



No. 12-132681- -00001-0000

Fecha: 2012-11-28 16:29:38 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 400 OPOSIOBSERVTER Folios: 25

**DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**  
**PRESENTACIÓN DE OPOSICIÓN**

**1. Oposición a solicitud de:**

☒ Patente de invención

☐ Registro de Diseño Industrial

☐ Patente de Modelo de Utilidad

Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

Número de expediente: 12-132-681.

Solicitante: JATIN VASANT THAKKAR.

Apoderado: GERMAN MARIN RUALES.

Título de la Nueva Creación: PASTILLAS DE GELATINA BLANDA CON NICOTINA.

Gaceta: 651 de 31 de agosto de 2012, No. de publicación 1280.

**2. Datos del Opositor**

Persona Natural

☐

Persona Jurídica

☒

TECNOQUIMICAS S.A.

Nombre o denominación / Razón social completa

Documento de identificación: C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☒ Otro ☐ Cuál \_\_\_\_\_

Número 890 300 466-5.

Dirección: Calle 23 No. 7-39 Ciudad Cali

Teléfono (092) 882.55.55 Fax: (092) 883.88.59 E-mail: \_\_\_\_\_

☐

Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

**3. Datos del representante o apoderado:**

REYES VILLAMIZAR JOSE LUIS

79'152.473

44655

Apellidos y Nombre

Documento de identificación

T.P. No.

Dirección del representante

Cra 17 No. 88-23 Of.205

Dirección electrónica

info@reyes-abogados.com

No. Fax

621.25.42

Número telefónico

621.26.31

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación

6. Fundamentos de la oposición

Causal: Incumplimiento de requisitos de patentabilidad (Título II, Capítulo I, Decisión 486 de 2000)

\_\_\_\_\_  
\_\_\_\_\_  
\_\_\_\_\_

Justificación: VER ANEXO

\_\_\_\_\_  
\_\_\_\_\_  
\_\_\_\_\_

Prórroga:

SI

☒

NO

☐

7. Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la solicitud No. \_\_\_\_\_ Fecha: \_\_\_\_\_

☒

Poder, si fuera el caso con el que se acredita la representación.

☒

Pruebas de los fundamentos de la oposición

☒

Copias para traslado

8. Firma

JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR

Firma

79.152.473

C.C.

44655

T.P.

Nombre y apellidos

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.

---

REF: Expediente 12-132-681

TÍTULO SOLICITADO: PASTILLAS DE GELATINA BLANDA CON NICOTINA.

PUBLICACIÓN: Gaceta 651 de 31/08/2012, N° de publicación 1280.

PRIORIDAD: IN 452/MUM/2010 de 18/02/2010

SOLICITANTE: JATIN VASANT THAKKAR.

APODERADO: GERMAN MARIN RUALES

TRÁMITE: PRESENTACIÓN DE OPOSICIÓN

**JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR**, mayor de edad, identificado como aparece al pie de mi firma, abogado en ejercicio, titular de la tarjeta profesional número 44655 del Consejo Superior de la Judicatura, obrando en calidad de apoderado de la sociedad **TECNOQUIMICAS S.A.**, en ejercicio de lo dispuesto por el artículo 42 de la Decisión 486 de 2000, muy respetuosamente me permito formular la siguiente

**I. PETICIÓN**

Sírvase negar el beneficio patentario a la solicitud contenida en el expediente 12-132-681, por no cumplir con lo dispuesto en la Decisión 486 de 2000, con base en los argumentos que se expondrán a continuación.

**II. LEGÍTIMO INTERÉS**

Asiste a **TECNOQUIMICAS S.A.**, legítimo interés para presentar esta oposición, pues la eventual concesión de la solicitud restringiría injustificadamente el empleo de ciertas sustancias, derivados y procesos que a nuestro juicio carecen de nivel

inventivo, en detrimento de sus legítimos intereses comerciales. De igual manera mis clientes están interesados, por su misma condición de industrias farmacéuticas, en evitar la concesión de privilegios de patente que incumplan los requisitos materiales de patentabilidad establecidos en las normas vigentes, y que supongan un riesgo para la libre competencia.

### **III. FUNDAMENTOS DE LA OPOSICIÓN**

La solicitud en curso, que se refiere a una pastilla blanda que contiene principio activo de nicotina en una cantidad de entre 0.05% y un 1% de la masa de la pastilla, carece de los requisitos fundamentales para otorgársele el privilegio de patente de invención, tal y como nos disponemos a demostrar a continuación:

En primer lugar, las reivindicaciones 5, 7 y 10 mencionan de nuevo el mismo excipiente ya mencionado en la respectiva reivindicación anterior (gelatina, glicerina y lecitina, respectivamente), es decir, replica innecesariamente contenido técnico, lo que contraviene lo relacionado a la concisión tal como lo expone el artículo 30 de la Decisión 486 de 2000. Al respecto, el Manual Andino de Patentes (MAP) expresa lo siguiente:

En cuando a las reivindicaciones dependientes, su función es evitar repetir innecesariamente todas las características de nuevo para cada reivindicación. El número de reivindicaciones dependientes debe ser razonable en función de las alternativas a proteger, se debe objetar si hay multiplicidad de reivindicaciones de naturaleza trivial.

Queda claro, entonces, que el capítulo reivindicatorio de la solicitud en cuestión, no cumple con el mencionado requisito de concisión.

En un segundo aspecto, y teniendo ahora en cuenta los excipientes que se han mencionado como plastificantes, edulcorantes, agentes liberadores (desintegrantes), conservantes, saborizantes tanto en la reivindicación 1, como en las reivindicaciones 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12 y 13, carecen de nivel inventivo, puesto que todas estas funciones atribuidas a los correspondientes excipientes mencionados son convencionales y hacen parte del estado de la técnica, como cualquier persona versada en la formulación de productos farmacéuticos debe

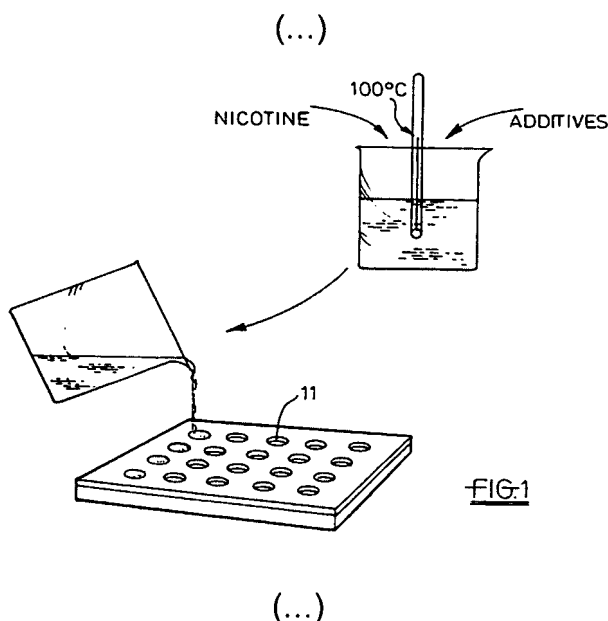
reconocer, en especial si se relacionan con procesos de fabricación de formulaciones farmacéuticas orales<sup>1</sup>.

Finalmente, podemos demostrar a través de documentos publicados con anterioridad a la fecha de prioridad de la solicitud en cuestión, que el contenido de las reivindicaciones presentadas carece de los requisitos fundamentales para podersele otorgar el privilegio de patente de invención, veamos:

En primer lugar, la patente británica GB 2299756 publicada el 16 de octubre de 1996 revela:

**(54) Gelatinous pastille containing nicotine**

(57) The pastilles contain nicotine in an acacia gum or gelatine base and thus have a jelly-like consistency. The pastilles may be formed into bars or be cigarette shaped and contain nicotine dissolved in alcohol such a spirit or liqueur. Alternative flavourings such as aniseed or peppermint may be used and vitamins may also be included. The pastilles overcome the disposal problems and social unacceptability of chewing gums.



<sup>1</sup> Vila Jato J.L. Tecnología Farmacéutica. Volumen II. Páginas 91 a 105.

By "gelatinous" is meant "having the character or consistency of a jelly", more particularly of a chewable or suckable "wine gum" type of product which would be retained in the mouth whilst dissolving and not broken into fragments by chewing, generally starting off at too large a size to be readily swallowed.

The material from which the pastille is made may in fact be gelatine, or may comprise acacia gum with sorbitol, or may comprise other starches.

(...)

The nicotine may be present in the form of a nicotine salt or pure nicotine, which may be in solution e.g. in alcohol.

(...)

The invention also comprises a method for making the product comprising adding nicotine to dissolved gelatine and allowing the gelatine (or other material) to dry in pastille moulds. The nicotine may be added after the gelatine, originally dissolved in hot water, has cooled to below, say, 60°C, to avoid undue nicotine

(...)

Traces of vitamins, particularly vitamin A, C and E, may be added as may dextrose and flavourings such as aniseed and/or peppermint.

(...)

1. A nicotine-containing product for oral ingestion comprising a gelatinous pastille.

2. A product according to claim 1, comprising gelatine.

3. A product according to claim 1 or claim 2, comprising acacia gum.

4. A product according to claim 2 or claim 3, comprising sorbitol or other starches.

(...)

