

(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



(10) 国際公開番号

WO 2011/007895 A1

(43) 国際公開日

2011 年 1 月 20 日(20.01.2011)

PCT

(51) 国際特許分類:

C07D 277/20 (2006.01) A61P 19/06 (2006.01)
A61K 31/426 (2006.01) C07D 277/56 (2006.01)

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2010/062291

(22) 国際出願日:

2010 年 7 月 14 日(14.07.2010)

(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 2009-166755 2009 年 7 月 15 日(15.07.2009) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 帝人ファーマ株式会社 (TELJIN PHARMA LIMITED) [JP/JP]; 〒1000013 東京都千代田区霞が関三丁目 2 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ): 上村 昭仁 (UEMURA, Akihito) [JP/JP]; 〒7400014 山口県岩国市日の出町 2 番 1 号 帝人ファーマ株式会社 岩国研究センター内 Yamaguchi (JP). 野方 倫彰

(NOGATA, Tomoaki) [JP/JP]; 〒7400014 山口県岩国市日の出町 2 番 1 号 帝人エンテック株式会社 岩国事業場内 Yamaguchi (JP). 竹安 巧 (TAKEYASU, Takumi) [JP/JP]; 〒7400014 山口県岩国市日の出町 2 番 1 号 帝人ファーマ株式会社 岩国研究センター内 Yamaguchi (JP).

(74) 代理人: 三原 秀子 (MIHARA, Hideko); 〒1000013 東京都千代田区霞が関三丁目 2 番 1 号 株式会社 帝人知的財産センター内 Tokyo (JP).

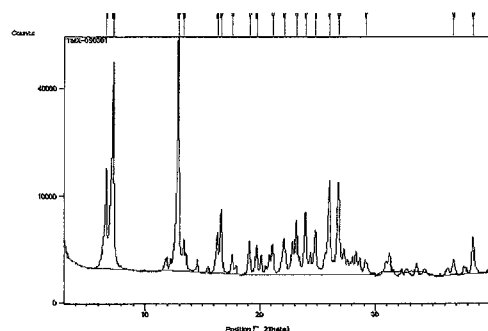
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, 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.

[続葉有]

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING CRYSTALS OF POLYMORPHIC 2-(3-CYANO-4-ISOBUTYLOXYPHENYL)-4-METHYL-5-THIAZOLECARBOXYLIC ACID BY POOR-SOLVENT ADDITION METHOD

(54) 発明の名称: 貧溶媒添加法による 2-(3-シアノ-4-イソブチルオキシフェニル)-4-メチル-5-チアゾールカルボン酸の結晶多形体の製造方法

図 1



AA

ピークリスト

Pos. [2Th.]	NET強度 [cts]	FWHM [2Th.]	d-spacing [Å]	相対強度 [%]
6.7172	14690.42	0.0669	13.15922	24.33
7.3031	49028.04	0.0836	12.10474	81.15
12.9335	60413.65	0.0836	6.84505	100.00
13.3926	2699.66	0.0836	6.61145	4.47
16.2766	3580.13	0.1171	5.44589	5.93
16.6186	6872.47	0.1004	5.33459	11.38
17.5919	1368.28	0.1338	5.04160	2.26
19.1391	2575.99	0.1338	4.63737	4.26
19.7047	2245.86	0.0936	4.50352	3.72
21.1033	2308.52	0.1171	4.20997	3.82
22.0856	2385.00	0.2676	4.02489	3.95
23.1375	5119.95	0.1004	3.84423	8.47
23.9359	6454.61	0.1338	3.71778	10.68
24.8151	3939.06	0.1338	3.58002	6.52
25.9576	12382.36	0.1506	3.42744	20.50
26.8063	12034.96	0.1673	3.32585	19.92
29.1541	770.01	0.3346	3.06314	1.27
36.7951	893.27	0.2676	2.44270	1.48
38.4654	3024.85	0.1171	2.34039	5.01

AA PEAK LIST

BB NET INTENSITY [cts]

CC RELATIVE INTENSITY [%]

(57) Abstract: Disclosed is a process for producing A-form crystals of 2-(3-cyano-4-isobutyloxyphenyl)-4-methyl-5-thiazolecarboxylic acid, the process comprising the step of heating and dissolving 2-(3-cyano-4-isobutyloxyphenyl)-4-methyl-5-thiazolecarboxylic acid in one or more solvents, as good solvents, selected from a group consisting of 1-propanol, 2-propanol, ethanol, and acetone, the step of cooling the solution, and the step of adding a hydrocarbon solvent as a poor solvent to the cooled solution.

(57) 要約: 2-(3-シアノ-4-イソブチルオキシフェニル)-4-メチル-5-チアゾールカルボン酸を、1-プロパノール、2-プロパノール、エタノール、およびアセトンからなる群から選ばれる一つまたは複数の溶媒を富溶媒として加熱溶解する工程、この溶液を冷却する工程、ならびにこの溶液に貧溶媒として炭化水素溶媒を添加する工程を含む、2-(3-シアノ-4-イソブチルオキシフェニル)-4-メチル-5-チアゾールカルボン酸のA晶の製造方法。

WO 2011/007895 A1



(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, 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 (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, SE, SI, SK, SM, 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 (条約第 21 条(3))