

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 471 665**

21 Número de solicitud: 201201267

51 Int. Cl.:

A61K 31/465 (2006.01)

A61K 9/20 (2006.01)

12

SOLICITUD DE PATENTE

A1

22 Fecha de presentación:

21.12.2012

43 Fecha de publicación de la solicitud:

26.06.2014

71 Solicitantes:

FARMALIDER, S.A. (50.0%)
Aragoneses, 15
28100 Alcobendas (Madrid) ES y
LABORATORIOS VIÑAS S.A. (50.0%)

72 Inventor/es:

SANZ MENÉNDEZ , Nuria;
RIZO MARTÍNEZ, José Miguel;
BUXADÉ VIÑAS, Antonio;
GÓMEZ CALVO, Antonia y
JULIÁN PRAT, Ramón

74 Agente/Representante:

RODRÍGUEZ OCA, Jesús

54 Título: **Producto sustitutivo del tabaco**

57 Resumen:

Producto sustitutivo del tabaco.

La invención se refiere a una pastilla blanda de nicotina que comprende nicotina o un derivado de nicotina, gelatina, un agente saborizante y un agente antioxidante, así como a un producto sustitutivo del tabaco que incluye la pastilla blanda de nicotina que tiene parcialmente insertado un palo con una función de soporte o asidero.

ES 2 471 665 A1

DESCRIPCIÓN

PRODUCTO SUSTITUTIVO DEL TABACO

Campo de la técnica

La presente invención se refiere a un producto sustitutivo del tabaco que consiste en una pastilla blanda de nicotina de consistencia blanda y provista de un palo.

Estado de la técnica anterior

Los efectos perjudiciales del tabaquismo en la salud son sobradamente conocidos, de manera que las enfermedades más frecuentes asociadas al uso del tabaco son cáncer de pulmón, enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC), cardiopatía isquémica y enfermedad cerebrovascular. A pesar de ello, el abandono de dicho hábito por parte de los fumadores suele resultar difícil debido al efecto adictivo de la nicotina

La nicotina es un alcaloide natural que se extrae de las hojas de la planta del tabaco. El cigarrillo es un sistema de administración de nicotina extremadamente eficaz, de manera que ésta se absorbe rápidamente llegando al cerebro donde están los receptores al cabo de tan sólo unos 10 segundos después de la inhalación. Esta relación casi inmediata entre la inhalación del humo y su efecto a nivel cerebral es uno de los factores que contribuye al alto poder adictivo de la nicotina.

Para ayudar a combatir la ansiedad y el síndrome de abstinencia experimentado durante el proceso de dejar de fumar, con frecuencia se utilizan tratamientos farmacológicos, ya que se ha demostrado que son eficaces y aumentan las posibilidades de abandono de la dependencia al tabaquismo a largo plazo, tal como se describe, por ejemplo, en el artículo de Wu y col., *Effectiveness of smoking cessation therapies: a systematic review and meta-analysis*, BMC Public Health, 2006, 6, 300.

Entre dichos tratamientos farmacológicos está la terapia sustitutiva con nicotina, que consiste en la administración de nicotina pura por una vía diferente

a la del consumo de cigarrillos y en una cantidad suficiente para disminuir los síntomas de abstinencia pero insuficiente para crear dependencia.

Existen en el mercado diversos productos disponibles como sustitutivos del tabaco, en forma de parches, chicles, nebulizadores nasales, inhaladores o comprimidos.

Todos ellos se basan en el mismo principio de aportar unos niveles estables de nicotina al paciente, de manera que la elección de una determinada alternativa dependerá principalmente de características específicas de cada individuo. Por ejemplo, los parches pueden estar contraindicados para sujetos con afecciones dermatológicas o los chicles pueden no ser indicados para aquellos con alteraciones en la mandíbula o con trastornos dentarios. Es deseable, por tanto, disponer de suficientes alternativas para poder adaptarse de la manera más adecuada a las necesidades de cada paciente.