8. A product according to any one of claims 1 to 7, in which the nicotine is incorporated as a nicotine salt or complex.

9. A product according to any one of claims 1 to 8, including a flavouring.

(...)

17. A product according to any one of claims 1 to 16, containing a sugar such as dextrose.

18. A method for making a nicotine containing product for oral ingestion comprising adding nicotine to liquid, dryable gelatinous material, filling pastille moulds with the liquid material and allowing it to dry in the moulds.

(...)

Por su parte, la patente española ES 2048510 publicada el 02 de septiembre de 1992 revela:

En la Patente USA PA 3 901 248 se da a conocer un compuesto substitutivo de la goma de mascar tabaco en forma de una goma de mascar que contiene nicotina. Este compuesto comprende aproximadamente de 15 a 80 % de base goma y una resina de intercambio catiónico de nicotina en forma compleja dispersa en la base. El complejo de resina de intercambio catiónico constituye hasta aproximadamente 10 % del compuesto de goma de mascar y aporta una liberación de nicotina, cuando se efectúa la acción de mascar, que es aproximadamente la que se consigue en la acción de fumar un cigarrillo convencional.

(...)

De acuerdo con la presente invención se puede obtener la liberación controlada de nicotina y una liberación de ingredientes opcionales tales como aditivos de sabor y aroma de estimulación de nicotina sin fumar, mediante una unidad estimuladora soluble en la saliva que comprende un gel preparado por gelificación de un agente gelificante aglomerante en agua; nicotina u otros alcaloides con la misma dirección de actividad; y opcionalmente ingredientes tales como aditivos de sabor y aroma; y poseyendo unas características de textura bien definida, tal como se ha indicado más adelante, comprendiendo una serie de propiedades mecánicas, por ejemplo, consistencia, dureza, fragilidad, adherencia, elasticidad y carácter cohesivo; y poseyendo una concentración previamente seleccionada de nicotina o de dichos alcaloides.

(...)

nicotina (3-(1-metil-2-pirolidinil)-piridina) incluyéndose nicotina sintética y extractos de nicotina procedentes de plantas de tabaco, tales como el género *Nicotiana*; y otros alcaloides con la misma dirección de actividad incluyendo nornicotina y lobelina, por ejemplo de las especies *Lobeliaceae* y *Lobelia*; metilanabasina y anabasina; solas o en combinación; y en la forma de base libre de sales por añadidura de ácidos farmacológicamente aceptables.

(...)

Además, el ingrediente activo puede incluir varios productos de oxidación tales como nicotina-1'-N-óxido.

(c) Agente gelificante aglomerante en agua

Un importante factor para obtener la textura deseada de la unidad estimulante de acuerdo con la presente invención consiste en la elección de un agente gelificante aglomerante en agua adecuado.

De acuerdo con la presente invención el agente gelificante aglomerante en agua se puede seleccionar del grupo que consiste en:

agentes de gelificación orgánicos incluyendo gelatina, almidón modificado y sin modificar; y gomas incluyendo agar, alginato, goma arábica, goma caroba, carrageno, goma ghatti, goma guar, goma karaya, pectina, goma tragacanto, goma de algarrobilla, y goma xantano.

Los agentes gelificantes preferentes comprenden goma arábica, almidón, gelatina, agar y pectina. Particularmente para gomas duras es preferible sólo goma arábica constituyendo aproximadamente 50-70 % del total de materias sólidas. No obstante, para compuestos estimulantes más blandos se pueden utilizar simultáneamente otro agente gelificante por ejemplo, gelatina, más que un agente de gelificación aglomerante en agua.

(...)

Los edulcorantes pueden comprender uno o varios azúcares sintéticos o naturales, es decir cualquier forma de carbohidratos adecuada para su utilización como edulcorante en la fabricación de productos de pastelería.

De acuerdo con la invención los edulcorantes se pueden seleccionar entre el grupo que consiste en: azúcares únicos incluyendo azúcares extraídos a partir de caña de azúcar y remolacha azucarera (sacarosa), dextrosa (llamada también glucosa), fructosa (llamada también levulosa), y lactosa (llamada también leche del azúcar); sorbitol, manitol, glicerol, xilitol, sacarina sódica; y mezclas de azúcares incluyendo jarabe de glucosa, por ejemplo hidrolizados de almidón, conteniendo una mezcla de dextrosa, maltosa y una serie de azúcares complejos, jarabe de inversión de azúcar, por ejemplo sacarosa invertida por invertasa (también llamada sucrasa o sacarasa) conteniendo una mezcla de dextrosa y fructosa, jarabes con alto contenido de azúcares, tales como melazas y miel conteniendo una determinada mezcla de levulosa, dextrosa, maltosa, sacarosa, resinas, dextrina y azúcares superiores, y extractos de malta.

## “Aditivos de sabor y aroma”

Los aditivos de sabor y aroma pueden comprender uno o varios agentes sintéticos o naturales de sabor y de aroma.

De acuerdo con la invención los agentes de sabor y aroma se pueden seleccionar entre aceites esenciales incluyendo destilados, extracciones mediante disolventes, o expresiones en frío de flores cortadas, hojas, piezas de fruta completas peladas o en pulpa comprendiendo mezclas de alcoholes, ésteres, aldehídos y lactones;

esencias comprendiendo cualesquiera soluciones diluídas de aceites esenciales, o mezclas de productos químicos sintéticos mezclados para adecuarse al sabor natural de la fruta, por ejemplo fresa, frambuesa, casis; sabores artificiales y naturales de preparaciones y licores, por ejemplo coñac, whisky, ron, ginebra, jerez, oportos y vinos; tabaco, café, té, cacao y menta. zumos de frutas incluyendo zumos expulsados por frutas lavadas, sometidas a limpieza tales como limones, naranjas y limas; licoriza, mentol, eucalipto, semillas de anís, bayas (por ejemplo, cacahuètes, cocos, avellanas, castañas, nueces de nogal, nueces “cola”), almendras, pasas; y

(...)

## MATERIAS PRIMAS

Jarabes de dextrosa, Glycosum Liquidum, (Lote n° 302 589) Mecobenzon, Dinamarca;  
Azúcar (preferentemente azúcar fundido o “caster”), Dansukker Melis, DDS, Dinamarca;  
Goma arábiga (limpia) Gummi Arabicum (polvo químicamente puro) LK (E414), (lote n° 233 200), Nordisk Droge Handels A/S, Dinamarca;  
Gelatina (215 preferentemente floró “bloom”), polvo de gelatina 215 B (lote n° 232 883), Nordisk Droge Handels AIS, Dinamarca;  
Agua del grifo  
Polvo de tabaco, tabaco granulado o tabaco de pipa “mitad y mitad”, American Branch;  
Acido cítrico;  
Esencia de menta;  
Anís;  
Esencia de almendras; y  
Cacao.

(...)

1. Unidad estimulante soluble en saliva que comprende un ingrediente activo, e ingredientes opcionales que comprenden aditivos de sabor y aroma incorporados en un gel preparado por gelificación de un agente gelificante aglomerante en agua, en el cual el ingrediente activo comprende nicotina u otros alcaloides con la misma dirección de actividad, poseyendo dicha unidad:

(...)

5. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-3, **caracterizada** porque el agente gelificante es seleccionado del grupo que consiste en agar, algina, carrageno, goma guar, goma arábica, goma ghatti, goma de tragacanto, goma karaya, goma de garrofina, pectina, goma xantano, particularmente goma arábica y carrageno, preferentemente goma arábica.

6. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-5, **caracterizada** porque los aditivos de sabor y aroma comprenden uno o más agentes naturales o sintéticos de sabor seleccionados entre aceites esenciales, esencias, jugos de frutas y materiales en polvo, harinas o materiales vegetales triturados incluyendo tabaco, café, té y menta.

(...)

Como se puede apreciar claramente en estas dos anterioridades, la elaboración de formulaciones sólidas para la administración oral de nicotina, a través de formulaciones blandas compuestas principalmente de sustancias o agentes gelificantes (carragenano y gelatina) ya se habían utilizado con anterioridad. Así mismo, otros compuestos tales como glicerina, sorbitol, almidón, sacarosa, dextrosa y agentes saborizantes ya se habían incluido en este tipo de formulaciones. También es relevante mencionar que dichas formulaciones se preparan a través del moldeo de la mezcla fundida de dichos componentes.

Independientemente de las coincidencias de los excipientes mencionados por estas anterioridades y la solicitud en cuestión, que claramente afectan la novedad de dichos aspectos, específicamente en las reivindicaciones 2, 3, 4, 5, 6, 9, 11, 13, y 14, la información recopilada en la totalidad de estos dos documentos resultan ser una clara guía para cualquier persona versada en la formulación de productos farmacéuticos, para la obtención de formulaciones del mismo tipo que las reivindicadas por la solicitud colombiana en trámite, por lo que es evidente la carencia de nivel inventivo.

Así las cosas y por todo lo anterior, ruego se analicen los argumentos expuestos con el rigor y detenimiento habituales y que en consecuencia se decrete, además de la negación de la solicitud en comento, el archivo del expediente que la contiene.

