

(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
2011 年 3 月 31 日(31.03.2011)

(10) 国際公開番号
WO 2011/036895 A1

(51) 国際特許分類:

<i>C07D 413/14</i> (2006.01)	<i>A61P 15/06</i> (2006.01)
<i>A61K 31/536</i> (2006.01)	<i>A61P 17/00</i> (2006.01)
<i>A61P 1/02</i> (2006.01)	<i>A61P 17/02</i> (2006.01)
<i>A61P 1/04</i> (2006.01)	<i>A61P 17/06</i> (2006.01)
<i>A61P 1/16</i> (2006.01)	<i>A61P 19/02</i> (2006.01)
<i>A61P 1/18</i> (2006.01)	<i>A61P 25/00</i> (2006.01)
<i>A61P 7/00</i> (2006.01)	<i>A61P 27/02</i> (2006.01)
<i>A61P 7/02</i> (2006.01)	<i>A61P 29/00</i> (2006.01)
<i>A61P 9/10</i> (2006.01)	<i>A61P 31/04</i> (2006.01)
<i>A61P 11/00</i> (2006.01)	<i>A61P 37/02</i> (2006.01)
<i>A61P 11/06</i> (2006.01)	<i>A61P 37/06</i> (2006.01)
<i>A61P 13/12</i> (2006.01)	<i>A61P 43/00</i> (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2010/005786

(22) 国際出願日: 2010 年 9 月 27 日(27.09.2010)

(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 2009-220296 2009 年 9 月 25 日(25.09.2009) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 杏林製薬株式会社 (KYORIN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1018311 東京都千代田区神田駿河台 2 丁目 5 番地 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 津吹 猛 (TSUBUKI, Takeshi) [JP/JP]; 〒3290114 栃木県下都賀郡野木町野木 1 8 4 8 杏林製薬株式会社 開発研究所内 Tochigi (JP). 佐川 哲也 (SAGAWA, Tetsuya) [JP/JP]; 〒3290114 栃木県下都賀郡野木町野木 1 8 4 8 杏林製薬株式会社 開発研究所内 Tochigi (JP). 船田 恵子 (FUNADA,

Keiko) [JP/JP]; 〒3290114 栃木県下都賀郡野木町野木 1 8 4 8 杏林製薬株式会社 開発研究所内 Tochigi (JP). 荒谷 一郎 (ARAYA, Ichiro) [JP/JP]; 〒3290114 栃木県下都賀郡野木町野木 1 8 4 8 杏林製薬株式会社 開発研究所内 Tochigi (JP).

(74) 代理人: 水野 勝文, 外 (MIZUNO, Katsufumi et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内 2 丁目 2 番 3 号 丸の内仲通りビル 7 2 1 Tokyo (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, 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, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, 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, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, 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, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (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 (条約第 21 条(3))

(54) Title: MALEIC ACID SALT AND CRYSTAL THEREOF

(54) 発明の名称: マレイン酸塩およびその結晶

(57) Abstract: Disclosed is a benz[d][1,3]oxazine derivative having excellent stability when used as an active ingredient for a medicinal agent, and also having excellent solubility and crystallinity. Specifically disclosed is 2-[2-((S)-3- dimethylaminopyrrolidin-1-yl)pyridine-3-yl]-5-ethyl-7- methoxy-4H-benz[d][1,3]oxazin-4-one maleate.

(57) 要約: 【課題】優れた原薬安定性、溶解性および結晶性を有するベンズ [d] [1, 3] オキサジン誘導体を提供する。【解決手段】 2- [2- ((S) -3-ジメチルアミノピロリジン-1-イル) ピリジン-3-イル] -5-エチル-7-メトキシ-4H-ベンズ [d] [1, 3] オキサジン-4-オンのマレイン酸塩。



WO 2011/036895 A1