En el estado de la técnica se han descrito algunos productos sustitutivos del tabaco en forma de pastilla blanda de consistencia blanda. Así, por ejemplo, en la solicitud de patente británica GB-A-2299756 se describen unas pastillas de consistencia gelatinosa, preparadas a base de gelatina o goma arábiga, que contienen nicotina, así como, opcionalmente, otros componentes tales como vitaminas, edulcorantes y aromatizantes.

En la solicitud de patente internacional WO-A-91/06288 se describen pastillas de gelatina, azúcar y glucosa que contienen nicotina y que constituyen una unidad estimuladora para su utilización oral que proporciona una liberación controlada de nicotina.

Así mismo, en la solicitud de patente internacional WO-A-2011/101860 se describen pastillas de consistencia blanda que comprenden del 0,05-1% de nicotina, del 5-40% de un agente gelificante, del 30-70% de una sustancia plastificante, del 0,05-10% de un edulcorante, del 0,5-30% de un agente de liberación, del 0,05-2% de un conservante, del 0,01-5% de un aromatizante y del 5-20% de agua, de manera que dichas pastillas se disuelven en la cavidad bucal en un intervalo comprendido entre 5 y 15 minutos.

Por otro lado, es sabido que el tabaquismo no sólo comporta una dependencia física o farmacológica causada por la nicotina, sino que también lleva asociada una dependencia de tipo psicológico y conductual. Por ello, es frecuente que los sujetos que han dejado de fumar necesiten ocupar las manos
5 de alguna manera para suplir la presencia del cigarrillo.

De esta manera, se han descrito algunas terapias sustitutivas de nicotina que pretenden abordar esta doble dependencia. Así, por ejemplo, en la patente norteamericana US5048544 se describen unos caramelos con un palo que sirve de mango. La parte comestible contiene una pequeña cantidad de nicotina y
10 consiste en un caramelo duro o semiduro, mientras que el mango tiene preferiblemente el tamaño, forma y consistencia de un cigarrillo.

Así pues, subsiste la necesidad de poder disponer de un producto sustitutivo del tabaco alternativo, que sea eficaz para proporcionar niveles adecuados de nicotina para combatir el fenómeno adictivo en individuos en
15 proceso de abandonar el tabaquismo y que, además, sea capaz de contribuir a paliar la dependencia de tipo psicológico y conductual en los ex-fumadores.

Objeto de la invención

Forma parte del objeto de la presente invención una pastilla blanda de nicotina.

20 También forma parte del objeto de la invención un producto sustitutivo del tabaco que consiste en dicha pastilla blanda provista de un palo.

Descripción detallada de la invención

El objeto de la presente invención es una pastilla blanda de nicotina que
25 comprende:

- a) nicotina o un derivado de nicotina en una cantidad comprendida entre el 0,05% y el 1%;
- b) gelatina en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%;

- c) un agente saborizante en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%; y
- d) un agente antioxidante en una cantidad comprendida entre el 0,025% y el 0,2%; en donde los porcentajes están expresados en peso con respecto al peso total de la pastilla blanda.

Los autores de la presente invención han desarrollado un producto sustitutivo del tabaco que consiste en una pastilla blanda provista de un palo a modo de asidero, de manera que dicho asidero permite al usuario sostener el producto en la mano para un consumo intermitente, lo que contribuye a paliar la dependencia psicológica o conductual, al tiempo que la composición y consistencia de la pastilla blanda de nicotina resultan especialmente satisfactorias desde un punto de vista organoléptico.

15 Nicotina

La nicotina es la denominación común con la que se conoce habitualmente al producto (S)-3-(1-metilpirrolidin-2-il)piridina. Se trata de un alcaloide que se encuentra en las plantas de la familia de las *Solanaceae*, principalmente en la planta del tabaco (*Nicotiana tabacum*), así como en la *Nicotiana rustica*.