#### **IV. FUNDAMENTOS DE DERECHO**

Son fundamentos de derecho el Capítulo I, (Requisitos de Patentabilidad) y el artículo 42 (Oposiciones) de la Decisión 486 de 2000.

**V. SOLICITUD DE PLAZO EXTRA PARA SUSTENTAR LA OPOSICIÓN**

En desarrollo de lo dispuesto por el artículo 42, inciso 2º de la Decisión 486, solicito comedidamente a su Despacho el plazo adicional de sesenta días para sustentar la presente oposición. Para los anteriores efectos, me permito anexar la constancia de pago correspondiente.

**VI. PRUEBAS**

- La patente británica GB 2299756 publicada el 16 de octubre de 1996.
- La patente española ES 2048510 publicada el 2 de septiembre de 1992.

**VII. ANEXOS**

Para efectos del trámite correspondiente, me permito anexar al presente escrito los siguientes anexos:

1. Poder para actuar.
2. Constancia de pago de las tasas de tramitación de oposición.
3. Constancia de pago para sustentar la solicitud de prórroga a que se refiere el artículo 42, inciso 2º de la Decisión 486.
4. Copia para correr traslado al solicitante.
5. El mencionado en el acápite de pruebas.

**VIII. NOTIFICACIONES**

El suscrito recibirá notificaciones en la secretaría de su Despacho o en mi oficina localizada en la Carrera 17 No. 88-23, Oficina 205, Fax (1) 621.25.42 de esta ciudad. Tecnoquímicas S.A. las recibirá en sus oficinas localizadas en la Calle 23 N° 7-39 de Cali.

Señor Superintendente,



**JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR**

C.C. 79'152.473 de Usaquén

T.P.A. 44.655 del C.S.J.

AA 3286877  
LIBRANA RAMA  
NOTARIA TERCERA  
ENCUENADO  
12



ESCRITURA NUMERO CUATRO MIL QUINIENTOS -  
TREINTA Y NUEVE (No.4.539) -----  
En la ciudad de Cali, Capital del Depar-  
tamento del Valle del Cauca, República de  
Colombia, a los VEINTITRES (23) días -  
del mes de OCTUBRE del año DOS MIL UNO --

|                                                                                          |
|------------------------------------------------------------------------------------------|
| (2.001), ante mí, JORGE ENRIQUE CAICEDO ZAMORANO, Notario                                |
| T E R C E R O (3o.) del Círculo de Cali, - - - - -                                       |
| - - - - -                                                                                |
| - - - - -                                                                                |
| compareció JUAN MANUEL BARBERI OSPINA mayor de edad, vecino de Cali,                     |
| identificado con la cédula de ciudadanía número 14.949.561 de Cali, y dijo: -----        |
| PRIMERO.- Que obra en su carácter de Representante Legal de en nombre y                  |
| representación de TECNOQUIMICAS S.A. sociedad comercial organizada y existente           |
| conforme a las leyes colombianas, con domicilio y sede principal en Cali constituida     |
| por escritura pública número 2670 de la Notaría Segunda de Cali de fecha 12 de           |
| junio de 1957, reformada en distintas oportunidades, según consta en el certificado      |
| expedido por la Cámara de Comercio de Cali -----                                         |
| SEGUNDO: Que en tal carácter, por este público instrumento, concede Poder Especial       |
| pero amplio y suficiente a JOSE LUIS REYES VILLAMIZAR, mayor de edad, vecino de          |
| Bogotá, identificado con C.C. # 79.152.473 de Isaquén, abogado en ejercicio, portador    |
| de la T.P 44655 del C.S.de la J., domiciliado en Bogotá, D.C., República de Colombia     |
| con dirección carrera 7 No. 88.23 oficina 205, de la misma ciudad, como su representante |
| con poder especial, amplio y suficiente, para obtener la protección de nuestra propiedad |
| industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto lo autorizo, para que nos      |
| represente ante cualesquiera entidad o persona, ejerzan o no jurisdicción, especialmente |
| ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, en todo lo     |
| concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención, formulación de observaciones y      |
| oposición a patentes de invención, modelos y dibujos industriales y el registro de       |
| licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad,   |
| medidas cautelares, concesión de licencias y en general los procesos civiles, penales,   |
| administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos u otros de |
| diferente naturaleza; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan; y c) para   |

Como Notario Veintitres de este Círculo  
hago constar que esta fotocopia coincide  
con su fotocopia auténtica que se tiene  
a la vista.  
113 AGO 2007  
WILLY VALEK MORA  
NOTARIO VEINTITRES  
Bogotá D.C. Colombia

4539  
OCT 23

LUZ MERY CORREA  
ELABORACION DE ESCRITURAS  
Notaria 3 de Cali

que en todos los asuntos arriba determinados, , tanto en los términos señalados por los artículos 42 y complementarios de la Decisión 486 de la Comunidad Andina como del artículo 70 del C.P.C pueda sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos y ceder a título gratuito y/o oneroso, licenciar, inscribir contratos de cesión y de licencia, inscripción de prendas, levantamiento de prendas, inscribir derechos de retención y en general todos los asuntos que se deban tramitar ante la Superintendencia de Industria y Comercio.-----

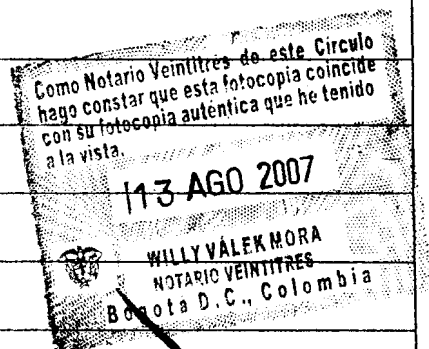
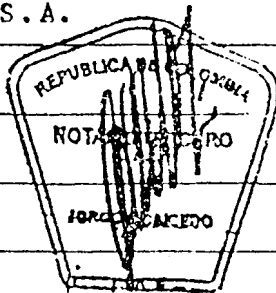
Leído el presente instrumento al otorgante, lo aprobó y en constancia firma conmigo el Notario de todo lo cual doy fe.-----

Se agregan comprobantes. Derechos \$30.000.00 Decreto 1681 de Septiembre 16 de 1996. Reformado mediante Resolución No.5839 de Diciembre 27 del año 2.000 y Decreto 1326 de Julio 06 del año 2.001. Se corrió en la hoja número AA 3286877. ENMENDADO "OCTUBRE" VALE.

91 Juan m Barberi

JUAN MANUEL BARBERI OSPINA

En rep. de TECNOQUIMICAS S.A.



El Notario Tercero de Cali

Dr. JORGE ENRIQUE CAICEDO ZAMORANO

(12) **UK Patent Application** (19) **GB** (11) **2 299 756** (13) **A**

(43) Date of A Publication **16.10.1996**

|                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                               |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (21) Application No <b>9506386.3</b>                                                                                                                                | (51) INT CL <sup>6</sup><br><b>A61K 9/00 31/465</b>                                                                                                           |
| (22) Date of Filing <b>29.03.1995</b>                                                                                                                               | (52) UK CL (Edition O )<br><b>A5B BLE B180 B29X B29Y B30Y B302 B31X B31Y B827 B830 U1S S1328 S1344</b>                                                        |
| (71) Applicant(s)<br><b>Gilbert Falkingham Clayton</b><br><b>63a Woodlawn Road, LONDON, SW6 6PS,</b><br><b>United Kingdom</b>                                       | (56) Documents Cited<br><b>GB 2142822 A      WO 91/06288 A1</b>                                                                                               |
| (72) Inventor(s)<br><b>Gilbert Falkingham Clayton</b>                                                                                                               | (58) Field of Search<br><b>UK CL (Edition O ) A5B BLE</b><br><b>INT CL<sup>6</sup> A61K 9/00 9/20 31/465</b><br><b>ONLINE: CAS ONLINE, WPI, JAPIO, CLAIMS</b> |
| (74) Agent and/or Address for Service<br><b>McNeight &amp; Lawrence</b><br><b>Regent House, Heaton Lane, STOCKPORT, Cheshire,</b><br><b>SK4 1BS, United Kingdom</b> |                                                                                                                                                               |

(54) **Gelatinous pastille containing nicotine**

(57) The pastilles contain nicotine in an acacia gum or gelatine base and thus have a jelly-like consistency. The pastilles may be formed into bars or be cigarette shaped and contain nicotine dissolved in alcohol such a spirit or liqueur. Alternative flavourings such as aniseed or peppermint may be used and vitamins may also be included. The pastilles overcome the disposal problems and social unacceptability of chewing gums.

