

【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 24 年 7 月 19 日 (2012.7.19)

【公表番号】特表 2011-522023 (P2011-522023A)

【公表日】平成 23 年 7 月 28 日 (2011.7.28)

【年通号数】公開・登録公報 2011-030

【出願番号】特願 2011-512213 (P2011-512213)

【国際特許分類】

C 0 7 C 209/88 (2006.01)

C 0 7 C 211/42 (2006.01)

C 0 7 C 209/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/135 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

C 0 7 B 57/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 209/88

C 0 7 C 211/42

C 0 7 C 209/22

A 6 1 K 31/135

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/18

C 0 7 B 57/00 3 6 0

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 5 月 31 日 (2012.5.31)

【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】

1 - アミノインダンと 2 , 3 , 4 , 6 - ジ - O - イソプロピリデン - 2 - ケト - L - グロン酸とのジアステレオマー塩の形成工程を含む、鏡像異性的に純粋な (R) - 1 - アミノインダン (2) の調製方法。

【請求項 2】

塩形成が、有機溶媒または有機溶媒と水との混合物の中で行われる、請求項 1 記載の方法。

【請求項 3】

有機溶媒が、 $C_1 - C_6$ アルコールである、請求項 2 記載の方法。

【請求項 4】

有機溶媒が、メタノール、エタノール、 n -プロパノール、イソプロパノール、 n -ブタノール、イソブタノール、*tert*-ブタノールおよびこれらの混合物を含む群から選択される、請求項 3 記載の方法。

【請求項 5】

有機溶媒が、メタノールまたはメタノールと水との混合物である、請求項 4 記載の方法。

【請求項 6】

形成されたジアステレオマー塩を再結晶する、先行するいずれかの請求項に記載の方法。

【請求項 7】

形成されたジアステレオマー塩を、有機溶媒、水、またはこれらの混合物から再結晶する、請求項 6 記載の方法。

【請求項 8】

形成されたジアステレオマー塩を、有機溶媒と水との混合物から再結晶する、請求項 7 記載の方法。

【請求項 9】

有機溶媒が、 $C_1 - C_6$ アルコールである、請求項 7 または 8 記載の方法。

【請求項 10】

有機溶媒が、メタノール、エタノール、 n -プロパノール、イソプロパノール、 n -ブタノール、イソブタノール、*tert*-ブタノールおよびこれらの混合物を含む群から選択される、請求項 9 記載の方法。

【請求項 11】

形成されたジアステレオマー塩を、メタノールと水との混合物から再結晶する、請求項 10 記載の方法。

【請求項 12】

メタノールと水との比が、約 1 : 0.75 ~ 1 : 1.5 の間である、請求項 11 記載の方法。

【請求項 13】

生成された (R) - 1 - アミノインダン (2) が、ラサジリン (1) またはその薬学上許容される塩に変換される、先行するいずれかの請求項に記載の方法。

【請求項 14】

薬学上許容される塩が、メシレート塩である、請求項 13 記載の方法。

【請求項 15】

請求項 13 の方法に従って調整される、ラサジリン (1) またはその薬学上許容される塩。

【請求項 16】

請求項 14 の方法に従って調整される、ラサジリンメシレート。

【請求項 17】

請求項 13 の方法に従って調整される、鏡像異性的に純粋なラサジリン (1) またはラサジリン (1) の鏡像異性的に純粋な薬学上許容される塩。

【請求項 18】

請求項 14 の方法に従って調整される、鏡像異性的に純粋なラサジリンメシレート。

【請求項 19】

鏡像異性的に純粋なラサジリン (1) またはラサジリン (1) の鏡像異性的に純粋な薬学上許容される塩。

【請求項 20】

鏡像異性的に純粋なラサジリンメシレート。

【請求項 2 1】

化学不純物を実質的に含まない、ラサジリン（１）またはその薬学上許容される塩。

【請求項 2 2】

化学不純物を実質的に含まない、ラサジリンメシレート。

【請求項 2 3】

請求項 1 5、1 7、1 9 または 2 1 に記載のラサジリン（１）またはその薬学上許容される塩を含有する医薬組成物。

【請求項 2 4】

請求項 1 6、1 8、2 0 または 2 2 に記載のラサジリンメシレートを含有する医薬組成物。

【請求項 2 5】

パーキンソン病（PD）（単独療法、またはレボドパへの補助療法によるものが含まれる）、痴呆、アルツハイマー病、うつ、多動性症候群、脳卒中、脳虚血、神経外傷、統合失調症または多発性硬化症の治療もしくは予防のための、請求項 2 3 または 2 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

ラセミの 1 - アミノインダンの類縁体と 2 , 3 , 4 , 6 - ジ - O - イソプロピリデン - 2 - ケト - L - グロン酸とのジアステレオマー塩の形成工程を含む、鏡像異性的に純粋な（R） - 1 - アミノインダン（2）の類縁体の調製方法。

【請求項 2 7】

2 - メチルアミノ - 1 - フェニル - プロパンと 2 , 3 , 4 , 6 - ジ - O - イソプロピリデン - 2 - ケト - L - グロン酸とのジアステレオマー塩の形成工程を含む、鏡像異性的に純粋な（R） - 2 - メチルアミノ - 1 - フェニル - プロパンの調製方法。