La nicotina puede extraerse a partir de la planta del tabaco, por ejemplo como se describe en el libro L. Gattermann y H. Wieland, *Laboratory Methods of Organic Chemistry*, 24 Edición, New York, 1937, página 406; o bien puede sintetizarse, por ejemplo según se describe en el artículo de L.C. Craig, *A new synthesis of normicotine and nicotine*, 1933, 55(7), 2854-2857; o bien puede obtenerse de forma comercial a partir de diversos suministradores, por ejemplo de Sigma-Aldrich.

En la presente invención la nicotina puede emplearse como base libre o bien puede estar en forma de un derivado de nicotina. Los derivados de nicotina adecuados en el contexto de la presente invención incluyen sales

farmacéuticamente aceptables de nicotina, por ejemplo monotartrato, bitartrato, bitartrato dihidrato, sulfato, entre otras; complejos de inclusión con ciclodextrinas; solvatos; complejos con una resina, donde la nicotina está unida a una resina de intercambio iónico, por ejemplo nicotina polacrilex; o bien extractos vegetales enriquecidos, entre otros.

En una realización preferente de la invención, el derivado de nicotina es nicotina polacrilex.

La nicotina polacrilex consiste en una resina de intercambio catiónico preparada a partir de ácido metacrílico y divinilbenceno unida a la nicotina. La preparación de la nicotina polacrilex se describe, por ejemplo, en la patente estadounidense US3901248 y puede obtenerse comercialmente de diversos distribuidores, por ejemplo de la empresa Nicobrand.

La composición de las pastillas blandas de nicotina de la presente invención contienen nicotina o un derivado de nicotina en una proporción comprendida entre el 0,05% y el 1% en peso respecto al peso total de la pastilla blanda, expresada como cantidad equivalente de nicotina, preferentemente entre el 0,1% y el 0,5%, y en particular entre el 0,2% y el 0,3%.

En una realización preferente, la pastilla blanda contiene una dosis de nicotina o de un derivado de nicotina comprendida entre 1 mg y 5 mg, expresado como peso equivalente de nicotina, en especial entre 1,5 mg y 4,5 mg y en particular entre 2 mg y 4 mg.

Otros componentes

Las pastillas blandas de la presente invención contienen gelatina en una proporción en peso comprendida entre el 20% y el 50% respecto al peso total de la pastilla blanda, preferentemente entre el 25% y el 45%, en especial entre el 30% y el 40% y en particular entre el 33% y el 37%.

La composición de las pastillas blandas de la invención comprende además un agente saborizante en una cantidad comprendida entre el 20% y

el 50% en peso respecto al peso total de la pastilla blanda, preferentemente entre el 25% y el 35%, y en especial entre el 27% y el 32%.

Entre los saborizantes adecuados para ser utilizados en la presente invención se citan, por ejemplo, sorbitol, maltitol, manitol, eritritol, dextrosa,
5 maltosa, xilitol, y mezclas de los mismos.

En una realización preferente de la invención, el agente saborizante es sorbitol.

Además, las pastillas blandas de la invención comprenden entre el 0,025% y el 0,2% en peso con respecto al peso total de la pastilla blanda de
10 una sustancia antioxidante, preferentemente entre el 0,04% y el 0,1%, y en especial entre el 0,045% y el 0,055%.

Entre los antioxidantes adecuados para ser utilizados en la presente invención se pueden citar, por ejemplo, butilhidroxianisol, alfa-tocoferol, ácido ascórbico, metionina, butilhidroxitolueno y mezclas de los mismos.

15 En una realización preferente de la invención, el agente antioxidante es butilhidroxianisol.

Componentes adicionales

Adicionalmente, las pastillas blandas de nicotina de la invención pueden contener un agente conservante, habitualmente en una proporción comprendida
20 entre el 0,05% y el 0,2% en peso respecto al peso total de la pastilla blanda, preferentemente entre el 0,075% y el 0,15%, en especial entre el 0,09% y el 0,12%.

