

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003 年 7 月 3 日 (03.07.2003)

PCT

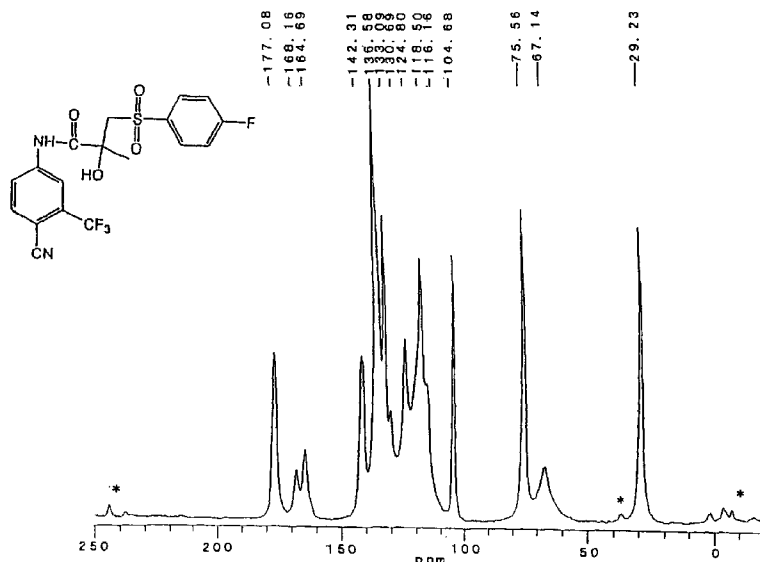
(10) 国際公開番号
WO 03/053920 A1

- (51) 国際特許分類⁷: C07C 315/02, 315/06, 317/46, A61K 31/277, A61P 5/28, 43/00 特願2002-166213 2002 年 6 月 6 日 (06.06.2002) JP
- (21) 国際出願番号: PCT/JP02/13058
- (22) 国際出願日: 2002 年 12 月 13 日 (13.12.2002)
- (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 2001-380686
2001 年 12 月 13 日 (13.12.2001) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住化ファインケム株式会社 (SUMIKA FINE CHEMICALS CO., LTD.) [JP/JP]; 〒555-0021 大阪府 大阪市 西淀川区歌島 3 丁目 1 番 2 1 号 Osaka (JP).
- (72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 新宅 哲也 (SHIN-TAKU, Tetsuya) [JP/JP]; 〒555-0021 大阪府 大阪市 西淀川区歌島 3 丁目 1 番 2 1 号 住化ファインケム株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 桂 正 (KATSURA, Tadashi) [JP/JP]; 〒555-0021 大阪府 大阪市 西淀川区歌島 3 丁目 1 番 2 1 号 住化ファインケム株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 板谷 信重 (ITAYA, Nobushige) [JP/JP];

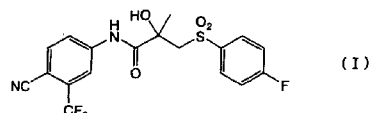
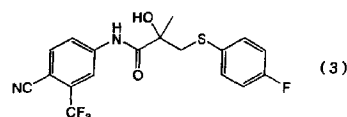
[続葉有]

(54) Title: CRYSTALS OF BICALUTAMIDE AND PROCESS FOR THEIR PRODUCTION

(54) 発明の名称: ビカルタミドの結晶およびその製造方法



(57) Abstract: The invention relates to crystals of bicalutamide having a specific crystal form, and industrially practicable processes for the production of bicalutamide and crystals thereof which are excellent in environmental friendliness, economical efficiency, and safeness. The invention provides a process for the production of bicalutamide represented by formula (1): (1) characterized by comprising at least the step of reacting a compound represented by formula (3) with an oxidizing agent; (3) a process for the production of crystals of bicalutamide; and a crystal form of bicalutamide as determined by X-ray diffraction (XRD) or solid-state ¹³C NMR spectroscopy.



[続葉有]



〒555-0021 大阪府 大阪市 西淀川区歌島3丁目1番
21号 住化ファインケム株式会社 総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒541-0044
大阪府 大阪市 中央区伏見町四丁目2番14号 藤村
大和生命ビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ,
OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ,
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI 特
許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR,
NE, SN, TD, TG).

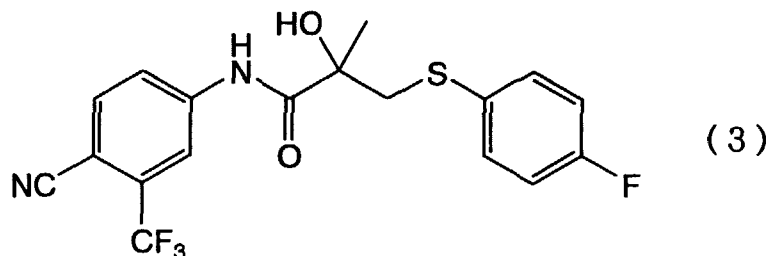
添付公開書類:
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

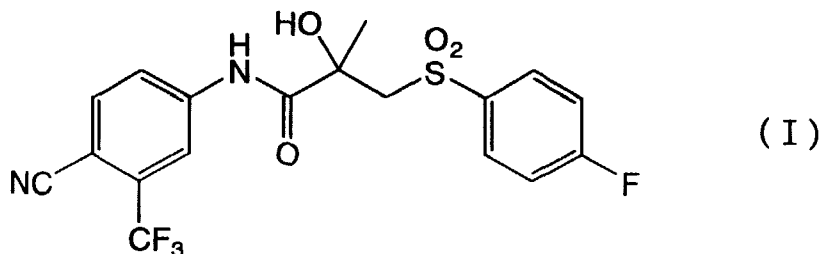
(57) 要約:

本発明は、形態を規定したピカルタミド結晶、ならびに環境調和性に優れ、経
済的であるとともに安全性に優れ、かつ工業的に実用可能なピカルタミドおよび
その結晶の製造方法に関する。

従って、本発明は、式(3):



で表される化合物と、酸化剤とを反応させる工程を少なくとも包含することを特
徴とする、式(I):



で表されるピカルタミドの製造方法ならびにピカルタミド結晶の製造方法、なら
びにX線回折(XRD)または¹³C核 固体NMR測定によって規定されたピカ
ルタミドの結晶形態を提供する。