

【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12月24日(2015.12.24)

【公表番号】特表2014-533297(P2014-533297A)

【公表日】平成26年12月11日(2014.12.11)

【年通号数】公開・登録公報2014-068

【出願番号】特願2014-541812(P2014-541812)

【国際特許分類】

C 0 7 D 277/56 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 277/56 C S P

A 6 1 K 31/426

A 6 1 P 19/06

【手続補正書】

【提出日】平成27年11月2日(2015.11.2)

【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】

フェブキシスタットの結晶形Kを調製するための改良された方法であって、

- a) エステル溶媒中にフェブキシスタットを溶解するステップと、
 - b) 溶媒を除去するステップと、
 - c) 炭化水素溶媒を添加するステップと、
 - d) フェブキシスタット結晶形Kを単離するステップと
- を含む方法。

【請求項2】

- a) 50～80℃でエステル溶媒中にフェブキシスタットを溶解するステップと、
 - b) 反応マスを濾過するステップと、
 - c) 濾液を同じ温度で30～120分間維持するステップと、
 - d) 溶媒を除去するステップと、
 - e) 炭化水素溶媒を添加するステップと、
 - f) フェブキシスタット結晶形Kを単離するステップと
- を含む、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

フェブキシスタットの結晶形Kを調製するための改良された方法であって、

- a) エステル溶媒中にフェブキシスタットを溶解するステップと、
 - b) 溶媒を部分的に除去するステップと、
 - c) 炭化水素溶媒を添加するステップと、
 - d) フェブキシスタット結晶形Kを単離するステップと
- を含む方法。

【請求項4】

(i) 前記エステル溶媒が酢酸エチルであり、および／または、

(ii) 前記炭化水素溶媒が、シクロヘキサンまたはトルエンから選択される、

請求項1から3のいずれか一項に記載の方法。

【請求項5】

フェブキソスタットの結晶形Kを調製するための改良された方法であって、

- a) エステル溶媒と炭化水素溶媒との混合物中にフェブキソスタットを溶解するステップと、
- b) 溶媒を部分的に除去するステップと、
- c) フェブキソスタット結晶形Kを単離するステップとを含む方法。

【請求項6】

(i) 前記エステル溶媒が、酢酸エチルであり、および／または、

(ii) 前記炭化水素溶媒が、シクロヘキサンまたはトルエンから選択される、請求項5に記載の方法。

【請求項7】

溶媒の混合物が、酢酸エチルとトルエンとの混合物である、請求項5に記載の方法。

【請求項8】

フェブキソスタットの結晶形Kを調製するための改良された方法であって、

- a) エステル溶媒中にフェブキソスタットを溶解するステップと、
- b) 攪拌薄膜乾燥機(ATFD)で溶媒を蒸発させるステップと、
- c) フェブキソスタット結晶形Kを単離するステップとを含む方法。

【請求項9】

フェブキソスタットの結晶形Kを調製するための改良された方法であって、

- a) 50～80℃でエステル溶媒中にフェブキソスタットを溶解するステップと、
- b) 溶媒を除去するステップと、
- c) フェブキソスタット結晶形Kを単離するステップとを含む方法。

【請求項10】

前記エステル溶媒が、酢酸エチルである、請求項8または9に記載の方法。

【請求項11】

フェブキソスタットの結晶形Kを調製するための改良された方法であって、

- a) 1つまたは複数の有機溶媒中にフェブキソスタットまたはフェブキソスタットのアルキルエステルを溶解するステップと、
- b) 反応混合物に塩基を添加するステップと、
- c) 溶媒を除去するステップと、
- d) 水を添加し、酸で中和するステップと、
- e) 1つまたは複数のエステル溶媒を添加するステップと、
- f) 前記エステル溶媒を除去するステップと、
- g) 任意選択で炭化水素溶媒を添加するステップと、
- h) フェブキソスタット結晶形Kを単離するステップとを含む方法。

【請求項12】

(i) 前記フェブキソスタットのアルキルエステルが、メチルエステルまたはエチルエステルから選択され、および／または、

(ii) 前記有機溶媒が、エタノール、メタノール、イソプロパノール、テトラヒドロフランまたはこれらの混合物から選択され、および／または、

(iii) 前記塩基が、アルカリ金属水酸化物またはアルカリ土類金属水酸化物から選択され、および／または、

(iv) 中和のために使用される前記酸が、酢酸、ギ酸、塩酸、硫酸またはリン酸から選択され、および／または、

(v) 前記エステル溶媒が、酢酸エチルであり、および／または、

(vi) 前記炭化水素溶媒が、シクロヘキサンまたはトルエンから選択される、請求項11に記載の方法。