

(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 3 月 6 日(06.03.2014)



(10) 国際公開番号
WO 2014/034902 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 277/20 (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)
A61K 31/426 (2006.01) *C07D 211/22* (2006.01)
A61K 47/40 (2006.01) *C07D 277/56* (2006.01)
A61P 13/02 (2006.01) *C08B 37/16* (2006.01)
A61P 13/10 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2013/073442

(22) 国際出願日: 2013 年 8 月 30 日(30.08.2013)

(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 2012-191080 2012 年 8 月 31 日(31.08.2012) JP

(71) 出願人: 小野薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5418526 大阪府大阪市中央区道修町二丁目 1 番 5 号 Osaka (JP).

(72) 発明者: 谷 耕輔(TANI, Kousuke); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 木下 晶博(KINOSHITA, Akihiro); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 花田 圭介(HANADA, Keisuke); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 荒谷 祥之(ARATANI, Yoshiyuki); 〒9138538 福井県坂井市三国町山岸第 5 0 号 1 0 番地 小野薬品工業株式会社内 Fukui (JP). 根門 孝裕(NEKADO, Takahiro); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 島袋 厚志(SHIMABUKURO, Atsushi); 〒

6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 青木 篤, 外(AOKI, Atsushi et al.); 〒1058423 東京都港区虎ノ門三丁目 5 番 1 号 虎ノ門 3 7 森ビル 青和特許法律事務所 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, 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, 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), ユーロシヤ (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: AMINE SALT AND CRYSTALS THEREOF

(54) 発明の名称: アミン塩とその結晶

(57) Abstract: Provided is a compound that can serve as a drug for the treatment of underactive bladder, which can be administered orally and poses little risk of side effects. Also provided are crystals that are advantageous as the bulk drug of a pharmaceutical in terms of stability, long-term storage, ease of handling, ease of formulation, and the like. Salts of 2-[(2-{(1R,5R)-2-oxo-5-[(1E,4S)-7,8,8-trifluoro-4-hydroxy-4-methyl-1,7-octadien-1-yl]cyclopentyl}ethyl)thio]-1,3-thiazole-4-carboxylic acid, or a mixture of diastereomers thereof, and 4-piperidinemethanol are extremely chemically stable crystals and therefore permit long-term storage and are very useful as the bulk drug of a pharmaceutical.

(57) 要約: 副作用リスクが少なく、経口投与が可能な低活動膀胱治療薬となり得る化合物を提供する。また、医薬品の原薬として、安定性、長期保存、取り扱いやすさ、製剤化の容易さ等の点で有利な結晶を提供する。2-[(2-{(1R, 5R)-2-オキソ-5-[(1E, 4S)-7, 8, 8-トリフルオロ-4-ヒドロキシ-4-メチル-1, 7-オクタジエン-1-イル]シクロペンチル}エチル)チオ]-1, 3-チアゾール-4-カルボン酸またはそのジアステレオマー混合物と、4-ピペリジンメタノールとの塩は、化学的に非常に安定な結晶であるため、長期保存も可能であり、医薬品の原薬として大変有用である。

WO 2014/034902 A1