

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2008年8月7日 (07.08.2008)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2008/093853 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 407/06 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)

3 エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 鎌原
崇 (KAMAHARA, Takashi) [JP/JP]; 〒2990241 千葉県
袖ヶ浦市代宿 9 8 - 1 - 5 1 0 Chiba (JP). 吉田政史
(YOSHIDA, Masashi) [JP/JP]; 〒1660003 東京都杉並
区高円寺南 1 - 1 6 - 2 1 パルスコート II 1 0 3
Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2008/051695

(22) 国際出願日: 2008年1月28日 (28.01.2008)

(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2007-017491 2007年1月29日 (29.01.2007) JP
60/888,257 2007年2月5日 (05.02.2007) US

(74) 代理人: 古谷聡, 外 (FURUYA, Satoshi et al.); 〒
1030007 東京都中央区日本橋浜町 2 - 1 7 - 8 浜
町花長ビル 6 階 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, 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, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エー
ザイ・アール・アンド・ディー・マネジメント株
式会社 (EISAI R & D MANAGEMENT CO., LTD.)
[JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川四丁目 6 番
1 0 号 Tokyo (JP). メルシャン株式会社 (MERCIAN
CORPORATION) [JP/JP]; 〒1048305 東京都中央区京
橋一丁目 5 番 8 号 Tokyo (JP).

(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, 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 (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU,
IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE,
SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 石原比呂之
(ISHIHARA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つく
ば市東光台 5 丁目 1 番 3 エーザイ株式会社筑波研
究所内 Ibaraki (JP). 佐生学 (SASHO, Manabu) [JP/JP]; 〒
1128088 東京都文京区小石川 4 丁目 6 番 1 0 号エー
ザイ株式会社内 Tokyo (JP). 佐藤圭三 (SATO, Keizo)
[JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番

添付公開書類:
— 国際調査報告書

(54) Title: SOLID OF MACROLIDE COMPOUND, METHOD FOR PRODUCTION THEREOF, AND PHARMACEUTICAL COMPOSITION COMPRISING THE SAME

(54) 発明の名称: マクロライド系化合物の固体およびその製造法並びにその医薬組成物

(57) Abstract: Disclosed are: a solid of a compound represented by the formula (I), which is homogeneous and highly pure to such an extent that it can be used as an original drug for the preparation of a pharmaceutical product and has good workability; a method for producing the solid; and a pharmaceutical composition comprising the solid. A solid of (8E,12E,14E)-7-[(4-cycloheptylpiperazin-1-yl)-carbonyl]oxy-3,6,16,21-tetrahydroxy-6,10,12,16,20-pentamethyl-18,19-epoxytricos-8,12,14-trien-11-olide is found, which has a homogenized specification and good workability.

(57) 要約: 本発明は、医薬品製造用の原薬として均質で高い純度を有し、かつ作業性が良好である式 (I) の化合物の固体及びその製造法並びにその医薬組成物を提供する。均一化された規格を有し、作業性が良好な (8E,12E,14E)-7-[(4-シクロヘプチルピペラジン-1-イル)カルボニル]オキシ-3,6,16,21-テトラヒドロキシ-6,10,12,16,20-ペンタメチル-18,19-エポキシトリコサ-8,12,14-トリエン-11-オリドの固体を見出した。

WO 2008/093853 A1