

【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12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-526706(P2004-526706A)
 【公表日】平成16年9月2日(2004.9.2)
 【年通号数】公開・登録公報2004-034
 【出願番号】特願2002-564490(P2002-564490)
 【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 223/22
 A 6 1 K 9/10
 A 6 1 K 9/20
 A 6 1 K 9/44
 A 6 1 K 31/55
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 43/00

【F I】

C 0 7 D 223/22
 A 6 1 K 9/10
 A 6 1 K 9/20
 A 6 1 K 9/44
 A 6 1 K 31/55
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成17年2月3日(2005.2.3)

【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】

【請求項1】

B形態のオクスカルバゼピン(Ox carbazepine)。

【請求項2】

約11.9、14.4、20.0、23.0、25.1±0.2度の2にピークを有するPXRD回折パターンを有するオクスカルバゼピン。

【請求項3】

約11.9、14.4、17.7、19.4、20.0、21.1、23.0、24.0、24.4、25.1、26.0±0.2度の2にピークを有するPXRD回折パターンを有する、請求項2に記載のオクスカルバゼピン。

【請求項4】

実質的に図1に示されたPXRD回折パターンを有する、請求項3に記載のオクスカルバゼピン。

【請求項5】

B形態のオクスカルバゼピンの調製方法であって、以下のステップ：

a)ジクロロメタン及びトルエンの混合物中におけるオクスカルバゼピン溶液の調製、

及び

b) 残渣としてB形態を残す、上記トルエン及び上記ジクロロメタンの蒸発、を含む、前記方法。

【請求項6】

上記溶液がオスカルバゼピンをジクロロメタンに溶解し、そして上記ジクロロメタンをトルエンに加えることにより調製される、請求項5に記載の方法。

【請求項7】

請求項5に記載の方法により調製される、上記B形態のオスカルバゼピン。

【請求項8】

B形態のオスカルバゼピンの調製方法であって、以下のステップ：

a) トルエン中におけるオスカルバゼピン溶液の調製；

b) 上記溶液の加熱；

c) 沈澱の形成をひきおこすための60 /分又はそれより高い速度での上記溶液の冷却；及び

d) 上記沈澱の分離；

を含む、前記方法。

【請求項9】

上記溶液がおよそ灌流温度まで加熱される、請求項8に記載の方法。

【請求項10】

上記溶液が約0 の温度まで冷却される、請求項8に記載の方法。

【請求項11】

請求項8に記載の方法により調製される、上記B形態のオスカルバゼピン。

【請求項12】

C形態のオスカルバゼピン。

【請求項13】

約11.7、21.7、23.2、24.4 ± 0.2度の2 におけるPXRDのピークに特徴を有する、オスカルバゼピン。

【請求項14】

約11.7、17.0、18.0、21.7、23.2、24.4、26.0 ± 0.2度の2 におけるPXRDのピークに特徴を有する、請求項13に記載のオスカルバゼピン。

【請求項15】

実質的に図2に示されたPXRD回折パターンに特徴を有する、請求項14に記載のオスカルバゼピン。

【請求項16】

C形態のオスカルバゼピンの調製方法であって、以下のステップ：

a) トルエン中におけるオスカルバゼピン溶液の調製；

b) 上記溶液の加熱；

c) 沈澱の形成をひきおこすための約20 ~ 60 /分の速度での上記溶液の冷却；

d) 上記沈澱の分離；

を含む、前記方法。

【請求項17】

上記溶液が毎分約40 の速度で冷却される、請求項16に記載の方法。

【請求項18】

上記溶液が約0 まで冷却される、請求項16に記載の方法。

【請求項19】

上記溶液がおよそ灌流温度まで加熱される、請求項16に記載の方法。

【請求項20】

請求項16に記載の方法により調製される、上記C形態のオスカルバゼピン。

【請求項21】

D形態のオクスカルバゼピン。

【請求項22】

約11.7、14.2、24.3 ± 0.2度の2θにおけるPXRDのピークに特徴を有する、オクスカルバゼピン。

【請求項23】

実質的に図3に示されたPXRD回折パターンに特徴を有する、請求項22に記載のオクスカルバゼピン。

【請求項24】

D形態のオクスカルバゼピンの調製方法であって、以下のステップ：

a) トルエン中におけるオクスカルバゼピン溶液の調製；及び

b) 残渣としてD形態のオクスカルバゼピンを残す、上記トルエンの蒸発；

を含む、前記方法。

【請求項25】

蒸発の前に、上記溶液を加熱するステップをさらに含む、請求項24に記載の方法。

【請求項26】

上記溶液がおよそ灌流温度まで加熱される、請求項25に記載の方法。

【請求項27】

蒸発の前に、上記加熱された溶液を冷却することをさらに含む、請求項25に記載の方法。

【請求項28】

上記溶液が約0℃まで冷却される、請求項27に記載の方法。

【請求項29】

上記溶液を冷却するステップをさらに含む、請求項24に記載の方法。

【請求項30】

上記溶液が約0℃まで冷却される、請求項29に記載の方法。

【請求項31】

上記トルエンが上記溶液から蒸発により除去される、請求項24に記載の方法。

【請求項32】

請求項24に記載の方法により調製される、上記D形態のオクスカルバゼピン。

【請求項33】

オクスカルバゼピン・クロロホルム溶媒和化合物。

【請求項34】

E形態のオクスカルバゼピン・クロロホルム溶媒和化合物。

【請求項35】

約14.5、15.0、18.2、21.4、22.9、24.0、25.8、26.0 ± 0.2度の2θにピークを有するPXRDパターンに特徴を有する、オクスカルバゼピン・クロロホルム溶媒和化合物。

