(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2013 年 4 月 18 日(18.04.2013)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2013/054872 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/496 (2006.01) *A61K 47/10* (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01) *A61K 47/12* (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01) *A61K 47/26* (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01) *A61K 47/38* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2012/076415

(22) 国際出願日: 2012 年 10 月 12 日(12.10.2012)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2011-227057 2011 年 10 月 14 日(14.10.2011) JP

(71) 出願人: 大塚製薬株式会社(**OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.**) [JP/JP]; 〒1018535 東京都千代田区神田司町２丁目９番地 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 井上 美晴(**INOUE, Yoshiharu**); 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町１－７－１ 大塚製薬株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人三枝国際特許事務所(**SAEGUSA & PARTNERS**); 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町１－７－１ 北浜ＴＮＫビル Osaka (JP).

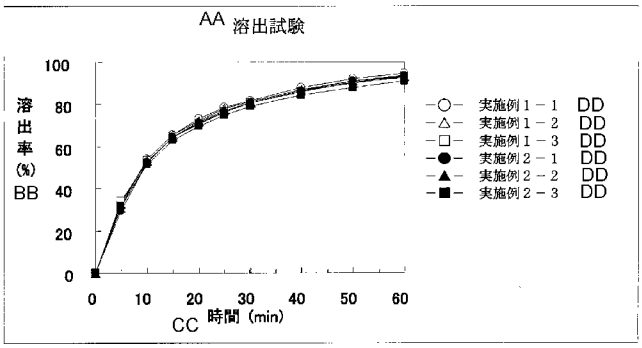
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[続葉有]

(54) **Title**: TABLET INCLUDING 7-[4-(4-BENZO[b]THIOPHEN-4-YL-PIPERAZIN-1-YL) BUTOXY]-1H-QUINOLIN-2-ONE OR SALT THEREOF

(54) 発明の名称 : ７－［４－（４－ベンゾ［ｂ］チオフェン－４－イル－ピペラジン－１－イル）ブトキシ］－１Ｈ－キノリン－２－オン又はその塩を含む錠剤



AA Elution testing
BB Elution rate (%)
CC Time (min)
DD Example

(57) **Abstract**: Provided is a tablet containing the active ingredient of 7-[4-(4-benzo[b]thiophen-4-yl-piperazin-1-yl) butoxy]-1H-quinolin-2-one or a salt thereof, the tablet having excellent disintegration, favorable storage stability, and high light stability; in particular, provided is a tablet obtained by coating, with a coating layer containing hypromellose, talc, titanium oxide, and a colorant or the like, a plain tablet which contains 7-[4-(4-benzo[b]thiophen-4-yl-piperazin-1-yl) butoxy]-1H-quinolin-2-one or a salt thereof as an active ingredient, and also contains: lactose, corn starch, crystalline cellulose, or another excipient; low-substituted hydroxypropyl cellulose, croscarmellose sodium, sodium carboxymethyl starch, or another disintegrating agent; hydroxypropyl cellulose or another binder; and stearic acid salt or another lubricant.

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2013/054872 A1

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）

７－［４－（４－ベンゾ［ｂ］チオフェン－４－イル－ピペラジン－１－イル）ブトキシ］－１Ｈ－キノリン－２－オン又はその塩有効成分として含有する、崩壊性に優れ、良好な保存安定性及び高い光安定性を有する錠剤、特に、７－［４－（４－ベンゾ［ｂ］チオフェン－４－イル－ピペラジン－１－イル）ブトキシ］－１Ｈ－キノリン－２－オン又はその塩を有効成分として含有し、乳糖、トウモロコシデンプン、結晶セルロース等の賦形剤、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、カルボキシメチルスターチナトリウム等の崩壊剤、ヒドロキシプロピルセルロース等の結合剤及びステアリン酸塩等の滑沢剤を含有する素錠に、ヒプロメロース、タルク、酸化チタン並びに着色剤等を含有するコーティング層をコーティングした錠剤、を提供する。