Dicho conservante puede seleccionarse, por ejemplo, de entre ácido benzoico, parabenos (metilparabeno, etilparabeno, propilparabeno o
25 butilparabeno) o sus sales sódicas o potásicas, cloruro de benzalconio o alcohol bencílico.

Así mismo, las pastillas blandas de nicotina de la invención pueden contener una sustancia edulcorante, habitualmente en una proporción

comprendida entre el 0,1% y el 0,5% en peso respecto al peso total de la pastilla blanda, preferentemente entre el 0,2% y el 0,4%, y en especial entre el 0,25% y el 0,3%.

Entre los edulcorantes adecuados para ser utilizados en la presente
5 invención se pueden citar, por ejemplo, sacarina, sacarosa, sucralosa, aspartamo, acesulfamo potásico, trehalosa y mezclas de los mismos.

Además, dichas pastillas blandas de nicotina pueden contener un agente regulador del pH o tampón en una cantidad que habitualmente está comprendida entre el 2,5% y el 7,5% en peso respecto al peso total de la pastilla
10 blanda, preferentemente entre el 3% y el 6%, y en especial entre el 4% y el 5,5%.

Entre los diferentes agentes reguladores del pH adecuados para ser incorporados en la composición de las pastillas blandas se pueden citar, por ejemplo, fosfato sódico dibásico, fosfato sódico monobásico, carbonato sódico,
15 bicarbonato sódico, monoetanolamina, dietanolamina, trietanolamina, solución de amoníaco, carbonato cálcico, hidróxido cálcico y mezclas de los mismos.

En una realización preferente de la invención, la pastilla blanda comprende además un agente conservante, una sustancia edulcorante y un agente regulador del pH.

20 Así, una realización preferente de la invención es una pastilla blanda que comprende:

- a) nicotina polacrilex en una cantidad comprendida entre el 0,05% y el 1%, expresada como cantidad equivalente de nicotina;
- b) gelatina en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%;
- 25 c) sorbitol en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%;
- d) un agente antioxidante en una cantidad comprendida entre el 0,025% y el 0,2%;
- e) un agente conservante en una cantidad comprendida entre el 0,05% y el 0,2%;

- f) una sustancia edulcorante en una cantidad comprendida entre el 0,1% y el 0,5%; y
- g) un agente regulador del pH en una cantidad comprendida entre el 2,5% y el 7,5%;

5 en donde los porcentajes están expresados en peso con respecto al peso total de la pastilla blanda y la suma de porcentajes de los componentes es el 100%.

Adicionalmente, la pastilla blanda de nicotina de la invención también puede contener una sustancia aromatizante bien de origen natural, como aceites esenciales o aromas naturales, o bien un aromatizante artificial, para
10 proporcionar diferentes sabores, por ejemplo aroma de menta, eucalipto, mentol, limón, naranja, anís, fresa, piña, entre otros.

Producto sustitutivo del tabaco

Forma parte del objeto de la invención un producto sustitutivo del tabaco
15 que consiste en una pastilla blanda de la invención que tiene parcialmente insertado un palo con una función de soporte o asidero.

Como tal se entiende un producto destinado al tratamiento farmacológico de la dependencia a la nicotina para aquellos individuos que están dejando el hábito del tabaquismo y que se basa en la administración de nicotina pura por
20 una vía diferente a la del consumo de cigarrillos y en una cantidad suficiente para disminuir los síntomas de abstinencia pero insuficiente para crear dependencia.

El producto sustitutivo del tabaco de la presente invención tiene una apariencia similar a los caramelos o golosinas del tipo "chupa-chups" o
25 "piruletas", que llevan insertado parcialmente un palo o varilla de longitud adecuada para constituir un mango o asidero que permita al usuario mantener el caramelo en la mano, introduciéndolo de vez en cuando en la boca para un consumo intermitente.

El palo utilizado en el producto de la invención es habitualmente de plástico o cartón, de consistencia rígida o semirígida.