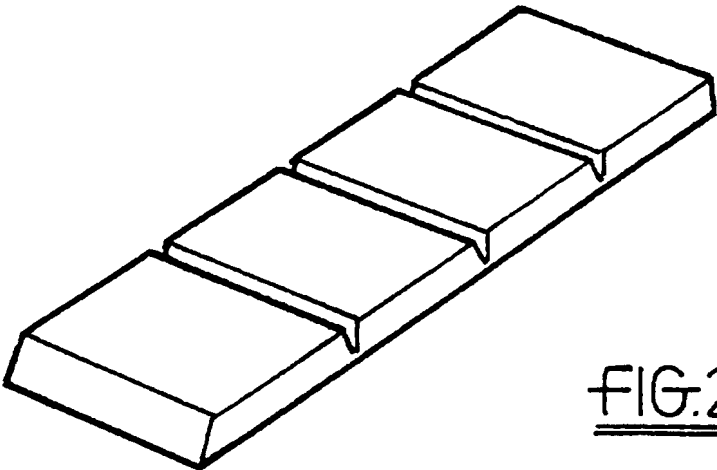


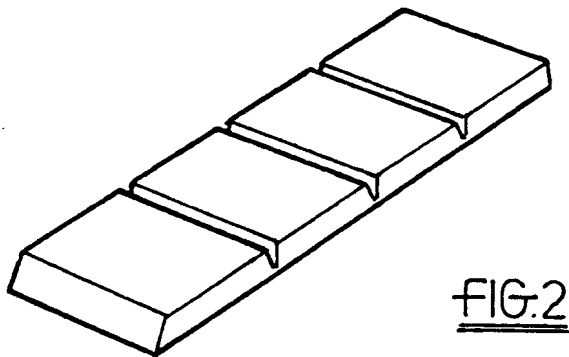
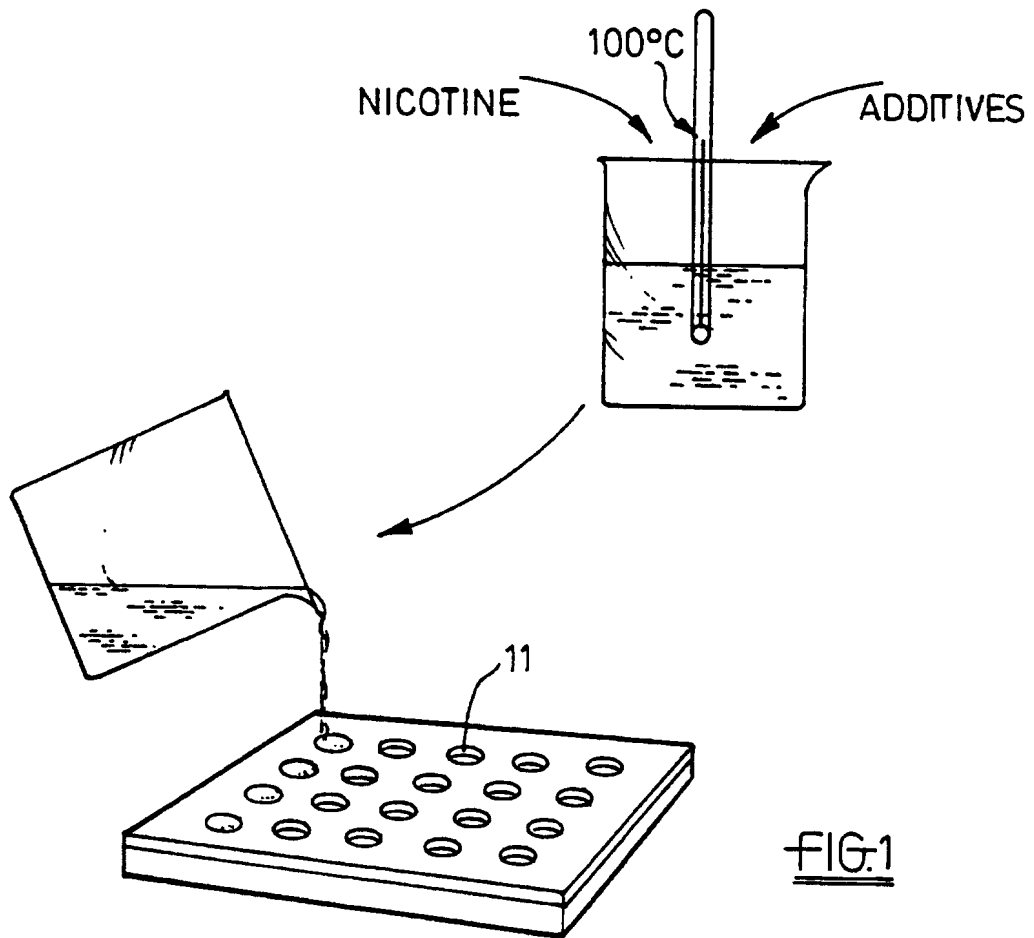
FIG.2

**GB 2 299 756 A**

At least one drawing originally filed was informal and the print reproduced here is taken from a later filed formal copy.

The claims were filed later than the filing date within the period prescribed by Rule 25(1) of the Patents Rules 1995

1/1



**NICOTINE-CONTAINING PRODUCT**

This invention relates to nicotine-containing products intended for use in therapy, as a smoking substitute or as an aid to quitting smoking.

Nicotine-containing products generally take the form of a chewing gum, though one product is available in the form of a small lozenge. The alternative nicotine replacement therapy product is a patch. Of the orally ingested products available, neither is totally satisfactory. The chewing gum has all the problems usually associated with chewing gum, including the disposal problem, and chewing is very often socially unacceptable. The small lozenge can be broken up by the action of chewing or even accidentally swallowed whole. The nicotine content is only effective if ingested by the buccal cavity tissues.

The present invention provides a new nicotine-containing product for oral ingestion which does not have the disadvantages of lozenges or chewing gum.

The invention comprises a nicotine-containing product for oral ingestion comprising a gelatinous pastille.

By "gelatinous" is meant "having the character or consistency of a jelly", more particularly of a chewable or suckable "wine gum" type of product which would be retained in the mouth whilst dissolving and not broken into fragments by chewing, generally starting off at too large a size to be readily swallowed.

The material from which the pastille is made may in fact be gelatine, or may comprise acacia gum with sorbitol, or may comprise other starches.

The nicotine may be present in the form of a nicotine salt or pure nicotine, which may be in solution e.g. in alcohol.

The pH may be controlled by a buffer to be at or substantially at normal mouth pH.

The product may be presented in a wrapping which seals in volatile nicotine.

The invention also comprises a method for making the product comprising adding nicotine to dissolved gelatine and allowing the gelatine (or other material) to dry in pastille moulds. The nicotine may be added after the gelatine, originally dissolved in hot water, has cooled to below, say, 60°C, to avoid undue nicotine

- 3 -

loss due to evaporation. Pure nicotine is quite volatile. A final nicotine content of about 0.5 mg per pastille may be aimed at, and an excess of nicotine may be loaded into the dissolved gelatine to compensate for evaporation during drying. The pastilles may need to be dried in the mould for several days.

Traces of vitamins, particularly vitamin A, C and E, may be added as may dextrose and flavourings such as aniseed and/or peppermint.

A pastille may be of such size and contain as much nicotine as will correspond to the time taken to smoke a cigarette and the amount of nicotine absorbed by the tissues of the buccal cavity during such time. A pastille may typically be of at least wine gum size, but may be fashioned in a different shape, perhaps in the shape of an ingot, and perhaps breakable into smaller pieces for ease of accommodation in the mouth while providing the requisite dosage of nicotine over the appropriate time.

Nicotine-containing products and methods for making them according to the invention will now be described with reference to the accompanying drawings, in which :-

Figure 1 is a diagrammatic representation of the methods;

and Figure 2 is a view of a pastille made by a method as illustrated in Figure 1.

The drawings illustrate nicotine-containing product for oral ingestion comprising a gelatinous pastille 11.

The nicotine can be present in the form of a nicotine salt or complex such for example as a complex of  $\beta$ -cyclodextrin ( $\beta$ -CD) and nicotine.

Gelatine is dissolved in hot (boiling) water as a first step and the solution allowed to cool down to 60°C. To the partially cooled solution is added the nicotine, whether as salt or complex or in the form of pure nicotine in solution e.g. in alcohol. The resulting nicotine-containing gelatinous solution is poured into moulds 11 and allowed to dry, over a time interval extending to perhaps several days.

The moulds 11 are of such shape and size as to result in a pastille of wine gum size and consistency that will be dissolved over a time period measured in minutes when ingested orally.

- 5 -

The nicotine content of the gelatinous solution will tend to evaporate during drying and an initial overprovision will normally be required in order to finish with a content of 0.5 mg per pastille in the dried product. The overprovision required can be readily determined by simple trial and error, and will depend upon the actual processing conditions, the temperatures used, the surface area of pastille exposed in the mould and so forth.

At the mixing stage any additives, fillers required can be added. Preferably trace quantities of one or more of vitamins A, C and E are included, as well as dextrose and flavourings.

For giving-up-smoking aids, mint and/or aniseed flavourings may be preferred, but a tobacco flavour could also be incorporated as could a spirit, liqueur or fortified wine or other alcoholic or non-alcoholic drink flavour could be incorporated.

The moulds 11 may mould disc-like pastilles, similar to wine gums, or shapes such as illustrated in Figure 2 can be made, namely a slim, elongated ingot shape with lines of weakness on which it can be broken into bite-sized pieces.

