【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成17年2月10日(2005.2.10)

【公表番号】特表2002-514171(P2002-514171A)
【公表日】平成14年5月14日(2002.5.14)
【出願番号】特願平10-509038
【国際特許分類第７版】
　Ｃ０７Ｈ　17/08
　Ｃ０７Ｈ　 1/06
// Ａ６１Ｋ　31/7048
　Ａ６１Ｐ　31/04
【ＦＩ】
　Ｃ０７Ｈ　17/08　　Ｂ
　Ｃ０７Ｈ　 1/06
　Ａ６１Ｋ　31/7048
　Ａ６１Ｐ　31/04

【手続補正書】
【提出日】平成16年4月7日(2004.4.7)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】補正の内容のとおり
【補正方法】変更
【補正の内容】

手 続 補 正 書

平成１６年４月７日

特許庁長官 殿

適

１．事件の表示　　平成１０年特許願第５０９０３８号

２．補正をする者

名　称　　アボット・ラボラトリーズ

３．代 理 人　　東京都新宿区新宿１丁目１番１１号 友泉新宿御苑ビル
(郵便番号 160-0022) 電話 (03)3354-8623
(6200)　弁理士　川 口 義 雄

４．補正命令の日付　　自 発

５．補正により増加する請求項の数　　なし

方式審査 喜多川

６．補正対象書類名　　明細書、請求の範囲

７．補正対象項目名　　明細書、請求の範囲

特許庁 16.4.8 出願支援課 綿貫

８．補正の内容

（１）請求の範囲を別紙のとおり補正する。

（２）明細書中、第２３頁第５行目の「表１」以下を、

表　1

X線[1]	実験	差	標準位置 +/- 0.20
8.596	8.393	0.203	8.39
9.528	9.331	0.197	9.33
10.905	10.716	0.189	10.72
11.515	11.334	0.181	11.33
11.926	11.739	0.187	11.74
12.425	12.237	0.188	12.24
13.813	13.624	0.189	13.62
14.161	13.968	0.193	13.97
15.231	15.030	0.201	15.03
	15.280		
16.566	16.372	0.194	16.37
16.978	16.797	0.181	16.80
17.353	17.162	0.191	17.16
17.605	17.383	0.222	17.38
18.160	17.969	0.191	17.97
18.418	18.201	0.217	18.20
19.123	18.906	0.217	18.91
19.965	19.749	0.216	19.75
20.532	20.337	0.195	20.34
22.277	22.075	0.202	22.08
24.974	24.788	0.186	24.79

Ｘ線[1]：　計算粉末Ｘ線回折パターン

と補正する。

（３）同中、第２４頁第５行目に、「２０．０８」とあるのを、「２２．０８」と補正する。

［別　紙］

請　求　の　範　囲

１．　溶媒を含まない６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡ形態ＩＩ結晶の製造方法であって、該製造方法が、

工程（ａ）　６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡを以下の（ｉ）～（ｘｉｉ）から成る群から選択される溶媒で処理し：

（ｉ）炭素原子１～５個のアルカノール、但し、該アルカノールがエタノールまたはイソプロパノールではないことを条件とする；

（ｉｉ）炭素原子５～１２個の炭化水素；

（ｉｉｉ）炭素原子３～１２個のケトン；

（ｉｖ）炭素原子３～１２個のカルボキシルエステル、但し、該カルボキシルエステルが酢酸イソプロピルではないことを条件とする；

（ｖ）炭素原子４～１０個のエーテル；

（ｖｉ）ベンゼン；

（ｖｉｉ）　炭素原子１～４個のアルキル、炭素原子１～４個のアルコキシ、ニトロおよびハロゲンから成る群から選択される１つまたはそれ以上の置換基で置換されたベンゼン；

（ｖｉｉｉ）極性非プロトン性溶媒；

（ｉｘ）式ＨＮＲ^{1}Ｒ^{2}［式中、Ｒ^{1}およびＲ^{2}はそれぞれ、水素および炭素原子１～４個のアルキルから選択され、但し、Ｒ^{1}およびＲ^{2}の両方が水素でないことを条件とする。］で示される化合物；

（ｘ）水混和性有機溶媒および水混和性アルカノールから成る群から選択される水混和性溶媒と水、

（ｘｉ）メタノールと以下の溶媒から成る群から選択される第二溶媒：

・炭素原子５～１２個の炭化水素；

・炭素原子２～５個のアルカノール；

・炭素原子３～１２個のケトン；

・炭素原子３～１２個のカルボキシルエステル；

・炭素原子４～１０個のエーテル；

・ベンゼン；および

・炭素原子１～４個のアルキル、炭素原子１～４個のアルコキシ、ニトロおよびハロゲンから成る群から選択される１つまたはそれ以上の置換基で置換されたベンゼン；および

（ｘｉｉ）炭素原子５～１２個の炭化水素と以下の溶媒から成る群から選択される第二溶媒：

・炭素原子３～１２個のケトン；

・炭素原子３～１２個のカルボキシルエステル；

・炭素原子４～１０個のエーテル；

・ベンゼン；

・炭素原子１～４個のアルキル、炭素原子１～４個のアルコキシ、ニトロおよびハロゲンから成る群から選択される１つまたはそれ以上の置換基で置換されたベンゼン；および

・極性非プロトン溶媒、

および

工程（ｂ）　残存する溶媒を除去して６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡ形態ＩＩ結晶を溶媒から分離し、該６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡ形態ＩＩ結晶を単離する、