En una realización preferente de la invención, el producto sustitutivo del tabaco consiste en una pastilla blanda que tiene parcialmente insertado un palo con una función de soporte o asidero, caracterizado porque la pastilla blanda comprende:

- a) nicotina o polacrilex nicotina en una cantidad comprendida entre el 0,05% y el 1%;
- b) gelatina en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%;
- 10 c) sorbitol en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%;
- d) un agente antioxidante en una cantidad comprendida entre el 0,025% y el 0,2%;
- e) un agente conservante en una cantidad comprendida entre el 0,05% y el 0,2%;
- 15 f) una sustancia edulcorante en una cantidad comprendida entre el 0,1% y el 0,5%; y
- g) un agente regulador del pH en una cantidad comprendida entre el 2,5% y el 7,5%, en donde los porcentajes están expresados en peso con respecto al peso total de la pastilla blanda.

20 En una realización especialmente preferente, el producto sustitutivo del tabaco de la presente invención comprende además una sustancia aromatizante.

Se ha observado que el empleo del producto sustitutivo del tabaco de la presente invención permite la administración de nicotina por una vía diferente de la del consumo de cigarrillos y en una cantidad suficiente para disminuir los síntomas de abstinencia, contribuyendo al mismo tiempo a paliar la dependencia psicológica o conductual, ya que permite al usuario sostener el producto en la mano para un consumo intermitente.

Preparación de las composiciones de la invención

Un procedimiento adecuado para preparar el producto sustitutivo del tabaco objeto de la presente invención, comprende las siguientes etapas:

- a) disolver la gelatina en agua purificada previamente calentada a una temperatura comprendida entre 50°C y 90°C;
- 5 b) añadir el antioxidante a la mezcla anterior;
- c) añadir la nicotina o el derivado de nicotina y el agente saborizante; y
- d) distribuir en moldes, añadir el palo y dejar enfriar hasta temperatura ambiente.

- Opcionalmente, en cualquiera de las etapas a), b) o c) se incorpora un
- 10 componente adicional seleccionado de entre el grupo consistente en agentes edulcorantes, agentes conservantes, agentes reguladores del pH, aromatizantes y mezclas de los mismos.

A continuación, se proporcionan algunos ejemplos a modo ilustrativo y no limitativo de la invención.

15 Ejemplos

Ejemplo 1: Producto sustitutivo del tabaco

Se preparó un producto sustitutivo del tabaco según la presente invención empleando los siguientes ingredientes:

Ingrediente	Cantidad (g)	% en peso
Nicotina polacrilex (nicotina equivalente)	5,9 (1,18)	0,59 (0,12)
Gelatina pharma 100 PS 30	320	32
Maltitol líquido	315	31,5
Ácido ascórbico	0,5	0,05

Ingrediente	Cantidad (g)	% en peso
Propilparabeno	1,0	0,1
Sacarina sódica	2,6	0,26
Menta spearmint	6,0	0,6
Agua purificada	299	29,9
Monoetanolamina	50,0	5
TOTAL	1000	100

Se calentó el agua purificada a 75°C y se incorporaron en primer lugar el propilparabeno y la sacarina, a continuación la gelatina, agitando hasta obtener una mezcla homogénea. Entonces se añadió el ácido ascórbico y la
5 monoetanolamina bajo agitación, finalmente se incorporó a la mezcla la nicotina, el maltitol y la menta, agitando hasta completa homogeneización.

Se depositó la mezcla en el molde a razón de 1,7 g por unidad, equivalente aproximadamente a 2 mg de nicotina en cada pastilla blanda, se incorporó el palo a modo de asidero y se dejó enfriar.

