

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
25. Oktober 2007 (25.10.2007)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2007/118653 A3

(51) Internationale Patentklassifikation:

A61K 9/51 (2006.01) A61K 47/24 (2006.01)
A61K 9/107 (2006.01) A61K 47/44 (2006.01)
A61K 47/28 (2006.01)

(74) **Anwalt:** KEIL & SCHAAFHAUSEN; Cronstetten-
strasse 66, 60322 Frankfurt am Main (DE).

(81) **Bestimmungsstaaten** (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2007/003217

(22) Internationales Anmeldedatum:
11. April 2007 (11.04.2007)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2006 016 978.6 11. April 2006 (11.04.2006) DE

(84) **Bestimmungsstaaten** (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart*): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) **Anmelder** (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US*): KOKO KOSMETIKVERTRIEB GMBH & CO. KG [DE/DE]; Moltkestrasse 25, 42799 Leichlingen (DE).

(72) **Erfinder; und**

(75) **Erfinder/Anmelder** (*nur für US*): LAUTEN-SCHLÄGER, Hans [DE/DE]; Neusser Gasse 50, 50259 Pulheim (DE). ELIAS, Ian [DE/DE]; Dillenburgerstrasse 29 A, 60439 Frankfurt am Main (DE).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen
Recherchenberichts:** 12. Juni 2008

(54) **Title:** NANOPARTICLE CONTAINING NICOTINE AND/OR COTININE, DISPERSIONS AND USE THEREOF

(54) **Bezeichnung:** NANOPARTIKEL, ENTHALTEND NICOTIN UND/ODER COTININ, DISPERSIONEN UND DIE VERWENDUNG DERSELBEN

(57) **Abstract:** The invention relates to nanoparticles containing nicotine and/or cotinine. The invention further relates to dispersions containing said nanoparticles. Also disclosed are corresponding galenic forms, in particular, transdermal forms, containing nicotine and cotinine in nanoparticulate form and use thereof for cigarette weaning.

(57) **Zusammenfassung:** Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Nanopartikel, enthaltend Nicotin und/oder Cotinin. Darüber hinaus betrifft die vorliegende Erfindung Dispersionen, die diese Nanopartikel enthalten. Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind dementsprechend insbesondere neue transdermale Galeniken, umfassend Nicotin und Cotinin in nanopartikulärer Form und deren Verwendung zur Zigarettenentwöhnung.



WO 2007/118653 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2007/003217

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 INV. A61K9/51 A61K9/107 A61K47/28 A61K47/24 A61K47/44

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, EMBASE, FSTA, BIOSIS, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	HWANG B-Y ET AL: "In vitro skin permeation of nicotine from proliposomes" JOURNAL OF CONTROLLED RELEASE, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 49, no. 2-3, 15 December 1997 (1997-12-15), pages 177-184, XP004101944 ISSN: 0168-3659	1-18
Y	page 177, paragraph 1 - page 178 page 178, paragraph 2.2 page 178, paragraphs 2.3,2.4 - page 179 page 181, paragraph 3.2 ----- -/--	20

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *Z* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

29 Januar 2008

Date of mailing of the international search report

12/02/2008

Name and mailing address of the ISA
 European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Schüle, Stefanie