- 6 -

The pastilles will still be liable to some ongoing evaporation of their nicotine content, but this can be minimised by impervious packaging which will impart at least a reasonable shelf life.

CLAIMS

1. A nicotine-containing product for oral ingestion comprising a gelatinous pastille.
2. A product according to claim 1, comprising gelatine.
3. A product according to claim 1 or claim 2, comprising acacia gum.
4. A product according to claim 2 or claim 3, comprising sorbitol or other starches.
5. A product according to any one of claims 1 to 4, in which the nicotine is present in the form of pure nicotine.
6. A product according to claim 5, in which the nicotine is dissolved in alcohol.
7. A product according to claim 6, in which the alcohol is incorporated as a spirit, liqueur or fortified wine or other alcoholic drink.

· · · · ·

- 8 -

8. A product according to any one of claims 1 to 7, in which the nicotine is incorporated as a nicotine salt or complex.
9. A product according to any one of claims 1 to 8, including a flavouring.
10. A product according to claim 9, in which the flavouring is a tobacco flavouring.
11. A product according to any one of claims 1 to 10, presented in a wrapping which seals in volatile nicotine.
12. A product according to any one of claims 1 to 11, presented in a size and of such consistency that it will be dissolved over a time period of at least one minute when ingested orally.
13. A product according to any one of claims 1 to 12, presented in a shape and size approximating to a cigarette.
14. A product according to claim 13, in which the shape is rod - or bar-like and has zones of weakness allowing it to be broken into smaller pieces for convenient oral ingestion.

15. A product according to any one of claims 1 to 14, containing a final nicotine content in the range between 0.1 and 1.0 mg per pastille.

16. A product according to any one of claims 1 to 15, containing traces of vitamins.

17. A product according to any one of claims 1 to 16, containing a sugar such as dextrose.

18. A method for making a nicotine containing product for oral ingestion comprising adding nicotine to liquid, dryable gelatinous material, filling pastille moulds with the liquid material and allowing it to dry in the moulds.

19. A method according to claim 18, in which the gelatinous material comprises dissolved gelatine.

20. A method according to claim 19, in which the gelatine is dissolved in hot water which is then allowed to cool to a level which avoids undue nicotine loss through evaporation.

• • • • •

- 10 -

21. A method according to claim 21, in which the gelatine solution is allowed to cool to below 60°C before adding the nicotine.

22. A method according to any one of claims 18 to 21, in which an excess of nicotine over that required in the final product to compensate for evaporation during drying.



Application No: GB 9506386.3  
Claims searched: 1 to 20

Examiner: Mr S.J.Pilling  
Date of search: 22 July 1996

**Patents Act 1977**  
**Search Report under Section 17**

**Databases searched:**

UK Patent Office collections, including GB, EP, WO & US patent specifications, in:

UK CI (Ed.O): A5B (BLE)

Int CI (Ed.6): A61K 31/465, A61K 9/00, 9/20

Other: ONLINE: CAS ONLINE, WPI, JAPIO, CLAIMS

**Documents considered to be relevant:**

| Category | Identity of document and relevant passage                                                                                                                      | Relevant to claims  |
|----------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------|
| Y        | GB 2142822 A (SHAW) see page 2 lines 2 to 5                                                                                                                    | 6,7                 |
| X:Y      | WO 91/06288 A1 (DAM) see page 6 line 22 to page 7 line 28, page 16 lines 1 to 17, page 17 line 21 to page 18 line 19, page 19 lines 20 to 22 and the Examples. | X:1-5,8-20<br>Y:6,7 |

|   |                                                                                                           |   |                                                                                                                  |
|---|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| X | Document indicating lack of novelty or inventive step                                                     | A | Document indicating technological background and/or state of the art.                                            |
| Y | Document indicating lack of inventive step if combined with one or more other documents of same category. | P | Document published on or after the declared priority date but before the filing date of this invention.          |
| & | Member of the same patent family                                                                          | E | Patent document published on or after, but with priority date earlier than, the filing date of this application. |

20

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 N.º de publicación: ES 2 048 510

51 Int. Cl.<sup>5</sup>: A61K 9/20

12

TRADUCCION DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: 90916715.7

86 Fecha de presentación : 06.11.90

87 Número de publicación de la solicitud: 0 500 658

87 Fecha de publicación de la solicitud: 02.09.92

54 Título: Unidad estimuladora que contiene nicotina.

30 Prioridad: 07.11.89 DK 5560/89  
04.12.89 DK 6156/89

73 Titular/es: Anders Dam  
Sollerod Park 16-st. 3  
DK-2840 Holte, DK

45 Fecha de la publicación de la mención BOPI:  
16.03.94

72 Inventor/es: Dam, Anders

45 Fecha de la publicación del folleto de patente:  
16.03.94

74 Agente: Durán Moya, Carlos

**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 (artº 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

Venta de fascículos: Oficina Española de Patentes y Marcas. C/Panamá, 1 - 28036 Madrid

2 048 510

## DESCRIPCION

La presente invención se refiere a una unidad estimuladora que contiene nicotina soluble en la saliva.

5 Se conoce de manera general el hecho de que fumar de manera pasiva o activa productos de tabaco tales como tabaco para pipa, cigarros puros y cigarrillos presenta serios peligros para la salud pública y también para el medio ambiente.

10 Se reconoce igualmente el hecho de que el renunciar al hábito de fumar presenta serios problemas para las personas acostumbradas a fumar tabaco.

Estos problemas son debidos principalmente a la adicción a la nicotina. En la actualidad se ha determinado que los fumadores adictos experimentan una urgente necesidad de estimulación de tabaco cuando la concentración de nicotina en el plasma sanguíneo del individuo desciende a aproximadamente 15 ng/ml.

15 Se conoce además que se pueden utilizar diferentes estimulantes que contienen nicotina, sin necesidad de fumar, para aliviar este impulso y ayudar así a los fumadores en la renuncia a sus hábitos de fumar sin inconvenientes sensibles. Anterioridades.

20 Se han conocido desde hace mucho tiempo estimulantes de nicotina independientes del acto de fumar, en forma de productos de tabaco sin fumar, tales como tabaco de mascar y polvo de tabaco y se han sugerido diferentes mejoras.

25 La memoria de Patente USA n° 1.376.586 da a conocer un producto que comprende tabaco finamente cortado o tabaco de mascar adoptando la forma individual de tabletas o "chicles" y que tienen superficies completamente recubiertas por goma de chicle, que es impermeable tanto al aire como a la humedad y que es eficaz para impedir la evaporación de los jugos del tabaco.

30 La memoria de Patente USA n° 4.545.392 da a conocer un producto de tabaco no destinado a fumar, que comprende tabaco cortado o triturado de otro modo y 1-35 % en peso de un compuesto base de goma masticable insoluble en agua, no sacárido, calculada en base al peso del tabaco seco, incluyendo opcionalmente gomas solubles en agua tales como goma arábica para estabilizar el compuesto de goma, y formulada en forma de piezas de tabaco cortado o triturado de otro modo poseyendo dicho compuesto base de goma masticable adherido a la superficie en forma de recubrimiento discontinuo. De acuerdo con 35 dicha Patente, las partículas individuales de tabaco deben tender a permanecer dispersas en la boca.

40 La solicitud de Patente PCT n° 81/02090 da a conocer un producto de tabaco de mascar en forma de porciones individuales en las cuales el tabaco de mascar queda recubierto con un material portador sólido o semisólido o distribuido en forma de pequeñas partículas en aquél. Como material portador, es preferible la goma de mascar. No obstante, se ha mencionado adicionalmente que los hidrolizados de almidón, es decir, productos no adhesivos utilizados en la fabricación de "bolas de goma" ("gum drops"), pueden ser utilizados como material portador, si bien esta utilización no se ha mostrado a título de ejemplo. Además, el material portador puede contener aditivos tales como aromas, edulcorantes y extractos secos solubles en agua de productos naturales tales como extractos de café o té. 45

Son conocidas las pulverizaciones o aerosoles que contienen nicotina para utilización oral, por ejemplo, de las Patentes DE-OS 32 41 437 y GB-PS 15 28 391.

50 La administración de nicotina mediante un pulverizador o un aerosol proporciona, no obstante, un efecto sólo durante un corto período de tiempo.

55 Se conoce por la Patente DE-OS 34 01 763 un preparado que contiene nicotina para utilización nasal. No obstante, la utilización nasal es poco agradable puesto que la mucosa nasal es más sensible que la mucosa bucal. Además esta administración proporciona asimismo sólo un efecto a corto plazo. Por lo tanto la administración nasal debe ser considerada también como poco apropiada.

60 La Patente DE-OS 34 38 284 da a conocer una pasta depositable que emite o libera nicotina mediante la cual, no obstante, se obtiene solamente una absorción de nicotina muy lenta y más bien incontrolada. Además no se puede conseguir por la utilización de una pasta en forma de depósito el incremento repentino deseable de la concentración de nicotina en el plasma sanguíneo de los usuarios y la experiencia fisiológica que le acompaña y que corresponde a la de las primeras bocanadas en la acción de fumar un cigarrillo.

