(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
2004 年3 月18 日 (18.03.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/022538 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 209/08, A61K 31/404, 9/20, 9/48, 47/02, 45/00, A61P 13/02

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/011345

(22) 国際出願日: 2003 年9 月5 日 (05.09.2003)

(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2002-262157 2002 年9 月6 日 (06.09.2002) 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]; 〒399-8710 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): 鶴 栄治 (TSURU,Eiji) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町大字柏原４３６５−１ キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 戸田 道雄 (TODA,Michio) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町大字柏原４３６５−１ キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 平田 一満 (HIRATA,Kazuma) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町大字柏原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 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

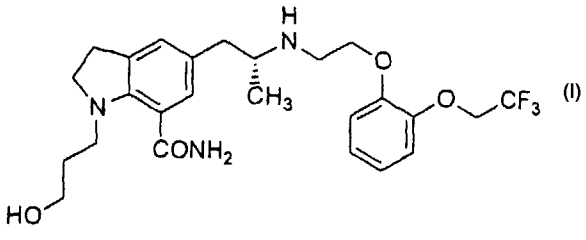
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, 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:** CRYSTAL FOR ORAL SOLID DRUG AND ORAL SOLID DRUG FOR DYSURIA TREATMENT CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: 経口用固形医薬用結晶およびそれを含む排尿障害治療用経口用固形医薬



(I)

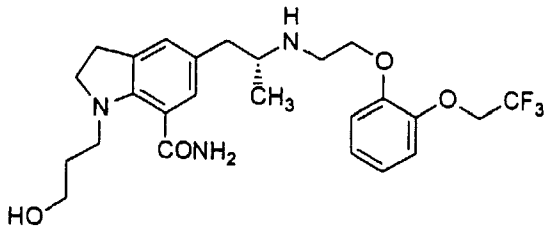
(57) **Abstract:** A crystal for oral solid drug comprised of indoline compound (KMD-3213) which exerts α_1-adrenaline receptor shielding activity, is useful as a therapeutic agent for dysuria and is represented by the formula: (I) wherein in the powder X-ray diffraction pattern, the compound is characterized by main peaks of 5.5°± 0.2°, 6.1°± 0.2°, 9.8°± 0.2°, 11.1°± 0.2°, 12.2°± 0.2°, 16.4°± 0.2°, 19.7°± 0.2° and 20.0°± 0.2° as 2θ. There is further provided an oral solid drug for dysuria treatment containing the crystal as an active ingredient.

[続葉有]

WO 2004/022538 A1

(57) 要約:

本発明は、α_1－アドレナリン受容体遮断作用を有し、排尿障害治療剤として有用な、式



(I)

で表されるインドリン化合物（ＫＭＤ－３２１３）であって、粉末Ｘ線回折パターンにおいて、２θが５．５°±０．２°、６．１°±０．２°、９．８°±０．２°、１１．１°±０．２°、１２．２°±０．２°、１６．４°±０．２°、１９．７°±０．２°および２０．０°±０．２°の主要ピークにより特徴づけられる経口用固形医薬用結晶およびそれを有効成分として含有する排尿障害治療用経口用固形医薬に関するものである。