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2007/003217

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 2005/069518 A1 (MOUSA SHAKER [US] ET AL) 31 March 2005 (2005-03-31) page 5, paragraph 51 page 8, paragraph 96 page 8, paragraph 98 - page 9 claims 1,10	1-8, 13-15,18
X	WO 99/04764 A (PERIO PROD LTD [IL]; LERNER E ITZHAK [IL]; ROSENBERGER VERED [IL]; FLA) 4 February 1999 (1999-02-04) page 50 - page 51; example 8	1-18
X	WO 99/15171 A (PHARMACIA & UPJOHN AB [SE]; ANDERSSON SVEN BOERJE [SE]; JONN STEFAN [S]) 1 April 1999 (1999-04-01)	1-9, 11-19
Y	page 3, line 4 page 4, line 11 - line 17 page 9, line 11 - line 24 claims 1-36 page 14; example 4	20
Y	US 4 665 069 A (ROSENBERG BARNETT [US]) 12 May 1987 (1987-05-12) example 8 claims 1-10	20
T	RUBAS W ET AL: "Liposomes: advances in production-technology and therapy" PHARMAZIE IN UNSERER ZEIT NOV 1991, vol. 20, no. 6, November 1991 (1991-11), pages 255-270, XP002466120 ISSN: 0048-3664 page 257, paragraph 2.2	1-20
A	US 5 759 566 A (POLI STEFANO [IT] ET AL) 2 June 1998 (1998-06-02) column 6; example 6	1-20
A	US 5 889 029 A (ROLF DAVID [US]) 30 March 1999 (1999-03-30) claims 1-14	1-20

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Although claims 18-20 relate to a method for treatment of the human or animal body, the search was carried out and was based on the stated effects of the compound or composition.
2. Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2007/003217

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 2005069518	A1	31-03-2005	NONE
WO 9904764	A	04-02-1999	AU 8578498 A 16-02-1999 BR 9811478 A 15-08-2000 CA 2296654 A1 04-02-1999 EP 1003483 A1 31-05-2000 HU 0002490 A2 28-12-2000 JP 2001510788 T 07-08-2001 NO 20000284 A 22-03-2000
WO 9915171	A	01-04-1999	AT 253362 T 15-11-2003 AU 733619 B2 17-05-2001 AU 9287298 A 12-04-1999 BR 9815395 A 14-11-2000 CA 2304042 A1 01-04-1999 CN 1278174 A 27-12-2000 DE 69819548 D1 11-12-2003 DE 69819548 T2 12-08-2004 DK 1023069 T3 08-03-2004 EE 200000154 A 15-02-2001 EP 1023069 A1 02-08-2000 ES 2210817 T3 01-07-2004 FI 20000692 A 24-03-2000 HU 0004802 A2 28-05-2001 JP 2001517624 T 09-10-2001 MX PA00002955 A 24-04-2002 NO 20001540 A 25-05-2000 NZ 503408 A 24-12-2004 PT 1023069 T 27-02-2004 RU 2201747 C2 10-04-2003 ZA 9808794 A 01-04-1999
US 4665069	A	12-05-1987	NONE
US 5759566	A	02-06-1998	NONE
US 5889029	A	30-03-1999	US 5776956 A 07-07-1998

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2007/003217

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

INV. A61K9/51 A61K9/107 A61K47/28 A61K47/24 A61K47/44

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
A61K

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, EMBASE, FSTA, BIOSIS, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	HWANG B-Y ET AL: "In vitro skin permeation of nicotine from proliposomes" JOURNAL OF CONTROLLED RELEASE, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, Bd. 49, Nr. 2-3, 15. Dezember 1997 (1997-12-15), Seiten 177-184, XP004101944 ISSN: 0168-3659	1-18
Y	Seite 177, Absatz 1 - Seite 178 Seite 178, Absatz 2.2 Seite 178, Absätze 2.3,2.4 - Seite 179 Seite 181, Absatz 3.2 ----- -/--	20

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen Siehe Anhang Patentfamilie

- | | |
|---|--|
| <ul style="list-style-type: none"> * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist | <ul style="list-style-type: none"> *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist |
|---|--|

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 29. Januar 2008	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts 12/02/2008
---	--

