

【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27年10月8日(2015.10.8)

【公表番号】特表2013-530959(P2013-530959A)

【公表日】平成25年8月1日(2013.8.1)

【年通号数】公開・登録公報2013-041

【出願番号】特願2013-513534(P2013-513534)

【国際特許分類】

C 0 7 D 307/80 (2006.01)

A 6 1 K 31/343 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 307/80

A 6 1 K 31/343

A 6 1 P 9/06

【誤訳訂正書】

【提出日】平成27年8月19日(2015.8.19)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

5-アミノ-2-ブチル-3-(4-[3-(ジブチルアミノ)プロポキシ]ベンゾイル)ベンゾフランとメタンスルホニルクロリドとを触媒非存在下で反応させ、ドロネダロン塩酸塩を得ることを特徴とする、ドロネダロン塩酸塩の製造方法であって、該触媒が、5-アミノ-2-ブチル-3-(4-[3-(ジブチルアミノ)

プロポキシ]ベンゾイル)ベンゾフランとメタンスルホニルクロリドとの反応において触媒的な作用を有する触媒を指し、5-アミノ-2-ブチル-3-(4-[3-(ジブチルアミノ)プロポキシ]ベンゾイル)ベンゾフランとメタンスルホニルクロリドとの反応が1種の溶媒又は2種以上の混合溶媒で実施され、前記の溶媒が、ニトリル、ケトン、ハロゲン化炭化水素、エーテル及び芳香族炭化水素からなる群より選ばれ、前記の混合溶媒が、同一又は異なって、ニトリル、ケトン、ハロゲン化炭化水素、エーテル及び芳香族炭化水素の2種以上の溶媒からなる群より選ばれることを特徴とする、ドロネダロン塩酸塩の製造方法。

【請求項2】

ニトリルが、C₂～C₆脂肪族ニトリルからなる群より選ばれることを特徴とする、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

ニトリルが、アセトニトリルである、請求項2に記載の方法。

【請求項4】

ケトンが、C₃～C₆脂肪族ケトンからなる群より選ばれることを特徴とする、請求項1に記載の方法。

【請求項5】

ケトンが、アセトンである、請求項4に記載の方法。

【請求項6】

ハロゲン化炭化水素が、C₁～C₆脂肪族ハロゲン化炭化水素からなる群より選ばれるこ

とを特徴とする、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 7】

ハロゲン化炭化水素が、ジクロロメタンであることを特徴とする、請求項 6 に記載の方法

。

【請求項 8】

エーテルが、直鎖及び環状エーテルからなる群より選ばれることを特徴とする、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 9】

直鎖エーテルが、 $C_1 \sim C_6$ 脂肪族エーテルからなる群より選ばれ、環状エーテルが、 $C_2 \sim C_4$ 脂肪族環状エーテルからなる群より選ばれることを特徴とする、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 10】

直鎖エーテルが、1,2-ジメトキシエタンである、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

環状エーテルが、テトラヒドロフランである、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 12】

芳香族炭化水素が、置換及び非置換 $C_6 \sim C_{10}$ 芳香族からなる群より選ばれることを特徴とする、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 13】

芳香族炭化水素が、トルエンである、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

方法が、得られたドロネダロン塩酸塩を精製する工程をさらに含むことを特徴とする、請求項 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 15】

ドロネダロン塩酸塩の精製に使用される溶媒が、アセトンと水との混合物であることを特徴とする、請求項 1 4 に記載の方法。

【請求項 16】

アセトンと水との混合物が、30：1～5：1 (v/v) の比率にあることを特徴とする、請求項 1 5 に記載の方法。

【請求項 17】

請求項 1 ～ 1 6 のいずれか 1 項に記載の手順を含むことを特徴とする、ドロネダロン塩酸塩の製造方法。

【請求項 18】

方法が、さらに、ドロネダロン塩酸塩をアルカリ性溶液による処理を経由してドロネダロンに変換する工程、又は、他の製薬学的に許容される塩にさらに変換する工程を含むことを特徴とする、請求項 1 7 に記載の方法。

【請求項 19】

アルカリ性溶液において使用されるアルカリが無機アルカリであることを特徴とする、請求項 1 8 に記載の方法。

【請求項 20】

無機アルカリが、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム及び炭酸水素ナトリウムからなる群より選ばれることを特徴とする、請求項 1 9 に記載の方法。

【請求項 21】

無機アルカリが、炭酸水素ナトリウムである、請求項 2 0 に記載の方法。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0020

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0020】

本発明は、5-アミノ-2-ブチル-3-(4-[3-(ジブチルアミノ)プロポキシ]ベンゾイル)ベンゾフラン(化合物A)とメタンスルホニルクロリドとを触媒非存在下で反応させ、直接ドロネダロン塩酸塩を得ることを含む、ドロネダロン塩酸塩の製造方法に関する。この方法は、好ましくは1種の溶媒又は多種の溶媒の混合溶媒の存在下で実施される。より好ましくは、この方法はさらに、粗ドロネダロン塩酸塩を精製し、高純度の生成物を得ることを含む。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0025

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0025】

a) 5-アミノ-2-ブチル-3-(4-[3-(ジブチルアミノ)プロポキシ]ベンゾイル)ベンゾフラン(化合物A)を、触媒非存在下でメタンスルホニルクロリドによりアシル化し、粗ドロネダロン塩酸塩を得る。この方法は、好ましくは1種の溶媒又は多種の溶媒の混合溶媒の存在下で実施される。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0029

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0029】

本願において、「触媒」は、5-アミノ-2-ブチル-3-(4-[3-(ジブチルアミノ)プロポキシ]ベンゾイル)ベンゾフラン(化合物A)とメタンスルホニルクロリドとの反応において触媒的な作用を有する触媒試薬、例えば、トリエチルアミンやジプロピルアミンのようなアルキルアミン等の有機アルカリ；及び、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化バリウムのようなアルカリ金属塩やアルカリ土類金属塩等の無機アルカリを含む酸受容体等を指す。