



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2014126094, 29.11.2012

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
30.11.2011 JP 2011-261727

(43) Дата публикации заявки: 27.01.2016 Бюл. № 03

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 30.06.2014(86) Заявка РСТ:  
JP 2012/080887 (29.11.2012)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2013/081044 (06.06.2013)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

ТОЯМА КЕМИКАЛ КО., ЛТД. (JP)

(72) Автор(ы):

КАКУДА Сахое (JP),  
МИЯДЗАКИ Цутому (JP),  
ОКАДА Котаро (JP)

(54) ТАБЛЕТКА, СОДЕРЖАЩАЯ ГИДРАТ МЕТАНСУЛЬФОНАТА 1-ЦИКЛОПРОПИЛ-8-(ДИФТОРМЕТОКСИ)-7-[(1R)-1-МЕТИЛ-2,3-ДИГИДРО-1Н-ИЗОИНДОЛ-5-ИЛ]-4-ОКСО-1,4-ДИГИДРОХИНОЛИН-3-КАРБОНОВОЙ КИСЛОТЫ

## (57) Формула изобретения

1. Таблетка, содержащая гидрат метансульфоната 1-циклопропил-8-(дифторметокси)-7-[(1R)-1-метил-2,3-дигидро-1Н-изоиндол-5-ил]-4-оксо-1,4-дигидрохинолин-3-карбоновой кислоты в количестве от 80 до 97,5 мас.%.  
2. Таблетка по п. 1, в которой содержание составляет от 80 до 95 мас.%.  
3. Таблетка по п. 1, в которой гидрат метансульфоната 1-циклопропил-8-(дифторметокси)-7-[(1R)-1-метил-2,3-дигидро-1Н-изоиндол-5-ил]-4-оксо-1,4-дигидрохинолин-3-карбоновой кислоты имеет 85% времени растворения в течение 30 мин при частоте вращения мешалки 50 об/мин во 2-м способе испытания на растворимость согласно фармакопее Японии (способ с использованием лопастной мешалки) с применением 1-ой жидкости испытания на растворимость, согласно фармакопее Японии, в качестве контрольной среды.  
4. Таблетка по п. 2, в которой гидрат метансульфоната 1-циклопропил-8-(дифторметокси)-7-[(1R)-1-метил-2,3-дигидро-1Н-изоиндол-5-ил]-4-оксо-1,4-дигидрохинолин-3-карбоновой кислоты имеет 85% времени растворения в течение 30 мин при частоте вращения мешалки 50 об/мин во 2-м способе испытания на растворимость согласно фармакопее Японии (способ с использованием лопастной мешалки) с применением 1-ой жидкости испытания на растворимость, согласно

фармакопее Японии, в качестве контрольной среды.

5. Таблетка по п. 1, дополнительно содержащая дезинтегрирующий агент.

6. Таблетка по п. 2, дополнительно содержащая дезинтегрирующий агент.

7. Таблетка по п. 3, дополнительно содержащая дезинтегрирующий агент.

8. Таблетка по п. 4, дополнительно содержащая дезинтегрирующий агент.

9. Таблетка по п. 5, в которой дезинтегрирующий агент представляет собой один или более дезинтегрирующих агентов, выбранных из производных целлюлозы, производных крахмала и производных поливинилпирролидона.

10. Таблетка по п. 6, в которой дезинтегрирующий агент представляет собой один или более дезинтегрирующих агентов, выбранных из производных целлюлозы, производных крахмала и производных поливинилпирролидона.

11. Таблетка по п. 7, в которой дезинтегрирующий агент представляет собой один или более дезинтегрирующих агентов, выбранных из производных целлюлозы, производных крахмала и производных поливинилпирролидона.

12. Таблетка по п. 8, в которой дезинтегрирующий агент представляет собой один или более дезинтегрирующих агентов, выбранных из производных целлюлозы, производных крахмала и производных поливинилпирролидона.

13. Таблетка по п. 9, в которой производные целлюлозы представляют собой кроскармеллозу натрия, кармеллозу кальция, низкозамещенную гидроксипропилцеллюлозу и кармеллозу; производные крахмала представляют собой натрия крахмала гликолят и частично прежелатинизированный крахмал; и/или производные поливинилпирролидона представляют собой кросповидон.

14. Таблетка по п. 10, в которой производные целлюлозы представляют собой кроскармеллозу натрия, кармеллозу кальция, низкозамещенную гидроксипропилцеллюлозу и кармеллозу; производные крахмала представляют собой натрия крахмала гликолят и частично прежелатинизированный крахмал; и/или производные поливинилпирролидона представляют собой кросповидон.

15. Таблетка по п. 11, в которой производные целлюлозы представляют собой кроскармеллозу натрия, кармеллозу кальция, низкозамещенную гидроксипропилцеллюлозу и кармеллозу; производные крахмала представляют собой натрия крахмала гликолят и частично прежелатинизированный крахмал; и/или производные поливинилпирролидона представляют собой кросповидон.

16. Таблетка по п. 12, в которой производные целлюлозы представляют собой кроскармеллозу натрия, кармеллозу кальция, низкозамещенную гидроксипропилцеллюлозу и кармеллозу; производные крахмала представляют собой натрия крахмала гликолят и частично прежелатинизированный крахмал; и/или производные поливинилпирролидона представляют собой кросповидон.

17. Таблетка по любому одному из пп. 1-16, дополнительно содержащая глидант.

18. Таблетка по п. 17, в которой глидант представляет собой диоксид кремния.

RU 2014126094 A

RU 2014126094 A