(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4 月1 日 (01.04.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/026874 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 471/10, A61K 31/499, A61P 1/04, 1/16, 3/10, 9/00, 11/00, 11/02, 11/06, 13/12, 17/00, 17/06, 19/02, 29/00, 31/04, 31/18, 35/04, 37/02, 37/06, 37/08, 43/00, 25/00, 27/02

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/011835

(22) 国際出願日: 2003 年9 月17 日 (17.09.2003)

(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2002-272079 2002 年9 月18 日 (18.09.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府 大阪市 中央区道修町２丁目１番５号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 高岡 義和 (TAKAOKA,Yoshikazu) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井三丁目１番１号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 岡本 征己 (OKAMOTO,Masaki) [JP/JP]; 〒913-0032 福井県 坂井郡 三国町山岸テクノポートー丁目 ５番２号 小野薬品工業株式会社内 Fukui (JP). 玄番 勇一 (GENBA,Yuichi) [JP/JP]; 〒913-0032 福井県 坂井郡 三国町山岸テクノポートー丁目 ５番２号 小野薬品工業株式会社内 Fukui (JP).

(74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE,Kunihisa); 〒103-0013 東京都 中央区 日本橋人形町２丁目２番６号 堀口第２ビル７階 大家特許事務所 Tokyo (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, EG, 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:** NOVEL CRYSTALS OF TRIAZASPIRO[5.5]UNDECANE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: トリアザスピロ[５.５]ウンデカン誘導体の新規結晶

(57) **Abstract:** It is intended to provide novel crystals of a triazaspiro[5.5]undecane derivative. Crystals of non-solvated (3R)-1-butyl-2,5-dioxo-3-((1R)-1-hydroxy-1-cyclohexylmethyl)-9-(4-(4-carboxyphenyloxy)phenylmethyl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecane hydrochloride are safe as a medicinal material and can be supplied on a large scale. Moreover, these crystals have a potent antagonism to chemokine/chemokine receptors. Owing to these characteristics, they are useful in producing preventives and/or remedies for various inflammatory diseases, asthma, atopic dermatitis, urticaria, allergic diseases, nephritis, nephropathy, hepatitis, arthritis, rheumatoid arthritis, autoimmune diseases, rejection in transplanted organs, acquired immune deficiency syndrome, etc.

(57) 要約: 本発明は、トリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体の新規結晶に関する。(3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-(4-カルボキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩の無溶媒和物の結晶は、医薬品原薬として安全で、かつ大量に供給可能であり、また、強力なケモカイン/ケモカイン受容体の拮抗作用を有することから、各種炎症性疾患、喘息、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー疾患、腎炎、腎症、肝炎、関節炎、慢性関節リウマチ、自己免疫疾患、移植臓器拒絶反応、後天性免疫不全症候群等の予防および/または治療剤の製造に有用である。

WO 2004/026874 A1