En la Patente USA PA 3 901 248 se da a conocer un compuesto substitutivo de la goma de mascar tabaco en forma de una goma de mascar que contiene nicotina. Este compuesto comprende aproximadamente de 15 a 80 % de base goma y una resina de intercambio catiónico de nicotina en forma compleja dispersa en la base. El complejo de resina de intercambio catiónico constituye hasta aproximadamente 10 % del compuesto de goma de mascar y aporta una liberación de nicotina, cuando se efectúa la acción de mascar, que es aproximadamente la que se consigue en la acción de fumar un cigarrillo convencional.

En la Patente USA PS 3 845 217 se dan a conocer otros compuestos mejorados substitutivos del tabaco de mascar que son relativamente no irritantes para la garganta. Estos compuestos mejorados comprenden aproximadamente de 15 a 80 % en peso de goma base, nicotina y por lo menos un agente tampón soluble en agua aceptable fisiológicamente de tipo sólido, capaz de mantener el pH de la saliva, en la acción de mascar, por encima del valor fisiológico normal de la saliva, es decir, aproximadamente 7,4.

La nicotina se puede encontrar presente en una forma seleccionada del grupo que consiste en base libre de nicotina, una sal fisiológicamente aceptable de la misma soluble en agua, nicotina absorbida sobre un adsorbente fisiológicamente aceptable, y nicotina en forma de un complejo con un cambiador catiónico insoluble.

La cantidad de nicotina presente calculada como base libre queda comprendida entre 1 y 10, preferentemente desde 1 a 3 mg aproximadamente por cada unidad de goma de mascar.

Para obtener una liberación controlada, que no sea demasiado rápida de la nicotina es preferible incorporar nicotina como complejo con un cambiador catiónico insoluble.

Otros compuestos substitutivos del tabaco de mascar del tipo de goma de mascar se dan a conocer en la solicitud de Patente francesa publicada n° 2 608 156. Estos compuestos contienen nicotina incorporada en partículas que quedan dotadas de una capa superficial de un material soluble en agua que se supone que debería conducir a una liberación controlada, no demasiado rápida, de la nicotina.

En general, los productos de tabaco sin fumar que se basan en tabaco cortado y materiales portadores, por ejemplo, tabaco de mascar, tabaco triturado distribuido en bases de goma soluble en agua (gomas de mascar) o hidrolizados de almidón (bolas de goma), según las técnicas anteriormente conocidas, proporcionan residuos de tabaco y/o portadores que son insolubles o que dificultan la disolución en la saliva.

Además de que la eliminación de estos residuos puede ser poco agradable y socialmente no aceptable, las cantidades de ingredientes del tabaco cortado a los niveles requeridos para obtener una estimulación de nicotina son elevados y provocan dolor de estómago.

Una liberación súbita no deseable de ingredientes, por ejemplo, nicotina y agentes de sabor puede tener lugar por la utilización de productos de tabaco sin fumar que tienen una textura frágil o cristalina cuando estos productos son sometidos a aplastado. En este caso grandes zonas nuevas del producto pueden quedar expuestas y el usuario puede recibir grandes concentraciones de los ingredientes y como consecuencia puede experimentar variaciones no deseables de los efectos fisiológicos esperados de la estimulación.

Una liberación incontrolada similar de la nicotina puede tener lugar con gomitas de mascar que contienen nicotina cuando se efectúa su amasado durante la masticación.

## 2. Características de la invención

Unidad estimulante soluble en la saliva

Es el objetivo principal de la presente invención dar a conocer un suplemento del tabaco o producto substitutivo del tabaco en forma de una unidad estimulante que contiene nicotina para utilización oral, que proporciona una liberación controlada de nicotina y una añadidura opcional de ingredientes, por ejemplo, esencias y aditivos aromatizantes.

De manera específica, es objetivo de la presente invención dar a conocer una unidad estimulante soluble en la saliva y que contiene nicotina, que proporciona estimulación por nicotina, que presenta mejoras en relación o por lo menos similar a la estimulación obtenida mediante productos conocidos de tabaco

de fumar tal como cigarrillos, cigarros puros, tabaco para pipa y productos substitutivos del tabaco que se han mencionado anteriormente, evitando simultáneamente la producción de residuos de tabaco y/o del portador; las variaciones no deseables de los efectos fisiológicos; y la poco agradable eliminación del tabaco productos y substitutos del tabaco de tipo conocido.

5 También es un objetivo de la presente invención dar a conocer una unidad estimulante soluble en la saliva que permite la utilización oral bajo diferentes condiciones incluyendo la admisión simultánea de bebidas, tales como café, vino o cerveza; y que está formulada para proporcionar una dosis de nicotina que corresponde a la estimulación de nicotina obtenida por el acto de fumar un cigarro puro, una carga  
10 de una pipa de tabaco, o preferencialmente un cigarrillo.

De acuerdo con la presente invención se puede obtener la liberación controlada de nicotina y una liberación de ingredientes opcionales tales como aditivos de sabor y aroma de estimulación de nicotina sin fumar, mediante una unidad estimuladora soluble en la saliva que comprende un gel preparado por  
15 gelificación de un agente gelificante aglomerante en agua; nicotina u otros alcaloides con la misma dirección de actividad; y opcionalmente ingredientes tales como aditivos de sabor y aroma; y poseyendo unas características de textura bien definida, tal como se ha indicado más adelante, comprendiendo una serie de propiedades mecánicas, por ejemplo, consistencia, dureza, fragilidad, adherencia, elasticidad y carácter cohesivo; y poseyendo una concentración previamente seleccionada de nicotina o de dichos alcaloides.  
20 loides.

De acuerdo con lo anterior, según un aspecto más amplio de la misma, la presente invención da a conocer una unidad estimulante soluble en la saliva que comprende un ingrediente activo y opcionalmente ingredientes comprendiendo aditivos de sabor y aroma incorporados en un gel preparado por gelificación  
25 de un agente gelificante aglomerante en agua, en el cual el ingrediente activo comprende nicotina u otros alcaloides con la misma dirección de actividad, poseyendo dicha unidad

- i) unas características de textura determinadas por análisis de las características de la textura con valores de parámetros dentro de las siguientes gamas:
  - 30 a) consistencia, es decir, módulo, mayor de 100 N/cm<sup>2</sup>;
  - b) dureza, es decir, fuerza máxima que tiene lugar durante un primer ciclo de compresión, mayor de 5 N/cm<sup>2</sup>;
  - 35 c) fragilidad, es decir, porcentaje de tensión requerida para romper el gel, con un mínimo de 30 %.
  - d) adherencia, es decir, proporción entre el área del pico negativo entre dos ciclos de compresión y el área del primer pico, de 0 % a 70 %;
  - 40 e) elasticidad, es decir, la proporción  $100 \times (D-d)/D$ , en la que D es la altura (cm) de la muestra antes del primer ciclo de compresión, y d es la deformación permanente de la muestra (cm) antes del segundo ciclo de compresión, dentro de la gama de 25 % a 100 %; y
  - f) cohesividad, es decir, proporción del trabajo total entre el primer y el segundo ciclo de compresión, dentro de la gama de 25 % a 100 %;
- 45 ii) tiempo de desintegración, medido a 37°C utilizando un aparato de prueba de desintegración según Ph.Eur. segunda edición, dentro de la gama de 5-60 minutos; y
- iii) un contenido de nicotina de 0,5 a 10 mg o un contenido correspondiente de dichos alcaloides.

El tiempo de desintegración se mide a 37°C utilizando un aparato para pruebas de desintegración  
50 de acuerdo con la Farmacopea Europea (Patente Europea), segunda edición V. 5.1.1., bajo las condiciones que se describen a continuación. Se debe observar que el tiempo de desintegración observado fisiológicamente por utilización oral tiene un valor que es aproximadamente una tercera parte del tiempo de desintegración que se ha definido anteriormente.

55 Los términos "características de textura" y "análisis de las características de textura" se definen y se describen en la obra G. Sanderson y otros, "Gums and Stabilisers for the Food Industry 4", Sesiones de la 4ª Conferencia Internacional, Wrexham, Clwyd, Wales, Julio 1987, IRL Press, Ltd. (1988), y Szczesniak, y otros, J. Food Science 28 (1963) 385-403.

60 Por la variante del análisis de características de textura utilizado en el presente contexto, se obtiene una curva fuerza deformación al comprimir sucesivamente una muestra dos veces a 70 % de su altura original utilizando una tasa de compresión seleccionada. De la curva fuerza-deformación se derivan valores

Las unidades estimulantes que contienen nicotina según la presente invención se pueden utilizar para obtener una estimulación por nicotina similar a la obtenida por el fumar o no fumar productos de tabaco por toma oral de una unidad estimulante adecuadamente escogida, colocando la unidad contra la localización deseada en la cavidad bucal por medio de la lengua, y suavemente succionando o chupando la unidad a un ritmo escogido para una percepción sensorial individual y efecto estimulatorio de la nicotina.

### 3. Descripción detallada

#### (a) Análisis de características de textura

Dentro del presente contexto, el término "textura del material" se utiliza para designar una consistencia característica del material. La textura del material se puede describir de manera objetiva como una serie de valores para seis parámetros físicos, las "características de textura" medidas por el análisis de características de textura descrito por Sanderson y otros, tal como se ha mencionado anteriormente.

