

【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】令和5年5月8日(2023.5.8)

【公開番号】特開2020-189856(P2020-189856A)

【公開日】令和2年11月26日(2020.11.26)

【年通号数】公開・登録公報2020-048

【出願番号】特願2020-133620(P2020-133620)

【国際特許分類】

C 0 7 D 2 0 7 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

C 0 7 D 2 0 7 / 1 2

A 6 1 K 3 1 / 4 0

A 6 1 P 1 7 / 0 0

A 6 1 P 2 5 / 0 2 1 0 3

A 6 1 P 2 5 / 0 2 1 0 5

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

20

【手続補正書】

【提出日】令和5年4月25日(2023.4.25)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

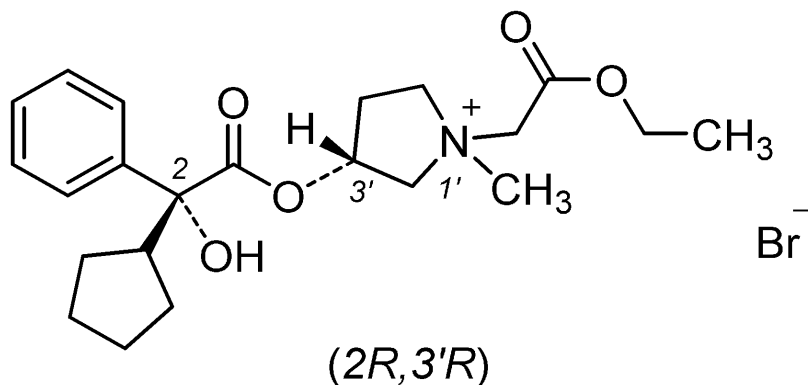
【特許請求の範囲】

30

【請求項1】

式(1)：

【化1】



40

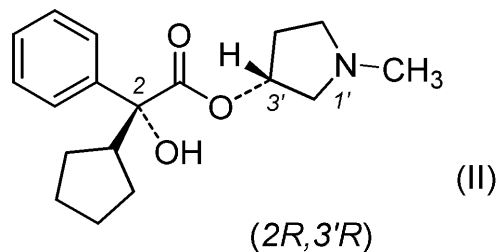
で表される化合物(1)(ソフピロニウム臭化物)の結晶形態の製造方法であって、下記の工程：

工程A'：酢酸エチルを含む溶媒中で、

式(II)：

50

【化 2】



で表される化合物 (II) とプロモ酢酸エチルとを反応させ、化合物 (I) を含む反応液を調製する工程、及び

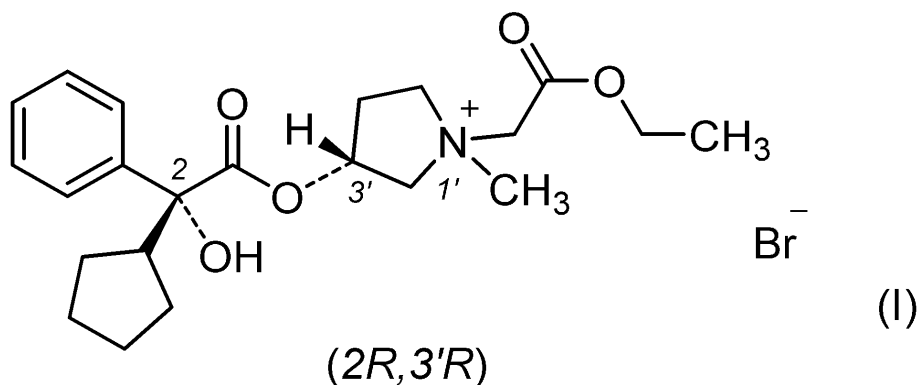
10

工程B：前記反応液をろ過し、化合物 (I) の結晶形態を得る工程、を含む製造方法。

【請求項 2】

式 (I)：

【化 3】



20

で表される化合物 (I) (ソフピロニウム臭化物) の結晶形態の製造方法であって、下記の工程：

工程C：酢酸エチル及びメチルト-ブチルエーテルから選択される溶媒の少なくとも一つを含む溶媒中で、化合物 (I) の懸濁液を調製し、当該懸濁液を1時間以上攪拌する調製する工程、及び

30

工程D：化合物 (I) の前記懸濁液をろ過し、化合物 (I) の結晶形態を得る工程、を含む製造方法。

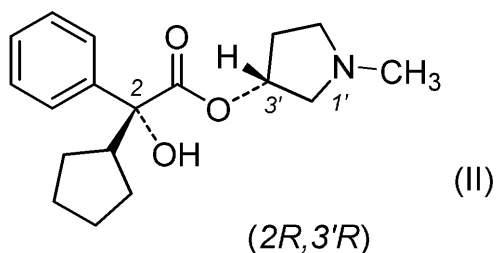
【請求項 3】

請求項 2 に記載の化合物 (I) の結晶形態の製造方法であって、下記の工程：

工程A：溶媒中で、

式 (II)：

【化 4】



40

で表される化合物 (II) とプロモ酢酸エチルとを反応させ、化合物 (I) を含む反応液を調製する工程、

工程B：前記反応液をろ過し、化合物 (I) の結晶形態を得る工程、

50

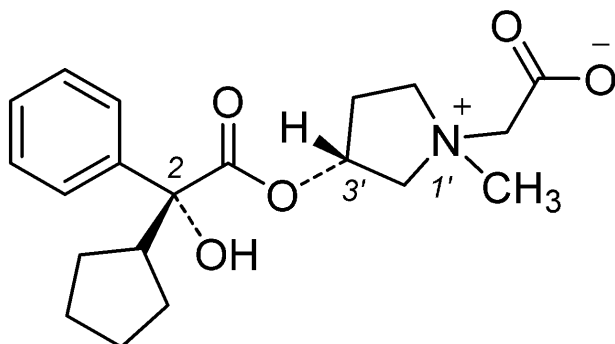
工程C'：酢酸エチル及びメチルト-ブチルエーテルから選択される溶媒の少なくとも一つを含む溶媒中で、化合物(1)の前記結晶形態の懸濁液を調製し、当該懸濁液を1時間以上攪拌する工程、及び