10 Se desmoldearon las pastillas blandas con el palo y se dejaron secar a temperatura ambiente.

Ejemplo 2: Producto sustitutivo del tabaco

Se preparó un producto sustitutivo del tabaco según la presente invención empleando los siguientes ingredientes:

Ingrediente	Cantidad (g)	% en peso
Nicotina polacrilex	5,9	0,59

Ingrediente	Cantidad (g)	% en peso
(nicotina equivalente)	(1,18)	(0,12)
Gelatina pharma 100 PS 30	380	38
Sorbitol líquido	260	26
Ácido ascórbico	0,5	0,05
Nipagin M sódico	1,0	0,1
Aspartamo	2,5	0,25
Esencia de Eucalipto	6,1	0,61
Agua purificada	294	29,4
Fosfato sódico dibásico	50,0	5
Fosfato sódico monobásico	0,05	0,005
TOTAL	1000	100

Para la preparación de esta composición se siguió un procedimiento análogo al descrito en el Ejemplo 1, pero utilizando sorbitol como saborizante. Nipagin M sódico como conservante, aspartamo como edulcorante, esencia de eucalipto como aromatizante y una mezcla de fosfato sódico dibásico y fosfato sódico monobásico como agente regulador del pH, en lugar de maltitol, propilparabeno, sacarina, menta spearmint y monoetanolamina, respectivamente.

Ejemplo 3: Producto sustitutivo del tabaco

Se preparó un producto sustitutivo del tabaco según la presente invención empleando los siguientes ingredientes:

Ingrediente	Cantidad (g)	% en peso
Nicotina polacrilex (nicotina equivalente)	5,9 (1,18)	0,59 (0,12)
Gelatina pharma 100 PS 30	315	31,5
Sorbitol líquido	310	31,0
Butilhidroxianisol	0,5	0,05
Nipagin M sódico	1,0	0,1
Sacarina sódica	3,0	0,3
Menta spearmint	7,6	0,76
Agua purificada	307	30,7
Fosfato sódico dibásico	50,0	5
Fosfato sódico monobásico	0,05	0,005
TOTAL	1000,05	100

5 También para la preparación de este producto se siguió un procedimiento análogo al descrito en el Ejemplo 1, pero utilizando sorbitol como saborizante, butilhidroxianisol como antioxidante, Nipagin M sódico como conservante y una mezcla de fosfato sódico dibásico y fosfato sódico monobásico como

regulador del pH, en lugar de maltitol, ácido ascórbico, propilparabeno y monoetanolamina, respectivamente.

REIVINDICACIONES

1. Pastilla blanda de nicotina, caracterizada porque comprende:
 - a) nicotina o un derivado de nicotina en una cantidad comprendida entre el 0,05% y el 1%;
 - b) gelatina en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%;
 - c) un agente saborizante en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%; y
 - d) un agente antioxidante en una cantidad comprendida entre el 0,025% y el 0,2%; en donde los porcentajes están expresados en peso con respecto al peso total de la pastilla blanda.
2. Pastilla blanda según la reivindicación 1, caracterizada porque el derivado de nicotina es nicotina polacrilex.
3. Pastilla blanda según la reivindicación 1 ó 2, caracterizada porque contiene una dosis de nicotina o de un derivado de nicotina comprendida entre 1 mg y 5 mg, expresado como peso equivalente de nicotina.
4. Pastilla blanda según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizada porque el agente saborizante se selecciona de entre sorbitol, maltitol, manitol, eritritol, dextrosa, maltosa, xilitol y mezclas de los mismos.
5. Pastilla blanda según la reivindicación 4, caracterizada porque el agente saborizante es sorbitol.
6. Pastilla blanda según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizada porque el agente antioxidante se selecciona de entre butilhidroxianisol, alfa-tocoferol, ácido ascórbico, metionina, butilhidroxitolueno y mezclas de los mismos.
7. Pastilla blanda según la reivindicación 6, caracterizada porque el agente antioxidante es butilhidroxianisol.