A continuación se explicará el cálculo de los valores de estos parámetros, es decir las características de textura, haciendo referencia al dibujo que muestra una curva de fuerza-deformación (a 20°C), de una muestra de pruebas de tipo cilíndrico de una unidad estimulante que tiene un diámetro de 15,4 mm y una altura de 12,3 mm, comprendiendo dos ciclos de compresión sucesivos al 70 % de la altura original de la muestra utilizando una tasa de compresión de 50 mm/minuto.

El perfil o características de textura comprende un primer ciclo de compresión (10) y un segundo ciclo de compresión (20). Del primer ciclo de compresión (10), se mide una *firmeza* de 169 N/cm<sup>2</sup> como la pendiente inicial (11) de la curva en el origen (12) del inicio de los tiempos de deformación con la altura de la muestra antes de compresión y dividiendo por el área de la superficie extrema de la muestra.

Además, se midió una *dureza* de 58 N/cm<sup>2</sup> como fuerza máxima (13) (altura del primer pico) que tiene lugar en cualquier momento durante el primer ciclo de compresión (10), es decir, al nivel de esfuerzo (14), dividido por el área superficial extrema de la muestra.

Una *fragilidad* de más del 30 % es medida en el punto de la primera fractura (que no se alcanzó en esta prueba), es decir que la fragilidad es mayor del 30 % para la presente muestra puesto que la muestra fue comprimida al 30 % del nivel de tensión (14) sin fractura (un número grande indica una textura no frágil).

Una *adhesividad* de aproximadamente 4 % se mide como proporción del área (17) del pico negativo después del primer ciclo de compresión (10) con respecto al área pico del primer ciclo de compresión. Si el material es adhesivo se adherirá a las placas de compresión y tirará de las placas en dirección opuesta de su movimiento entre los dos ciclos de compresión.

Una *elasticidad* del 85 % se mide por la proporción entre la altura D (12,3 mm) de la muestra antes del primer ciclo de compresión (10) menos la deformación d (1,8 mm), es decir, la distancia 22-18, con respecto a la altura D de la muestra antes del primer ciclo de compresión. El origen (18) del segundo ciclo de compresión se encuentra como doble de la distancia de deformación 14-12 al 30 %.

Se mide una *cohesividad* del 57 % como la proporción entre las áreas pico de los ciclos de compresión segundo y primero. Según una primera aproximación esta proporción de pico se puede estimar por la proporción entre las alturas de los picos, es decir 23 y 13, multiplicado por la proporción entre las líneas base de los picos, es decir, las distancias 26-22 y 16-12. De manera alternativa, las áreas pico se pueden calcular numéricamente por ordenador, o gráficamente por un planímetro, o por peso de duplicados de las áreas pico.

#### (b) Ingrediente activo.

De acuerdo con la invención el ingrediente activo se puede seleccionar del grupo que consiste en:

nicotina (3-(1-metil-2-pirolidinil)-piridina) incluyéndose nicotina sintética y extractos de nicotina procedentes de plantas de tabaco, tales como el género *Nicotiana*; y otros alcaloides con la misma dirección de actividad incluyendo nornicotina y lobelina, por ejemplo de las especies *Lobeliaceae* y *Lobelia*; metilanabasina y anabasina; solas o en combinación; y en la forma de base libre de sales por añadidura de ácidos farmacológicamente aceptables.

Además, el ingrediente activo puede incluir varios productos de oxidación tales como nicotina-1'-N-óxido.

5 (c) Agente gelificante aglomerante en agua

Un importante factor para obtener la textura deseada de la unidad estimulante de acuerdo con la presente invención consiste en la elección de un agente gelificante aglomerante en agua adecuado.

10 De acuerdo con la presente invención el agente gelificante aglomerante en agua se puede seleccionar del grupo que consiste en:

agentes de gelificación orgánicos incluyendo gelatina, almidón modificado y sin modificar; y  
gomas incluyendo agar, alginato, goma arábica, goma caroba, carrageno, goma ghatti, goma guar, goma  
15 karaya, pectina, goma tragacanto, goma de algarrobilla, y goma xantano.

Los agentes gelificantes preferentes comprenden goma arábica, almidón, gelatina, agar y pectina. Particularmente para gomas duras es preferible sólo goma arábica constituyendo aproximadamente 50-70 % del total de materias sólidas. No obstante, para compuestos estimulantes más blandos se pueden utilizar  
20 simultáneamente otro agente gelificante por ejemplo, gelatina, más que un agente de gelificación aglomerante en agua.

(d) Ingredientes opcionales

25 Entre los ingredientes opcionales se comprenden aditivos para edulcorar, dar sabor, aroma, color y estabilidad, y también vitaminas y minerales, así como sustancias tampón o agentes para conseguir un pH de la saliva que promueve la transferencia de nicotina al plasma sanguíneo.

"Edulcorantes"

30 Los edulcorantes pueden comprender uno o varios azúcares sintéticos o naturales, es decir cualquier forma de carbohidratos adecuada para su utilización como edulcorante en la fabricación de productos de pastelería.

35 De acuerdo con la invención los edulcorantes se pueden seleccionar entre el grupo que consiste en: azúcares únicos incluyendo azúcares extraídos a partir de caña de azúcar y remolacha azucarera (sacarosa), dextrosa (llamada también glucosa), fructosa (llamada también levulosa), y lactosa (llamada también leche del azúcar); sorbitol, manitol, glicerol, xilitol, sacarina sódica; y  
mezclas de azúcares incluyendo jarabe de glucosa, por ejemplo hidrolizados de almidón, conteniendo una  
40 mezcla de dextrosa, maltosa y una serie de azúcares complejos, jarabe de inversión de azúcar, por ejemplo sacarosa invertida por invertasa (también llamada sucrasa o sacarasa) conteniendo una mezcla de dextrosa y fructosa, jarabes con alto contenido de azúcares, tales como melazas y miel conteniendo una determinada mezcla de levulosa, dextrosa, maltosa, sacarosa, resinas, dextrina y azúcares superiores, y extractos de malta.

45 "Aditivos de sabor y aroma"

Los aditivos de sabor y aroma pueden comprender uno o varios agentes sintéticos o naturales de sabor y de aroma.

50 De acuerdo con la invención los agentes de sabor y aroma se pueden seleccionar entre aceites esenciales incluyendo destilados, extracciones mediante disolventes, o expresiones en frío de flores cortadas, hojas, piezas de fruta completas peladas o en pulpa comprendiendo mezclas de alcoholes, ésteres, aldehidos y lactones;

55 esencias comprendiendo cualesquiera soluciones diluidas de aceites esenciales, o mezclas de productos químicos sintéticos mezclados para adecuarse al sabor natural de la fruta, por ejemplo fresa, frambuesa, casis; sabores artificiales y naturales de preparaciones y licores, por ejemplo coñac, whisky, ron, ginebra, jerez, oportos y vinos; tabaco, café, té, cacao y menta. zumos de frutas incluyendo zumos expulsados por frutas lavadas, sometidas a limpieza tales como limones, naranjas y limas; licoriza, mentol, eucalipto,  
60 semillas de anís, bayas (por ejemplo, cacahuets, cocos, avellanas, castañas, nueces de nogal, nueces "cola"), almendras, pasas; y

tales como jarabes de dextrosa) se deben seleccionar de acuerdo con la elección de las materias primas, lo cual llevará a productos finales de textura adecuada y que mostrarán características situadas dentro del límite de los parámetros que se han indicado anteriormente.

- 5 El método de fabricación normalmente utilizado consiste en moldear el compuesto líquido en cavidades adecuadas producidas en un material de almidón, típicamente formando una impresión en el material limpio de almidón, acondicionado de humedad, del tamaño y forma adecuados, inmediatamente antes del moldeo. También se pueden utilizar otros métodos de moldeo en caso deseado tales como la utilización de moldes realizados a partir de materiales flexibles tales como elastómeros. En casos especiales también se  
10 pueden producir unidades estimulantes de acuerdo con la presente invención por otros métodos conocidos tales como extrusión y corte posterior, o por punzonado de tabletas a partir de una mezcla adecuada de ingredientes en forma de polvos o granulados.

- Después de la solidificación durante un período adecuado de tiempo a temperatura y humedad relativa controladas en el aire ambiente las unidades estimulante son retiradas del material de almidón por  
15 cualquier método conocido, procediendo a la limpieza de cualquier exceso de material de almidón de las unidades estimulantes por ejemplo por cepillado y/o soplado con la corriente de aire, recomendándose someter al producto a un llamado glaseado o tratamiento de pulido con un material aceitoso que se puede aplicar directamente o en forma de una solución en un disolvente volátil, y que deja una delgada  
20 capa dándole al artículo terminado un atractivo brillo superficial, falta de adhesividad y resistencia a las variaciones del contenido de agua en forma de secado o absorbiendo agua de la atmósfera circundante.