【請求項36】

実質的に図4に示されたPXRD回折パターンに特徴を有する、請求項35に記載のオクスカルバゼピン溶媒和化合物。

【請求項37】

約27重量%のクロロホルムを含む請求項33に記載のオクスカルバゼピン・クロロホルム溶媒和化合物。

【請求項38】

オクスカルバゼピン・クロロホルム溶媒和化合物の調製方法であって、以下のステップ

：

a) クロロホルム中におけるオクスカルバゼピン溶液からの沈澱の形成をひきおこすこと、及び

b) 上記沈澱の分離、
を含む、前記方法。

【請求項 39】

上記沈澱の形成をおこす前に、上記溶液を加熱するステップをさらに含む、請求項 38 に記載の方法。

【請求項 40】

上記加熱された溶液を冷却するステップをさらに含み、ここで冷却が上記沈澱の形成をひきおこす、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 41】

上記溶液が約 50 ~ 約 60 の高温まで加熱される、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 42】

上記溶液が約 55 の高温まで加熱される、請求項 41 に記載の方法。

【請求項 43】

上記加熱された溶液が約 10 ~ 約 20 の低温まで冷却される、請求項 41 に記載の方法。

【請求項 44】

上記低温が約 16 である、請求項 43 に記載の方法。

【請求項 45】

請求項 38 に記載の方法により生産される、上記オクスカルバゼピン・クロロホルム溶媒和化合物。

【請求項 46】

A 形態のオクスカルバゼピンの調製方法であって、以下のステップ：

- a) E 形態のオクスカルバゼピン・クロロホルム溶媒和化合物の供給、
- b) 上記オクスカルバゼピン・クロロホルム溶媒和化合物の加熱、
- c) A 形態としてのオクスカルバゼピンの回収、

を含む、前記方法。

【請求項 47】

上記 E 形態のオクスカルバゼピン溶媒和化合物が約 40 ~ 約 80 の範囲の高温まで加熱される、請求項 46 に記載の方法。

【請求項 48】

上記高温が約 60 である、請求項 47 に記載の方法。

【請求項 49】

A 形態のオクスカルバゼピンの調製方法であって、以下のステップ：

- a) B 形態のオクスカルバゼピンの供給、
- b) 上記オクスカルバゼピンの加熱、及び
- c) A 形態としての上記オクスカルバゼピンの回収、

を含む、前記方法。

【請求項 50】

B 形態のオクスカルバゼピンが約 60 ~ 約 120 の範囲の高温まで加熱される、請求項 49 に記載の方法。

【請求項 51】

上記高温が約 60 である、請求項 50 に記載の方法。

【請求項 52】

C 形態のオクスカルバゼピンの調製方法であって、以下のステップ：

- a) B 形態のオクスカルバゼピンの供給、
- b) 約 20 ~ 約 30 の範囲の温度にオクスカルバゼピンを維持すること、
- c) C 形態としての上記オクスカルバゼピンの回収、

を含む、前記方法。

【請求項 53】

A 形態のオクスカルバゼピンの調製方法であって、以下のステップ：

a) B 形態のオクスカルバゼピン、C 形態のオクスカルバゼピン及び D 形態のオクスカルバゼピンから成る群から選ばれたオクスカルバゼピンをプロトン性の溶媒と接触させる

こと；及び

b) A形態としてのオクスカルバゼピンの回収；

を含む、前記方法。

【請求項54】

上記形態のオクスカルバゼピンがプロトン性の溶媒に懸濁される、請求項53に記載の方法。

【請求項55】

上記プロトン性の溶媒が水及びエタノールから成る群より選ばれる、請求項53に記載の方法。

【請求項56】

上記オクスカルバゼピンが上記プロトン性の溶媒に約2時間～約3日間懸濁される、請求項54に記載の方法。

【請求項57】

上記オクスカルバゼピンが約1日間懸濁される、請求項56に記載の方法。

【請求項58】

医薬組成物であって、以下の：

a) B形態のオクスカルバゼピン、C形態のオクスカルバゼピン、D形態のオクスカルバゼピン及びE形態のオクスカルバゼピンから成る群から選ばれるオクスカルバゼピン；及び

b) 医薬品として許容できる賦形剤；

を含む、前記組成物。

【請求項59】

上記組成物が1又はそれを越える形態のオクスカルバゼピンと混合される、請求項58に記載の医薬組成物。

【請求項60】

請求項58に記載の医薬組成物を含む、医薬品の剤型。

【請求項61】

上記剤型がカプセル又は錠剤である、請求項60に記載の医薬品の剤型。

【請求項62】

上記剤型が錠剤である、請求項61に記載の医薬品の剤型。

【請求項63】

約150mg～約600mgのオクスカルバゼピンの単位用量を含む、請求項60に記載の医薬品の剤型。

【請求項64】

約150mg、300mg及び600mgから成る群から選ばれる単位用量を含む、請求項63に記載の医薬品の剤型。

【請求項65】

上記剤型が経口懸濁液である、請求項60に記載の医薬品の剤型。

【請求項66】

用量が約60mg l^{-1} である、請求項65に記載の医薬品の剤型。

【請求項67】

用量が約300mg l^{-1} である、請求項65に記載の医薬品の剤型。

【請求項68】

発作を予防又は発作の重症度を軽減するための、請求項58に記載の医薬組成物。

【請求項69】

上記発作がてんかんに関連する、請求項68に記載の医薬組成物。

【請求項70】

パーキンソン病の治療のための、請求項58に記載の医薬組成物。

【請求項71】

中枢神経系を抑制するための、請求項58に記載の医薬組成物。

【請求項 7 2】

上記中枢神経系が電位感受性のナトリウムチャンネルをブロックすることにより抑制される、請求項 7 1 に記載の医薬組成物。