

【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29年8月24日(2017.8.24)

【公表番号】特表2016-527213(P2016-527213A)

【公表日】平成28年9月8日(2016.9.8)

【年通号数】公開・登録公報2016-054

【出願番号】特願2016-522965(P2016-522965)

【国際特許分類】

C 07 J	43/00	(2006.01)
C 07 B	61/00	(2006.01)
A 61 K	31/58	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	13/08	(2006.01)

【F I】

C 07 J	43/00	
C 07 B	61/00	3 0 0
A 61 K	31/58	
A 61 P	35/00	
A 61 P	43/00	1 1 1
A 61 P	13/08	

【手続補正書】

【提出日】平成29年7月14日(2017.7.14)

【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】

アビラテロン酢酸エステル又はその医薬として許容し得る塩の製造方法であって、該方法が、

塩基及び溶媒の存在下でデヒドロエピアンドロステロン-3-アセテート(DHEAA)をトリフレート化して粗製3- -アセトキシアンドロスター-5,16-ジエン-17-イルトリフルオロメタンスルホネートを形成する第一の工程、及び

該粗製3- -アセトキシアンドロスター-5,16-ジエン-17-イルトリフルオロメタンスルホネートをアビラテロン酢酸エステル又はその塩に変換する第二の工程を含み、

ここで、該第一の工程が、有機塩基の存在下でDHEAAをトリフレート化することを含み、

該方法が、溶媒からの結晶化により、該粗製3- -アセトキシアンドロスター-5,16-ジエン-17-イルトリフルオロメタンスルホネートを精製し、3- -アセトキシアンドロスター-5,16-ジエン-17-イルトリフルオロメタンスルホネートを結晶性固体として得る中間工程を含み、かつ

該方法が、クロマトグラフィーによる3- -アセトキシアンドロスター-5,16-ジエン-17-イルトリフルオロメタンスルホネートの精製工程を含まない、前記方法。

【請求項2】

前記方法が、前記第一の工程の間、未反応のDHEAAをモニタリングすること、並びに未反応のDHEAAが5%未満となった後、粗製3- -アセトキシアンドロスター-5,16-ジエン-17-

イルトリフルオロメタンスルホネートを得ること、及びこれを精製することをさらに含む、請求項1記載の方法。

【請求項3】

前記第一の工程において、芳香族炭化水素溶媒中の塩基の存在下で、DHEAAをトリフレート化する、請求項2記載の方法。

【請求項4】

DHEAA：トリフレート化剤の比率が、少なくとも1:2である、請求項3記載の方法。

【請求項5】

前記塩基が、N,N-ジメチルアニリンである、請求項3記載の方法。

【請求項6】

前記中間工程で使用される溶媒が、水混和性有機溶媒及び水の混合物である、請求項1記載の方法。

【請求項7】

前記水混和性溶媒が、ケトン又はアルコールである、請求項6記載の方法。

【請求項8】

前記ケトンがアセトンであり、かつ前記アルコールがイソプロピルアルコールである、請求項7記載の方法。

【請求項9】

前記方法が、

a. トルエン中のN,N-ジメチルアニリンの存在下で、少なくとも1:2のDHEAA：トリフレート化剤の比率を使用して、DHEAAをトリフレート化すること、

b. トリフレート化の間、未反応のDHEAAをモニタリングすること、並びに未反応のDHEAAが5%未満となった後、粗製3- -アセトキシンドロスター-5,16-ジエン-17-イルトリフルオロメタンスルホネートを得ること、及びこれを精製すること、

c. DHEAA：トリフレート化剤の比率が少なくとも1:2であること、又は

d. 水と、アセトン又はイソプロピルアルコールとの混合物である溶媒からの結晶化により、該粗製3- -アセトキシンドロスター-5,16-ジエン-17-イルトリフルオロメタンスルホネートを精製すること

をさらに含む、請求項1記載の方法。

【請求項10】

98%より高いHPLC純度を有する、結晶性固体の形態の3- -アセトキシンドロスター-5,16-ジエン-17-イルトリフルオロメタンスルホネートが得られる、請求項1~9のいずれか一項記載の方法。