ことを含んで成る方法。

２．　前記工程（ａ）で用いる６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡがエリスロマイシンＡを６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡに変換して得られることを特徴とする請求項１に記載の方法。

３．　前記変換が、

（ｉ）　エリスロマイシンＡをエリスロマイシンＡ９－オキシム誘導体に変換し；

（ｉｉ）　工程（ｉ）で製造されるエリスロマイシンＡ９－オキシム誘導体の２’および４”ヒドロキシ基を保護し；

（ｉｉｉ）　工程（ii）の生成物をメチル化剤と反応させ；

（ｉｖ） 工程（iii）の生成物を脱保護および脱オキシムして、６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡを生成する；

ことを含む請求項２に記載の方法。

４． 溶媒が、水と水混和性有機溶媒または水混和性アルカノールから成る請求項１に記載の方法。

５． 溶媒が、水と水混和性有機溶媒または水混和性アルカノールを、１：１容量部の比率で含む請求項４に記載の方法。

６． 溶媒が、水と水混和性有機溶媒から成る請求項４に記載の方法。

７． 水混和性有機溶媒がテトラヒドロフランである請求項６に記載の６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡ形態ＩＩ結晶の製造方法。

８． 溶媒が、水と水混和性アルカノールから成る請求項４に記載の方法。

９． 水混和性アルカノールが、メタノール、エタノールおよびイソプロパノールから成る群から選択される請求項８に記載の方法。

１０． 溶媒が、メタノールと以下の溶媒から成る群から選択される第二溶媒：

・炭素原子５～１２個の炭化水素；
・炭素原子２～５個のアルカノール；
・炭素原子３～１２個のケトン；
・炭素原子３～１２個のカルボキシルエステル；
・炭素原子４～１０個のエーテル；
・ベンゼン；および
・炭素原子１～４個のアルキル、炭素原子１～４個のアルコキシ、ニトロおよびハロゲンから成る群から選択される１つまたはそれ以上の置換基で置換されたベンゼン；

から成る請求項１に記載の方法。

１１． 溶媒が、メタノールと炭素原子２～５個のアルカノールまたは炭素原子３～１２個のカルボキシルエステルから成る請求項１０に記載の方法。

１２． 溶媒が、メタノールと炭素原子２～５個のアルカノールまたは炭素原子３～１２個のカルボキシルエステルを、１：１容量部の比率で含む請求項１１に記載の方法。

１３．　溶媒が、メタノールとエタノールまたは酢酸イソプロピルから選択される第二溶媒から成る請求項１１に記載の方法。

１４．　溶媒が、式ＨＮＲ^{1}Ｒ^{2}［式中、Ｒ^{1}およびＲ^{2}はそれぞれ、水素および炭素原子１～４個のアルキルから選択され、但し、Ｒ^{1}およびＲ^{2}の両方が水素でないことを条件とする。］で示される化合物から成る請求項１に記載の方法。

１５．　溶媒がイソプロピルアミンである請求項１４に記載の方法。

１６．　溶媒が、

アセトン、

ヘプタン、

トルエン、

メチルｔｅｒｔ－ブチルエーテル、

Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、

酢酸エチル、

キシレン、

イソプロパノール－水、

テトラヒドロフラン－水、

エタノール－水、

エチルエーテル、

酢酸アミル、

酢酸イソプロピル－メタノール、

ジイソプロピルエーテル、

酪酸イソプロピル、

イソプロピルアミン、および

メタノール－エタノール、

から成る群から選択される請求項１に記載の方法。

１７．　以下の：

８．３９±０．２０、９．３３±０．２０、１０．７２±０．２０、１１．３３±０．２０、１１．７４±０．２０、１２．２４±０．２０、１３．６２±０．２０、１３．９７±０．２０、１５．０３±０．２０、１６．３７±０．２０、

１６．８０±０．２０、１７．１６±０．２０、１７．３８±０．２０、１７．９７±０．２０、１８．２０±０．２０、１８．９１±０．２０、１９．７５±０．２０、２０．３４±０．２０、２２．０８±０．２０、および２４．７９±０．２０

で示されるＸ線２－Θ角度位置を有することを特徴とする、溶媒を含まない形態ＩＩ結晶の６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡ。

１８．　抗生物質治療のための医薬品の製造における請求項１７に記載の溶媒を含まない形態ＩＩ結晶の６－Ｏ－メチルエリスロマイシンＡの使用。

１９．　上部気管の感染治療のための医薬品の製造のための請求項１８に記載の使用。