(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
2004 年3 月11 日 (11.03.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/020407 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 207/16, A61K 31/40, A61P 3/04, 3/10, 13/08, 19/02, 19/10, 37/00, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/010828

(22) 国際出願日: 2003 年8 月27 日 (27.08.2003)

(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2002-249821 2002 年8 月29 日 (29.08.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO.,LTD.) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都 豊島区 高田３丁目２４番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 福島 浩 (FUKUSHIMA,Hiroshi) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都 豊島区 高田３丁目２４番１号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 平舘 彰 (HIRATATE,Akira) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都 豊島区 高田３丁目２４番１号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 高橋 正人 (TAKAHASHI,Masato) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都 豊島区 高田３丁目２４番１号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 亀尾 一弥 (KAMEO,Kazuya) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都 豊島区 高田３丁目２４番１号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 佐鳥 宗一, 外(SATORI,Soichi et al.); 〒170-8633 東京都 豊島区 高田３丁目２４番１号 大正製薬株式会社 知的財産部内 Tokyo (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, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, 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, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, 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。

WO 2004/020407 A1

(54) Title: BENZENESULFONATE OF 4-FLUORO-2-CYANOPYRROLIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: ４－フルオロ－２－シアノピロリジン誘導体ベンゼンスルホン酸塩

(57) Abstract: (2S,4S)-2-cyano-4-fluoro-1-[(2-hydroxy-1,1-dimethyl)ethylamino]acetylpyrrolidine benzenesulfonate which shows an excellent DPPIV inhibitory activity and has properties required as a medicine, for example, a high stability. This compound can be easily obtained in the form of highly stable crystals having a uniform shape and has a high solid stability.

(57) 要約: 優れたDPPIV阻害活性を示し、且つ安定性等の医薬品として必要な物性を兼ね備えた（２Ｓ,４Ｓ）－２－シアノ－４－フルオロ－[（２－ヒドロキシ－１,１－ジメチル）エチルアミノ]アセチルピロリジン・ベンゼンスルホン酸塩。本発明は高純度且つ均一な結晶系としての取得が容易であり、優れた固体安定性を備えている。