

(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
2012 年 2 月 23 日(23.02.2012)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2012/023598 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 309/10 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2011/068736
- (22) 国際出願日: 2011 年 8 月 19 日(19.08.2011)
- (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 2010-184854 2010 年 8 月 20 日(20.08.2010) JP
特願 2010-189739 2010 年 8 月 26 日(26.08.2010) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 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): 木村 好博 (KIMURA, Yoshihiro) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 伊村 維晃 (IMURA, Koreaki) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 大崎尚人 (OSAKI, Naoto) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 松島 歩 (MATSUSHIMA, Ayumi) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).
- (74) 代理人: 小野 新次郎, 外 (ONO, Shinjiro et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町二丁目 2 番 1 号 新大手町ビル 206 区 ユアサハラ法律特許事務所 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, 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, QA, 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.
- (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, RS, 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))

(54) Title: CRYSTAL FORM OF 4-ISOPROPYLPHENYL GLUCITOL COMPOUND AND PROCESS FOR PRODUCTION THEREOF

(54) 発明の名称: 4-イソプロピルフェニル グルシトール化合物の結晶形及びその製造方法

(57) Abstract: Provided are a highly stable crystal of (1S)-1,5-anhydro-1-[5-(4-{(1E)-4-[(1-{[2-(dimethylamino)ethyl]amino}-2-methyl-1-oxopropan-2-yl)amino]-3,3-dimethyl-4-oxobut-1-en-1-yl}benzyl)-2-methoxy-4-(propan-2-yl)phenyl]-D-glucitol and a process for producing the crystal. Specifically provided are an ethanol solvate having the physical properties mentioned below and another multiple crystal forms derived from the ethanol solvate: (a) peaks appear at $2\theta = 5.9^\circ$, 17.1° , 17.6° and 21.5° in powder X-ray diffraction (Cu-K α); (b) characteristic absorption bands appear at 3538 cm^{-1} , 3357 cm^{-1} , 2964 cm^{-1} , 1673 cm^{-1} , 1634 cm^{-1} and 1505 cm^{-1} in infrared absorption spectra; and (c) the melting point is about 111°C .

(57) 要約: (1S)-1, 5-アンヒドロ-1-[5-(4-{(1E)-4-[(1-{[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ}-2-メチル-1-オキソプロパン-2-イル)アミノ]-3, 3-ジメチル-4-オキソブタン-1-エン-1-イル}ベンジル)-2-メトキシ-4-(プロパン-2-イル)フェニル]-D-グルシトールについて、安定性の高い結晶及びその製造方法を提供する。具体的には、以下の物性を有するエタノール溶媒和物と、エタノール溶媒和物から変動された他の複数の結晶形である; (a) 粉末X線回折 (Cu-K α) で、 $2\theta = 5.9^\circ$, 17.1° , 17.6° 及び 21.5° にピークを有する; (b) 赤外吸収スペクトルにおいて、特性吸収帯が 3538 cm^{-1} , 3357 cm^{-1} , 2964 cm^{-1} , 1673 cm^{-1} , 1634 cm^{-1} 及び 1505 cm^{-1} にある; 及び (c) 融点が 111°C 付近である。

WO 2012/023598 A1