- Si bien en los ejemplos el método de fabricación se basa en la fabricación por lotes o un moldeo más o menos manualmente controlado en bandejas que contienen el material de almidón, se puede utilizar  
25 cualquier método parcial o completamente automatizado de producción tal como la maquinaria llamada "Mogul", si bien la conversión a dichas técnicas de producción de alta velocidad requerirá normalmente ciertos ajustes a realizar en la composición del material listo para moldeo.

En los ejemplos se utilizaron los siguientes materiales:

### 30 MATERIAS PRIMAS

- Jarabes de dextrosa, Glycosum Liquidum, (Lote n° 302 589) Mecobenzon, Dinamarca;  
35 Azúcar (preferentemente azúcar fundido o "caster"), Dansukker Melis, DDS, Dinamarca;  
Goma arábiga (limpia) Gummi Arabicum (polvo químicamente puro) LK (E414), (lote n° 233 200), Nordisk Droge Handels A/S, Dinamarca;  
40 Gelatina (215 preferentemente floro "bloom"), polvo de gelatina 215 B (lote n° 232 883), Nordisk Droge Handels AIS, Dinamarca;  
Agua del grifo  
Polvo de tabaco, tabaco granulado o tabaco de pipa "mitad y mitad", American Branch;  
Acido cítrico;  
45 Esencia de menta;  
Anís;  
Esencia de almendras; y  
50 Cacao.

### *Materiales para secar*

- Almidón de maíz, Maydis Amylum (lote n° 257 329), Mecobenzon, Dinamarca;  
55 Almidón de trigo, Tritici Amylum (lote n° 257 535), Mecobenzon, Dinamarca;

El material de almidón debe ser secado a 150-200°C durante un mínimo de 2 horas antes de su utilización con un contenido de humedad no superior al 10 %.

60

## REIVINDICACIONES

1. Unidad estimulante soluble en saliva que comprende un ingrediente activo, e ingredientes opcionales que comprenden aditivos de sabor y aroma incorporados en un gel preparado por gelificación de un agente  
 5 gelificante aglomerante en agua, en el cual el ingrediente activo comprende nicotina u otros alcaloides con la misma dirección de actividad, poseyendo dicha unidad:

- i) unas características de textura determinadas por análisis de características de textura, con valores de parámetros dentro de las siguientes gamas:
- 10 a) firmeza, es decir módulo, mayor de  $100 \text{ N/cm}^2$ ;
- b) dureza, es decir máxima fuerza que tiene lugar durante un primer ciclo de compresión, mayor de  $5 \text{ N/cm}^2$ ;
- 15 c) fragilidad, es decir porcentaje de esfuerzo requerido para la rotura del gel, por lo menos 30 %;
- d) adhesividad, es decir la proporción entre el área del pico negativo entre dos ciclos de compresión y el área del primer pico, de 0 % a 70 %;
- 20 e) elasticidad, es decir la proporción  $100x(D-d)/D$ , en la que D es la altura de la muestra (cm) antes del primer ciclo de compresión, y d es la deformación permanente de la muestra (cm) antes del segundo ciclo de compresión, dentro de la gama de 25 % a 100 %; y
- f) cohesividad, es decir proporción total de trabajo entre el primer y segundo ciclos de compresión, dentro de una gama de 25 % a 100 %;
- 25 ii) tiempo de desintegración medido a  $37^\circ\text{C}$  utilizando un aparato de pruebas de desintegración según Ph.Eur. segunda edición, dentro de la gama de 5-60 minutos; y
- 30 iii) un contenido de nicotina de 0,5 a 10 mg o un contenido correspondiente de dichos alcaloides.

2. Unidad estimulante, según la reivindicación 1, **caracterizada** porque las características de textura tienen valores de parámetros dentro de las siguientes gamas:

- 35 a) firmeza mayor de  $200 \text{ N/cm}^2$ ;
- b) dureza mayor de  $25 \text{ N/cm}^2$ ;
- c) fragilidad mínima de 30 %;
- 40 d) adhesividad de 0 % a 40 %;
- e) elasticidad dentro de la gama de 50 % a 100 %; y
- 45 f) cohesividad dentro de la gama de 40 % a 100 %; y

que el tiempo de desintegración se encuentra dentro de la gama de 6-45 minutos.

3. Unidad estimulante, según las reivindicaciones 1-2, **caracterizada** porque las características de  
 50 textura tienen valores de parámetros dentro de las siguientes gamas:

- a) firmeza mayor de  $400 \text{ N/cm}^2$ ;
- 55 b) dureza entre 80 y  $300 \text{ N/cm}^2$ ;
- c) fragilidad mínima 30 %;
- d) adhesividad de 0 % a 20 %;
- 60 e) elasticidad dentro de la gama de 80 % a 100 %; y
- f) cohesividad dentro de la gama de 40 % a 100 %; y

que el tiempo de desintegración se encuentra dentro de la gama de entre 15-40 minutos.

4. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-3, **caracterizada** porque el agente gelificante comprende gelatina o uno o más polisacáridos sintéticos o naturales, preferentemente polisacáridos utilizados en la producción de productos de pastelería.

5. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-3, **caracterizada** porque el agente gelificante es seleccionado del grupo que consiste en agar, algina, carrageno, goma guar, goma arábica, goma ghatti, goma de tragacanto, goma karaya, goma de garrofina, pectina, goma xantano, particularmente goma arábica y carrageno, preferentemente goma arábica.

6. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-5, **caracterizada** porque los aditivos de sabor y aroma comprenden uno o más agentes naturales o sintéticos de sabor seleccionados entre aceites esenciales, esencias, jugos de frutas y materiales en polvo, harinas o materiales vegetales triturados incluyendo tabaco, café, té y menta.

7. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-6, **caracterizada** porque los aditivos comprenden una o varias vitaminas o minerales.

8. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-7, **caracterizada** porque los aditivos comprenden una sustancia o agente tampón fisiológicamente aceptable.

9. Unidad estimulante, según la reivindicación 8, **caracterizada** porque la sustancia o agente tampón y la cantidad de la misma se seleccionan para asegurar un pH de la saliva 8-10 durante la desintegración de la unidad.

10. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 8-9, **caracterizada** porque la cantidad de sustancia o agente tampón en una unidad varía entre 5 mg y 50 mg.

11. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 8-10, **caracterizada** porque la sustancia o agente tampón comprende carbonatos de metales alcalinos, bicarbonatos, fosfatos, y/o bifosfatos.

12. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-11, **caracterizada** por contener una cantidad de nicotina seleccionada en la gama de 0,5 a 5,0 mg de nicotina, preferentemente una gama de 1,0 a 1,5 mg, de 1,5 a 2,5 mg, o bien de 2,5 a 3,0 mg de nicotina para proporcionar la estimulación de nicotina deseada.

13. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-12, **caracterizada** porque se consigue una liberación substancialmente constante de nicotina por una distribución homogénea de la nicotina en la unidad.

14. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-12, **caracterizada** porque se consigue una liberación graduada comprendiendo un cebado y una liberación sostenida por una distribución según una estructura no homogénea de estructura de la nicotina en una unidad de capas múltiples.

15. Unidad estimulante, según cualquiera de las reivindicaciones 1-14, **caracterizada** por su conformación con una estructura adecuada para su adherencia al paladar.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
NIT : 800.176.089-2  
- / -

|                                                                                                                                      |                       |                                              |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|----------------------------------------------|
| <br><b>Industria y Comercio</b><br>SUPERINTENDENCIA | <b>RECIBO DE CAJA</b> | <b>No. 12 - 122910</b>                       |
|                                                                                                                                      |                       | Bogotá D.C., Noviembre 27 de 2012 - 17:26:26 |

RECIBIDO DE : REYES Y REYES ABOGADOS NI 900.048.328

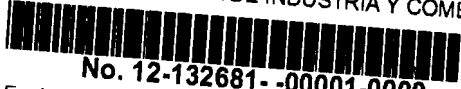
|                          |                 |           |           |            |            |
|--------------------------|-----------------|-----------|-----------|------------|------------|
| *** Soporte del Pago *** |                 |           |           |            |            |
| TIPO PAGO                | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO  | FECHA PAGO | VR. PAGO   |
| CONSIGNACION             | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 192426371 | 27/11/2012 | 830.000.00 |

|                           |                                             |                                                         |                     |
|---------------------------|---------------------------------------------|---------------------------------------------------------|---------------------|
| *** Conceptos Pagados *** |                                             |                                                         |                     |
| CANT.                     | RENTISTICO                                  | CONCEPTO                                                | Vr. CONCEPTO        |
| 1 50005-01-04             | PRESENTACION DE OBSERVACIONES A SOLICITUDES | 1632 OPOSICION NUEVA CRACION / PRESENTACION             | 315.000.00          |
| 1 50005-01-08             | PRORROGA DE TERMINOS                        | 1608 N. CREACION PRORROGA DE TERMINOS O PLAZO ADICIONAL | 100.000.00          |
|                           |                                             |                                                         | <u>\$415.000.00</u> |

SON: \*\*CUATROCIENTOSQUINCE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE\*\*\*

Responsable:   
\_\*\*\*\*\_

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. \_\_\_\_\_

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
  
**No. 12-132681- -00001-0000**  
Fecha: 2012-11-28 16:29:38 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 400 OPOSIOBSERVTER Folios: 25