8. Pastilla blanda según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizada porque adicionalmente comprende un agente conservante.
9. Pastilla blanda según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizada porque adicionalmente comprende una sustancia
5 edulcorante.
10. Pastilla blanda según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizada porque adicionalmente comprende un agente regulador del pH.
11. Pastilla blanda según la reivindicación 10, caracterizada porque el agente
10 regulador del pH se selecciona de entre fosfato sódico dibásico, fosfato sódico monobásico, carbonato sódico, bicarbonato sódico, monoetanolamina, dietanolamina, trietanolamina, solución de amoníaco, carbonato cálcico, hidróxido cálcico y mezclas de los mismos.
12. Pastilla blanda según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, caracterizada porque comprende:
15
 - a) nicotina polacrilex en una cantidad comprendida entre el 0,05% y el 1%, expresada como nicotina equivalente;
 - b) gelatina en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%;
 - c) sorbitol en una cantidad comprendida entre el 20% y el 50%;
 - 20 d) un agente antioxidante en una cantidad comprendida entre el 0,025% y el 0,2%;
 - e) un agente conservante en una cantidad comprendida entre el 0,05% y el 0,2%;
 - f) una sustancia edulcorante en una cantidad comprendida entre el 0,1% y
25 el 0,5%;
 - g) un agente regulador del pH en una cantidad comprendida entre el 2,5% y el 7,5%,

en donde los porcentajes están expresados en peso con respecto al peso total de la pastilla blanda.

- 13.** Pastilla blanda según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, caracterizada porque adicionalmente contiene un agente aromatizante.
- 14.** Producto sustitutivo del tabaco caracterizado porque consiste en una pastilla blanda según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 tiene parcialmente insertado un palo con una función de soporte o asidero.
- 15.** Procedimiento para preparar el producto sustitutivo del tabaco según la reivindicación 14, caracterizado porque comprende las siguientes etapas:
- a) disolver la gelatina en agua purificada previamente calentada a una temperatura comprendida entre 50°C y 90°C;
 - b) añadir el agente antioxidante a la mezcla anterior;
 - c) añadir la nicotina o el derivado de nicotina y el agente saborizante; y
 - d) distribuir en moldes, disponer el palo y dejar enfriar hasta temperatura ambiente.
- 16.** Procedimiento según la reivindicación 15, caracterizado porque en cualquiera de las etapas a), b) o c) se incorpora un componente adicional seleccionado de entre el grupo formado por agentes edulcorantes, agentes conservantes, agentes reguladores del pH, aromatizantes y mezclas de los mismos.



- ②① N.º solicitud: 201201267
②② Fecha de presentación de la solicitud: 21.12.2012
③② Fecha de prioridad:

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TÉCNICA

⑤① Int. Cl.: **A61K31/465** (2006.01)
A61K9/20 (2006.01)

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑤⑥ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
A	US 20100124560 A1 (ANDREAS HUGERTH et al.) 20.05.2010, página 8, columna 1, línea 31 – página 10, columna 1, línea 30.	1-16
A	WO 2012035541 A1 (J.B. CHEMICALS AND PHARMACEUTICALS LIMITED) 22.03.2012, página 1, línea 32 – página 9, línea 33.	1-16
A	WO 2011139811 A1 (NICOCOVUN USA, INC.) 10.11.2011, reivindicaciones 9-22.	1-16

Categoría de los documentos citados

X: de particular relevancia

Y: de particular relevancia combinado con otro/s de la misma categoría

A: refleja el estado de la técnica

O: referido a divulgación no escrita

P: publicado entre la fecha de prioridad y la de presentación de la solicitud

E: documento anterior, pero publicado después de la fecha de presentación de la solicitud

El presente informe ha sido realizado

☒ para todas las reivindicaciones

☐ para las reivindicaciones nº:

Fecha de realización del informe
20.11.2013

Examinador
M. Ybarra Fernandez

Página
1/4

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido de los símbolos de clasificación)

A61K

Bases de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizados)

INVENES, EPODOC

Fecha de Realización de la Opinión Escrita: 20.11.2013

Declaración

Novedad (Art. 6.1 LP 11/1986)	Reivindicaciones 1-16	SI
	Reivindicaciones	NO
Actividad inventiva (Art. 8.1 LP11/1986)	Reivindicaciones 1-16	SI
	Reivindicaciones	NO

Se considera que la solicitud cumple con el requisito de aplicación industrial. Este requisito fue evaluado durante la fase de examen formal y técnico de la solicitud (Artículo 31.2 Ley 11/1986).

