

【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)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 487/04 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/55 (2006.01)**

**A 6 1 P 37/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

【F I】

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

【手続補正書】

【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

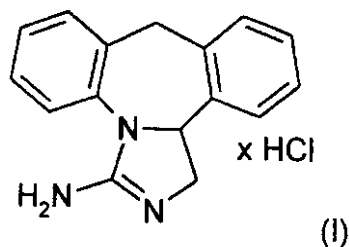
【補正方法】変更

【補正の内容】

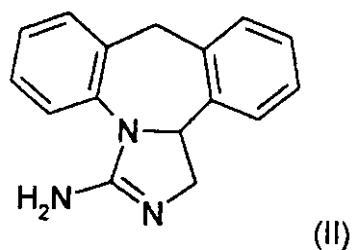
【特許請求の範囲】

【請求項1】 式(I)のエピナスチン塩酸塩の調製方法であって、  
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、  
第一工程から得られうる水溶液を、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)のエピナスチン塩酸  
塩を調製することを特徴とする前記方法。

【化1】



【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。