

【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20年1月24日(2008.1.24)

【公表番号】特表2003-515536(P2003-515536A)

【公表日】平成15年5月7日(2003.5.7)

【出願番号】特願2001-540984(P2001-540984)

【國際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006-01)

A 61 K 31/55 (2006-01)

A 6 1 P 37/00 (2006-01)

A 6 1 P 43/00 (2006-01)

〔 F T 〕

C 0 7 D 487/04 1 5 0

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 43/00 1 1 3

【手續補正書】

【提出日】平成19年11月28日(2007.11.28)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

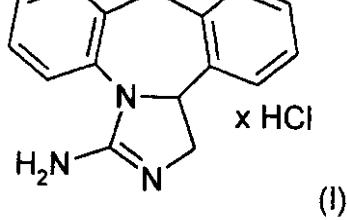
【請求項 1】 式(Ⅰ)のエピナスチン塩酸塩の調製方法であつて、
式(Ⅱ)のエピナスチン塩基を水に懸濁し、塩酸の添加によって7以上のpHで溶解する
第一工程と

第一工程と、
第一工程から得られる水溶液を、水非混和性有機溶媒を用いて抽出し、その後抽出剤を
除去する第二工程と

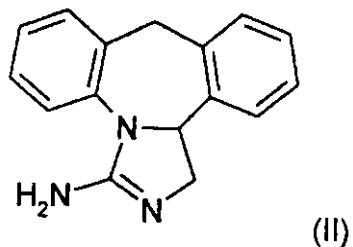
第二工程によって得られる水溶液から塩酸の添加により6以下のpHで式(I)の生成物を沈殿し、次いで乾燥する第三工程とを含む方法によって、式(I)のエピナフチモン塩酸

を洗浄し、次いで乾燥する第二工程とを省略方法によつて、式(1)のエビクサン塩酸塩を調製することを特徴とする前記方法。

10



【化 2】



【請求項 2】 第一工程において、式 (II) のエピナスチン塩基の懸濁液を20~90、好ましくは40~80、最も好ましくは50~70 の温度で塩酸と混合する請求の範囲第1項に記載の方法。

【請求項 3】 第一工程の際の pH が7.5~9、好ましくは8である請求の範囲第1項又は第2項に記載の方法。

【請求項 4】 第二工程において、ハロゲン化炭化水素、エーテル又はエステル、好ましくは酢酸エチル又は酢酸ブチル、特に好ましくは酢酸ブチルを使用する請求の範囲第1項から第3項のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5】 第二工程において、抽出剤をデカンテーションにより除去し、及び/又は必要により共沸蒸留により除去してもよい請求の範囲第1項から第4項のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 6】 第二工程と第三工程の間で水相を活性炭を用いて50~100、好ましくは70~95、特に好ましくは80~90 の温度で精製する請求の範囲第1項から第5項のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 7】 第三工程において、pHを3~5、好ましくは3.5~4.5に、塩酸を添加して調整する請求の範囲第1項から第6項のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 8】 第三工程において、塩酸を25~50、好ましくは30~50 の温度で添加し、次いで水相を放置して冷却する請求の範囲第1項から第6項のいずれか一項に記載の方法。