

【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23年1月27日(2011.1.27)

【公開番号】特開2009-40783(P2009-40783A)

【公開日】平成21年2月26日(2009.2.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-008

【出願番号】特願2008-201060(P2008-201060)

【国際特許分類】

C 07 D 211/32 (2006.01)

A 61 K 31/445 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 211/32 C S P

A 61 K 31/445

A 61 P 25/28

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成22年12月6日(2010.12.6)

【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】

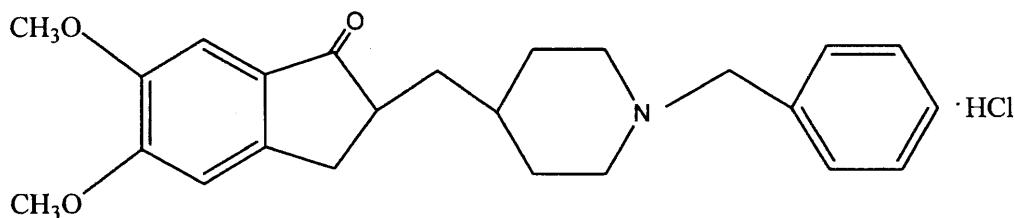
粉末X線回折パターンにおいて、2で表される下記回折角度にピークを有することを特徴とする、

【表1】

回折角度 ( $2\theta$ 、°)	強度 ( $I/I_0$ )
6.56	30
9.94	8
13.00	17
15.00	47
15.26	14
15.74	6
16.48	35
17.42	4
18.10	21
18.50	56
19.50	17
20.10	32
20.94	21
21.66	100
22.32	25
22.92	17
23.92	19
24.68	17
26.00	44
27.20	23
28.02	29
28.22	40
28.60	13

下記化学式で表される塩酸ドネペジルの多形結晶(III)。

## 【化1】



## 【請求項2】

臭化カリウム中の赤外吸収スペクトルにおいて、波数 559、641、648、702、749、765、786、807、851、872、927、949、966、975、982、1007、1034、1071、1080、1111、1119、1131、1177、1190、1205、1217、1230、1250、1265、1292、1313、1367、1389、1420、1438、1453、1461、1470、1500、1589、1605、1697、2407、2419、2461、2624、2641、2651、2667、2837、2848、2873、2924、2954、2961、2993、3007、3377、3433cm<sup>-1</sup>に吸収を有することを特徴とする塩酸ドネペジルの多形結晶(III)。

## 【請求項3】

ドネペジルをエタノールに溶解し、塩酸または塩化水素を加え、次いでジエチルエーテル、イソプロピルエーテル、n-ヘキサンまたはt-ブチルメチルエーテルから選ばれた溶媒1種を加えることを特徴とする塩酸ドネペジルの多形結晶(III)の製造法。

## 【請求項4】

溶媒がイソプロピルエーテルであり、結晶析出1時間以上後に濾取することを特徴とする請求項3記載の塩酸ドネペジルの多形結晶(III)の製造法。

## 【請求項5】

ドネペジルを酢酸エチルに溶解し、塩酸または塩化水素を加え、次いでt-ブチルメチルエーテルを加えることを特徴とする塩酸ドネペジルの多形結晶(III)の製造法。

## 【請求項6】

塩酸ドネペジルの多形結晶(I)または(II)を加熱することを特徴とする塩酸ドネペジルの多形結晶(III)の製造法。

## 【請求項7】

塩酸ドネペジルをエタノールに溶解し、t-ブチルメチルエーテルまたはアセトニトリルを加え、10℃以上で攪拌することを特徴とする塩酸ドネペジルの多形結晶(III)の製造法。

## 【請求項8】

塩酸ドネペジルの多形結晶(I)、(II)、(IV)、(V)または非晶質を溶媒中で攪拌し変換することを特徴とする塩酸ドネペジルの多形結晶(III)の製造法。

## 【請求項9】

溶媒がメタノール、エタノール、酢酸エチルまたはアセトンから選ばれた1種以上である、請求項8記載の塩酸ドネペジルの多形結晶(III)の製造法。

## 【請求項10】

塩酸ドネペジルの多形結晶(III)からなる医薬。

## 【請求項11】

塩酸ドネペジルの多形結晶(III)を有効成分とするアセチルコリンエステラーゼ阻害作用が有効な疾患の予防・治療・改善剤。

## 【請求項12】

塩酸ドネペジルの多形結晶(III)を有効成分とする老年性痴呆予防・治療・改善剤。

## 【請求項13】

塩酸ドネペジルの多形結晶(III)を有効成分とするアルツハイマー病予防・治療・改善剤。

## 【請求項14】

塩酸ドネペジルの多形結晶(III)を含有する医薬組成物。