(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
2006 年5 月4 日 (04.05.2006)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2006/046499 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 209/42 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/019478

(22) 国際出願日: 2005 年10 月24 日 (24.10.2005)

(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 2004-313040
2004 年10 月27 日 (27.10.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): キッセイ薬品工業株式会社 (KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒3998710 長野県松本市芳野１９番４８号 Nagano (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山口 敏章 (YAMAGUCHI, Toshiaki) [JP/JP]; 〒3998710 長野県松本市芳野１９番４８号 キッセイ薬品工業株式会社本社内 Nagano (JP). 土屋 依久雄 (TSUCHIYA, Ikuo) [JP/JP]; 〒1120002 東京都文京区小石川３丁目１番３号 キッセイ薬品工業株式会社東京本社内 Tokyo (JP). 菊地 健 (KIKUCHI, Ken) [JP/JP]; 〒9130038 福井県坂井郡三国町テクノポート２丁目７－２号 キッセイ薬品工業株式会社工業化研究所内 Fukui (JP). 柳 孝志 (YANAGI, Takashi) [JP/JP]; 〒3998304 長野県安曇野市穂高柏原４３６５－１ キッセイ薬品工業株式会社中央研究所内 Nagano (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, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, 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, 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, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) **Title:** INDOLINE COMPOUND AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME

(54) 発明の名称: インドリン化合物およびその製造方法

(57) **Abstract:** A process for industrially producing silodosin, which is a therapeutic agent for urination disorders accompanying prostatic hypertrophy. The process for silodosin production is characterized by mixing 3-{7-cyano-5-[(2R)-2-({2-[2-(2,2,2-trifluoroethoxy)phenoxy]ethyl}amino)propyl]-2,3dihydro-1H-indol-1-yl}propyl benzoate with oxalic acid to yield an oxalate, subsequently hydrolyzing the oxalate to yield 1-(3-hydroxypropyl)-5-[(2R)-2-({2-[2-(2,2,2-trifluoroethoxy)phenoxy]ethyl}amino)propyl]-2,3-dihydro-1H-indole-7-carbonitrile, and hydrolyzing it. Also provided is an intermediate for use in the production.

(57) 要約: 前立腺肥大症に伴う排尿障害治療薬であるシロドシンの工業的製造方法を提供する。３－｛７－シアノ－５－［（２Ｒ）－２－（｛２－［２－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェノキシ］エチル｝アミノ）プロピル］－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インドール－１－イル｝プロピルベンゾエートをシュウ酸と混合してシュウ酸塩とし、次いでこれを加水分解して１－（３－ヒドロキシプロピル）－５－［（２Ｒ）－２－（｛２－［２－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェノキシ］エチル｝アミノ）プロピル］－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インドール－７－カルボニトリルとし、さらに加水分解することを特徴とするシロドシンの製造方法、及びそれに用いられる製造中間体化合物。

WO 2006/046499 A1