidad con cualquier reivindicación anterior, en donde la primera pluralidad de partículas tiene un diámetro aerodinámico mediano de masa de 3 micrómetros o menos, o en un intervalo de 1 micrómetro a 3 micrómetros.

5. El sistema de polvos de conformidad con cualquier reivindicación anterior, en donde la primera pluralidad de partículas y la segunda pluralidad de partículas están contenidas dentro de una única cápsula (120).

6. El sistema de polvos de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde la primera pluralidad de partículas está contenida dentro de una primera cápsula (20) y la segunda pluralidad de partículas está contenida dentro de una segunda cápsula (100).

7. El sistema de polvos de conformidad con cualquier reivindicación anterior, en donde la sal de nicotina es piruvato de nicotina, citrato de nicotina, aspartato de nicotina, lactato de nicotina, bitartrato de nicotina, salicilato de nicotina, fumarato de nicotina, monopiruvato de nicotina, glutamato de nicotina o clorhidrato de nicotina.

8. El sistema de polvos de conformidad con la reivindicación 7, en donde la sal de nicotina es piruvato de nicotina, monopiruvato de nicotina, aspartato de nicotina o lactato de nicotina.

9. El sistema de polvos de conformidad con cualquier reivindicación anterior, en donde la segunda pluralidad de partículas comprende estearato de magnesio.

10. Un inhalador de polvo de nicotina (10) que comprende:

un cuerpo que se extiende entre una porción de boquilla (12) y una porción de extremo distal (14);

un canal de flujo de aire (13,15) que se extiende entre la porción de boquilla (12) y la porción de extremo distal (14);

y

un receptáculo de polvo de nicotina (25) dispuesto a lo largo del canal de flujo de aire (13, 15) y el sistema de polvos de cualquier reivindicación anterior dispuesto dentro del receptáculo de polvo de nicotina (25).

11. El inhalador de polvo de nicotina (10) de conformidad con la reivindicación 10, en donde la primera pluralidad de partículas y la segunda pluralidad de partículas están contenidas dentro de una única cápsula (120) y la cápsula se dispone dentro del receptáculo de polvo de nicotina (25) y la primera pluralidad de partículas y la segunda pluralidad de partículas se liberan desde la única cápsula (120) hacia el canal de flujo de aire (13,15), o en donde la primera pluralidad de partículas está contenida dentro de una primera cápsula (20) y la segunda pluralidad de partículas está contenida dentro de una segunda cápsula (100) y la segunda cápsula (100) está corriente arriba o corriente abajo de la primera cápsula (20) y dentro del canal de flujo de aire (13,15).

12. El inhalador de polvo de nicotina (10) de conformidad con la reivindicación 10, que comprende además un segundo canal de flujo de aire en relación de flujo de aire paralela con el receptáculo de polvo de nicotina (25) y la primera pluralidad de partículas está contenida dentro de una primera cápsula (20) dentro del receptáculo de polvo de nicotina y la segunda pluralidad de partículas está contenida dentro de una segunda cápsula (100) dentro del segundo canal de flujo de aire.

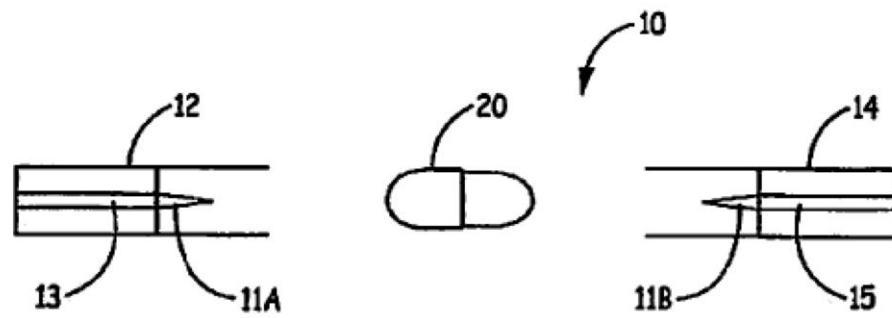


FIGURA 1

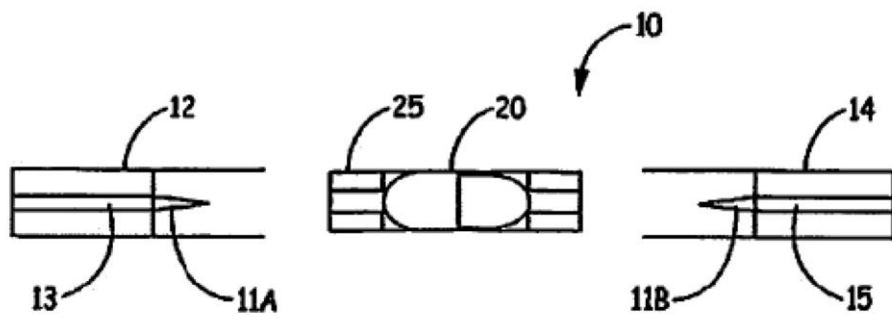


FIGURA 2

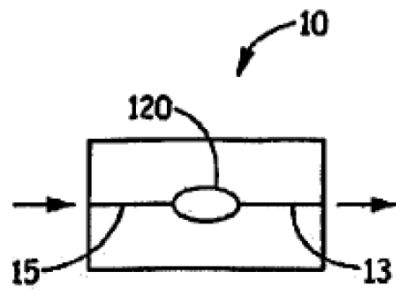


FIGURA 3

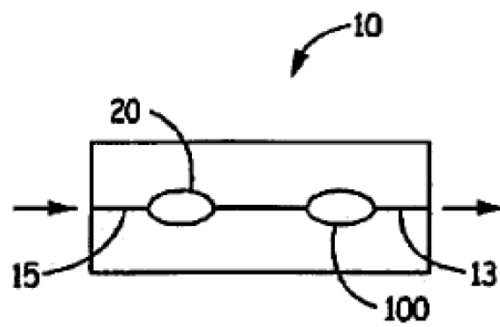


FIGURA 4

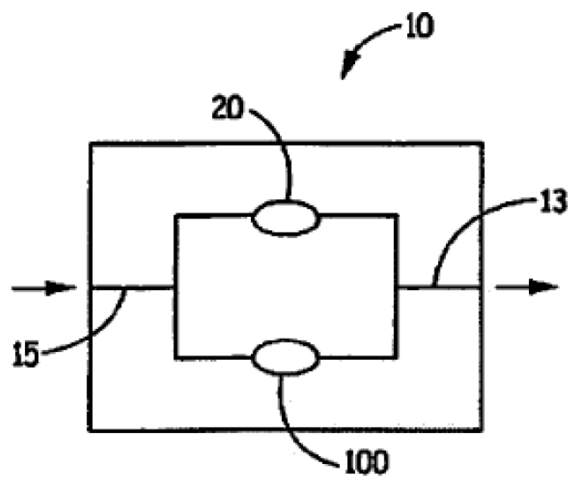


FIGURA 5