工程D：化合物(1)の前記懸濁液をろ過し、化合物(1)の結晶形態を得る工程、を含む製造方法。

【請求項4】

化合物(1)の含有量に対して、下記式(III)：

【化5】



10

(2R,3'R)

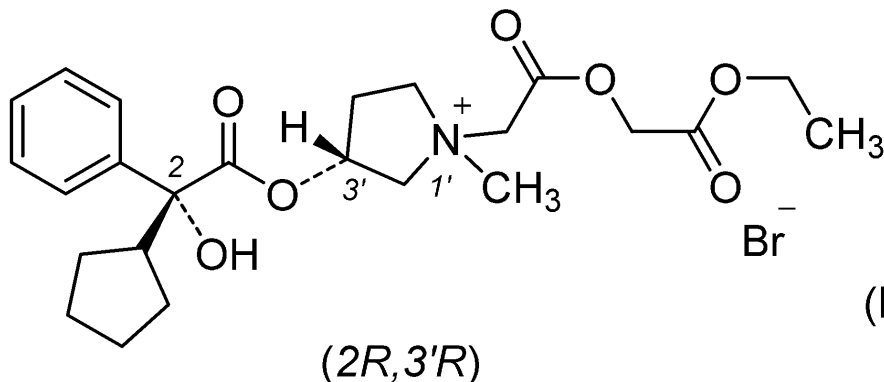
で示される化合物(III)の含有量が0.5w/w%以下である、化合物(1)の結晶形態。

20

【請求項5】

化合物(1)の含有量に対して、下記式(IV)：

【化6】



30

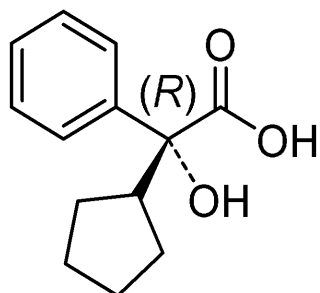
(2R,3'R)

で示される化合物(IV)の含有量が0.5w/w%以下である、化合物(1)の結晶形態。

【請求項6】

化合物(1)の含有量に対して、下記式(V)：

【化7】



40

で示される化合物(V)の含有量が0.5w/w%以下である、化合物(1)の結晶形態。

【請求項7】

化合物(1)の含有量に対して、化合物(III)、化合物(IV)、及び、化合物(V)の各

50

含有量が各々0.5w/w%以下であり、かつ、化合物(Ⅰ)の純度が98.0w/w%以上である、化合物(Ⅰ)の結晶形態。

【請求項8】

化合物(Ⅰ)の含有量に対して、化合物(Ⅲ)、化合物(Ⅳ)、及び、化合物(Ⅴ)の各含有量が各々0.5w/w%以下であり、不純物の総含有量が2.0w/w%以下であり、かつ、化合物(Ⅰ)の純度が98.0w/w%以上である、化合物(Ⅰ)の結晶形態。

【請求項9】

化合物(Ⅰ)の含有量に対して、化合物(Ⅲ)、化合物(Ⅳ)、及び、化合物(Ⅴ)の各含有量が各々0.15w/w%以下であり、不純物の総含有量が1.0w/w%以下であり、かつ、化合物(Ⅰ)の純度が99.0w/w%以上である、化合物(Ⅰ)の結晶形態。

10

【請求項10】

請求項4から9のいずれか1つに記載された化合物(Ⅰ)の結晶形態と薬学的に許容できる担体とを混合する工程を含む方法により製造された、アセチルコリンの作用に関連した疾患の治療及び/又は予防のための医薬組成物。

【請求項11】

請求項4から9のいずれか1つに記載された化合物(Ⅰ)の結晶形態と薬学的に許容できる担体とを混合する工程を含む方法により製造された、多汗症の治療及び/又は予防のための医薬組成物。

【請求項12】

請求項4から9のいずれか1つに記載された化合物(Ⅰ)の結晶形態と薬学的に許容できる担体とを混合する工程を含む方法により製造された、原発性腋下多汗症又は原発性手掌多汗症の治療及び/又は予防のための医薬組成物。

20

【請求項13】

アセチルコリンの作用に関連した疾患の治療及び/又は予防のための医薬組成物を製造する方法であって、請求項4から9のいずれか1つに記載された化合物(Ⅰ)の結晶形態と薬学的に許容できる担体とを混合する工程を含む方法。

【請求項14】

多汗症の治療及び/又は予防のための医薬組成物を製造する方法であって、請求項4から9のいずれか1つに記載された化合物(Ⅰ)の結晶形態と薬学的に許容できる担体とを混合する工程を含む方法。

30

【請求項15】

原発性腋下多汗症又は原発性手掌多汗症の治療及び/又は予防のための医薬組成物を製造する方法であって、請求項4から9のいずれか1つに記載された化合物(Ⅰ)の結晶形態と薬学的に許容できる担体とを混合する工程を含む方法。

40

50