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter Schüle, Stefanie
---	--

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 2005/069518 A1 (MOUSA SHAKER [US] ET AL) 31. März 2005 (2005-03-31) Seite 5, Absatz 51 Seite 8, Absatz 96 Seite 8, Absatz 98 - Seite 9 Ansprüche 1,10	1-8, 13-15,18
X	WO 99/04764 A (PERIO PROD LTD [IL]; LERNER E ITZHAK [IL]; ROSENBERGER VERED [IL]; FLA) 4. Februar 1999 (1999-02-04) Seite 50 - Seite 51; Beispiel 8	1-18
X	WO 99/15171 A (PHARMACIA & UPJOHN AB [SE]; ANDERSSON SVEN BOERJE [SE]; JONN STEFAN [S]) 1. April 1999 (1999-04-01) Seite 3, Zeile 4 Seite 4, Zeile 11 - Zeile 17 Seite 9, Zeile 11 - Zeile 24 Ansprüche 1-36 Seite 14; Beispiel 4	1-9, 11-19
Y		20
Y	US 4 665 069 A (ROSENBERG BARNETT [US]) 12. Mai 1987 (1987-05-12) Beispiel 8 Ansprüche 1-10	20
T	RUBAS W ET AL: "Liposomes: advances in production-technology and therapy" PHARMAZIE IN UNSERER ZEIT NOV 1991, Bd. 20, Nr. 6, November 1991 (1991-11), Seiten 255-270, XP002466120 ISSN: 0048-3664 Seite 257, Absatz 2.2	1-20
A	US 5 759 566 A (POLI STEFANO [IT] ET AL) 2. Juni 1998 (1998-06-02) Spalte 6; Beispiel 6	1-20
A	US 5 889 029 A (ROLF DAVID [US]) 30. März 1999 (1999-03-30) Ansprüche 1-14	1-20

Feld Nr. II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein internationaler Recherchenbericht erstellt:

1. Ansprüche Nr. weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche diese Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
Obwohl die Ansprüche 18-20 sich auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen/tierischen Körpers beziehen, wurde die Recherche durchgeführt und gründete sich auf die angeführten Wirkungen der Verbindung/Zusammensetzung.
2. Ansprüche Nr. weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, dass eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. Ansprüche Nr. weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefasst sind.

Feld Nr. III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Diese Internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1. Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung solcher Gebühren aufgefördert.
3. Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Dieser internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfasst:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- Der Anmelder hat die zusätzlichen Recherchegebühren unter Widerspruch entrichtet und die gegebenenfalls erforderliche Widerspruchsgebühr gezahlt.
- Die zusätzlichen Recherchegebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt, jedoch wurde die entsprechende Widerspruchsgebühr nicht innerhalb der in der Aufforderung angegebenen Frist entrichtet.
- Die Zahlung der zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2007/003217

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
US 2005069518	A1	31-03-2005	KEINE		
WO 9904764	A	04-02-1999	AU	8578498 A	16-02-1999
			BR	9811478 A	15-08-2000
			CA	2296654 A1	04-02-1999
			EP	1003483 A1	31-05-2000
			HU	0002490 A2	28-12-2000
			JP	2001510788 T	07-08-2001
			NO	20000284 A	22-03-2000
WO 9915171	A	01-04-1999	AT	253362 T	15-11-2003
			AU	733619 B2	17-05-2001
			AU	9287298 A	12-04-1999
			BR	9815395 A	14-11-2000
			CA	2304042 A1	01-04-1999
			CN	1278174 A	27-12-2000
			DE	69819548 D1	11-12-2003
			DE	69819548 T2	12-08-2004
			DK	1023069 T3	08-03-2004
			EE	200000154 A	15-02-2001
			EP	1023069 A1	02-08-2000
			ES	2210817 T3	01-07-2004
			FI	20000692 A	24-03-2000
			HU	0004802 A2	28-05-2001
			JP	2001517624 T	09-10-2001
			MX	PA00002955 A	24-04-2002
			NO	20001540 A	25-05-2000
			NZ	503408 A	24-12-2004
			PT	1023069 T	27-02-2004
			RU	2201747 C2	10-04-2003
			ZA	9808794 A	01-04-1999
US 4665069	A	12-05-1987	KEINE		
US 5759566	A	02-06-1998	KEINE		
US 5889029	A	30-03-1999	US	5776956 A	07-07-1998