(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 12 月 22 日(22.12.2011)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2011/158880 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 401/12 (2006.01) *A61P 9/12* (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01) *A61P 13/12* (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2011/063735

(22) 国際出願日: 2011 年 6 月 15 日(15.06.2011)

(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 2010-137194 2010 年 6 月 16 日(16.06.2010) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 武田薬品工業株式会社(TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED) [JP/JP]; 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町四丁目１番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): 北山 理乙 (KITAYAMA, Masato) [JP/JP]; 〒5328686 大阪府大阪市淀川区十三本町二丁目１７番８５号 武田薬品工業株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目１番１号 明治安田生命大阪御堂筋ビル 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, 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.

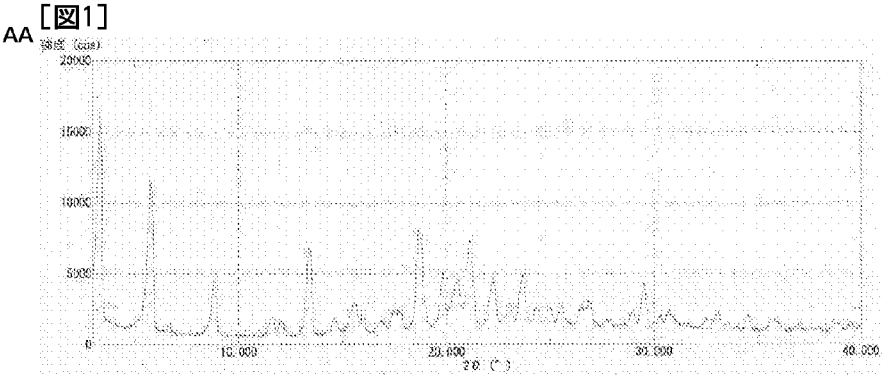
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT,

[続葉有]

(54) **Title**: CRYSTAL OF AMIDE COMPOUND

(54) 発明の名称 : アミド化合物の結晶

[図1]



(57) **Abstract**: Disclosed is a crystal of 1-(4-methoxybutyl)-N-(2-methylpropyl)-N-[(3S,5R)-5-(morpholine-4-ylcarbonyl)piperidine-3-yl]-1H-benzoimidazole-2-carboxamide hydrochloride that has excellent renin inhibitory activity and that is useful as a preventative or therapeutic agent for types of organ dysfunction and the like that stem from high blood pressure and hypertension. The crystal of 1-(4-methoxybutyl)-N-(2-methylpropyl)-N-[(3S,5R)-5-(morpholine-4-ylcarbonyl)piperidine-3-yl]-1H-benzoimidazole-2-carboxamide hydrochloride has powder X-ray diffraction pattern wherein the lattice spacing (d) of powder X-ray diffraction has characteristic peaks appearing in the vicinity of 26.43±0.2, 7.62±0.2, and 4.32±0.2 angstroms.

(57) 要約: 優れたレニン阻害活性を有し、高血圧および高血圧症に起因する各種臓器障害等の予防または治療剤として有用な１－（４－メトキシブチル）－Ｎ－（２－メチルプロピル）－Ｎ－［（３Ｓ，５Ｒ）－５－（モルホリン－４－イルカルボニル）ピペリジン－３－イル］－１Ｈ－ベンズイミダゾール－２－カルボキサミド塩酸塩の結晶の提供。粉末Ｘ線回折の格子面間隔（ｄ）が２６．４３±０．２、７．６２±０．２、および４．３２±０．２オングストローム付近に特徴的ピークが現れる粉末Ｘ線回折パターンを有する１－（４－メトキシブチル）－Ｎ－（２－メチルプロピル）－Ｎ－［（３Ｓ，５Ｒ）－５－（モルホリン－４－イルカルボニル）ピペリジン－３－イル］－１Ｈ－ベンズイミダゾール－２－カルボキサミド塩酸塩の結晶。

WO 2011/158880 A1

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).

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）