

(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
2016 年 12 月 29 日(29.12.2016)



(10) 国際公開番号
WO 2016/208576 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 487/04 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/53 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2016/068381
- (22) 国際出願日: 2016 年 6 月 21 日(21.06.2016)
- (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:
62/183577 2015 年 6 月 23 日(23.06.2015) US
- (71) 出願人: 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 MANAGE-
MENT CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区
小石川四丁目 6 番 1 0 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 櫛田 郁雄(KUSHIDA Ikuo); 〒3002635 茨
城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ
株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 伊藤 洋子
(ITO Yoko); 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁
目 1 番地 3 エーザイ株式会社 筑波研究所内
Ibaraki (JP).
- (74) 代理人: 長谷川 芳樹, 外(HASEGAWA Yoshiki et
al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内二丁目 1 番
1 号丸の内 MY PLAZA (明治安田生命
ビル) 9 階 創英国際特許法律事務所 Tokyo
(JP).

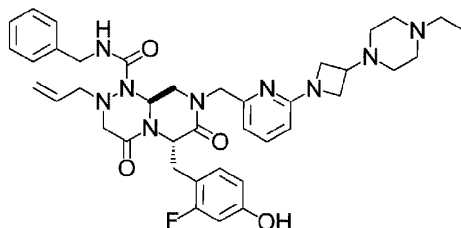
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保
護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA,
BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN,
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN,
IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR,
LS, LU, LY, MA, MD, ME, 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, ST, 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))
- 明細書の別個の部分として表した配列リスト
(規則 5.2(a))

(54) Title: CRYSTAL OF (6S,9aS)-N-BENZYL-6-[(4-HYDROXYPHENYL)METHYL]-4,7-DIOXO-8-({6-[3-(PIPERAZIN-1-YL)AZETIDIN-1-YL]PYRIDIN-2-YL}METHYL)-2-(PROP-2-EN-1-YL)-OCTAHYDRO-1H-PYRAZINO[2,1-c][1,2,4]TRIAZINE-1-CARBOXAMIDE COM-
POUND

(54) 発明の名称: (6S, 9aS)-N-ベンジル-6-[(4-ヒドロキシフェニル)メチル]-4, 7-ジオキソ-
8-({6-[3-(ピペラジン-1-イル)アゼチジン-1-イル]ピリジン-2-イル}メチル)-2-(プロプ-2-
-エン-1-イル)-オクタヒドロ-1H-ピラジノ[2, 1-c][1, 2, 4]トリアジン-1-カルボキサミド化合
物の結晶



(57) Abstract: The present invention provides a crystal of (6S,9aS)-N-benzyl-6-({6-[3-(4-ethylpiperazin-1-yl)azetidin-1-yl]pyridin-2-yl}methyl)-6-(2-fluoro-4-hydroxybenzyl)-4,7-dioxo-2-(prop-2-en-1-yl)hexahydro-2H-pyrazino[2,1-c][1,2,4]triazine-1(6H)-carboxamide.

(57) 要約: 本発明は、(6S, 9aS)-N-ベンジル-6-({6-[3-(4-エチルピペラジン-1-
-イル)アゼチジン-1-イル]ピリジン-2-イル}メチル)-6-(2-フルオロ-4-ヒドロキシ
ベンジル)-4, 7-ジオキソ-2-(プロプ-2-エン-1-イル)ヘキサヒドロ-2H-ピラジノ
[2, 1-c][1, 2, 4]トリアジン-1(6H)-カルボキサミドの結晶を提供する。

WO 2016/208576 A1