Base de la Opinión.-

La presente opinión se ha realizado sobre la base de la solicitud de patente tal y como se publica.

Consideraciones:

El objeto de la presente invención es una pastilla blanda de nicotina sustitutiva del tabaco provista de un palo que comprende: a.- nicotina o un derivado de nicotina, b.- gelatina, c.- un agente saborizante, y d.- un agente saborizante en unas cantidades determinadas (según reivindicación 1).

El derivado de nicotina utilizado es polacrilex, en dosis entre 1mg y 5mg. El agente saborizante principalmente usado es sorbitol. El agente antioxidante principalmente es butilhidroxianisol. Además se le añade un agente conservante, una sustancia edulcorante y un agente regulador del pH.

Además reivindica su procedimiento de preparación (reivindicaciones 15-16).

1. Documentos considerados.-

A continuación se relacionan los documentos pertenecientes al estado de la técnica tomados en consideración para la realización de esta opinión.

Documento	Número Publicación o Identificación	Fecha Publicación
D01	US 20100124560 A1 (ANDREAS HUGERTH et al.)	20.05.2010
D02	WO 2012035541 A1 (J.B. CHEMICALS AND PHARMACEUTICALS LIMITED)	22.03.2012
D03	WO 2011139811 A1 (NICOCOVUN USA, INC.)	10.11.2011

El documento US 2010/0124560 reivindica una dosificación intra-oral de múltiples porciones, en donde al menos una porción se desintegra rápidamente y al menos una porción es de desintegración lento, por lo que el tiempo de desintegración para la parte más lenta es al menos dos veces más largo que para los de más rápida desintegración. Reivindica también el uso de los marcadores / señales sensoriales como ayudas. También se contemplan un método y un sistema para el suministro de agentes activos, tales como la nicotina y / o metabolitos de los mismos, tales como la cotinina, N '-óxido de nicotina, nornicotina, (S)-nicotina-N-[beta]-glucurónido y mezclas, isómeros, sales y complejos de los mismos así como el uso y la producción de dichas formulaciones. El derivado de nicotina que utiliza el polacrilex, utilizando además saborizantes y otros productos.

En la patente WO 2012/035541 se describen formas sólidas de dosificación oral que contiene una cantidad efectiva terapéuticamente de nicotina, específicamente polacrilex, ácido cítrico monohidratado, sacarosa y glucosa líquida. La forma de dosificación que reivindica preferentemente es una forma sólida.

La patente WO2011139811 reivindica una composición destinada a ser empleado con fines terapéuticos que incorpora la nicotina y al menos un otro compuesto nicotínico. Las formas representativas de la nicotina pueden ser tanto una base libre (por ejemplo, como una mezcla de nicotina y celulosa microcristalina, como una forma de sal de nicotina (por ejemplo, en forma de bitartrato de nicotina) o como polacrilex de nicotina.

El otro compuesto nicotínico es un compuesto que puede unirse selectivamente a ciertos subtipos de receptores nicotínicos, y en particular los del sistema nervioso central, como por ejemplo, un compuesto que se une selectivamente al receptor nicotínico $\alpha 7$ subtipos o $\alpha 4\beta 2$.

La composición es útil para el tratamiento de condiciones del sistema nervioso central, enfermedades y trastornos, y como una terapia de reemplazo de nicotina.

2. Declaración motivada según los artículos 29.6 y 29.7 del Reglamento de ejecución de la Ley 11/1986, de 20 de marzo, de Patentes sobre la novedad y la actividad inventiva; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración

La invención reivindicada difiere principalmente de los documentos citados en que ninguno utiliza cantidades tan bajas del derivado de nicotina polacriles.

Así, la invención reivindicada implica un efecto mejorado comparado con el estado de la técnica. Por lo tanto la patente objeto de examen, cumple con los requisitos de novedad y actividad inventiva.