

(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
2014 年 12 月 24 日(24.12.2014)



(10) 国際公開番号

WO 2014/203877 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 403/06 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61K 31/7072 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2014/065985
- (22) 国際出願日: 2014 年 6 月 17 日(17.06.2014)
- (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 2013-126567 2013 年 6 月 17 日(17.06.2013) JP
- (71) 出願人: 大鵬薬品工業株式会社(TAIHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1018444 東京都千代田区神田錦町 1-2-7 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 数野 秀樹(KAZUNO, Hideki); 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 大鵬薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 睦見 友信(MUTSUMI, Tomonobu); 〒3670241 埼玉県児玉郡神川町大字元原字豊原 200-22 大鵬薬品工業株式会社内 Saitama (JP).
- (74) 代理人: 岩谷 龍(IWATANI, Ryo); 〒5300003 大阪府大阪市北区堂島 2 丁目 1 番 31 号 京阪堂島ビル 3 階 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, BN, 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, IR, IS, JP, KE, KG, 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, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, 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, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, 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, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, 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: STABILIZED CRYSTAL OF TIPIRACIL HYDROCHLORIDE, AND CRYSTALLIZATION METHOD FOR SAME

(54) 発明の名称: チピラシル塩酸塩の安定形結晶及びその結晶化方法

(57) Abstract: The present invention addresses the problem of producing a stabilized crystal of 5-chloro-6-[(2- iminopyrrolidin-1-yl)methyl]pyrimidine-2,4(1H,3H)-dione monohydrochloride. As a means for solving the problem, a crystal of 5-chloro-6-[(2-iminopyrrolidin-1-yl)methyl]pyrimidine-2,4(1H,3H)-dione monohydrochloride is provided. The crystal has characteristic peaks at diffraction angles ($2\theta \pm 0.1^\circ$) of 11.6° , 17.2° , 17.8° , 23.3° , 27.1° and 29.3° in powder X-ray diffraction.

(57) 要約: 5-クロロ-6-[(2-イミノピロリジン-1-イル)メチル]ピリミジン-2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン・一塩酸塩の安定形結晶を得ることを課題とし、その解決手段として粉末 X 線回折による回折角 ($2\theta \pm 0.1^\circ$) として、 11.6° 、 17.2° 、 17.8° 、 23.3° 、 27.1° 及び 29.3° に特徴的なピークを認める 5-クロロ-6-[(2-イミノピロリジン-1-イル)メチル]ピリミジン-2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン・一塩酸塩の結晶を提供する。



WO 2014/203877 A1