

【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 25 年 2 月 7 日 (2013.2.7)

【公表番号】特表 2012-516308 (P2012-516308A)

【公表日】平成 24 年 7 月 19 日 (2012.7.19)

【年通号数】公開・登録公報 2012-028

【出願番号】特願 2011-546852 (P2011-546852)

【国際特許分類】

C 0 7 C 241/04 (2006.01)

C 0 7 C 243/32 (2006.01)

C 0 7 D 213/77 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 241/04

C 0 7 C 243/32

C 0 7 D 213/77

C 0 7 B 61/00 B

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 12 月 11 日 (2012.12.11)

【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

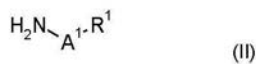
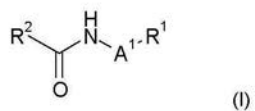
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記の式 I の放射性ヨウ素化合物又はその塩若しくは溶媒和物の合成方法であって、下記の式 I I の化合物を下記の式 I I I の化合物と反応させる段階を含んでなる方法。

【化 1】



式中、

A<sup>1</sup>は NH 又は O であり、

R<sup>1</sup>及び R<sup>2</sup>の一方は - L<sup>1</sup> - A r<sup>1</sup>基であり、

(式中、

L<sup>1</sup>は化学結合又は 1 ~ 3 の L<sup>\*</sup>リンカー単位 (式中、L<sup>\*</sup>は - CO - 、 - CR'<sub>2</sub> - 、 - CR'<sub>2</sub> - CR' - 、 - C - C - 、 - CR'<sub>2</sub>CO<sub>2</sub> - 、 - CO<sub>2</sub>CR'<sub>2</sub> - 、 - NR' - 、 - NR'C - 、 - CONR' - 、 - NR' - 、 - (C=O)NR' - 、 - NR'(C=S)NR' - 、

-  $\text{SO}_2\text{NR}'$  -、-  $\text{NR}'\text{SO}_2$  -、-  $\text{CR}'_2\text{OCR}'_2$  -、-  $\text{CR}'_2\text{SCR}'_2$  -、-  $\text{CR}'_2\text{NR}'\text{CR}'_2$  -、 $\text{C}_{5-12}$ アリーレン基及び $\text{C}_{3-12}$ ヘテロアリーレン基から選択され、 $\text{R}'$ は水素又は $\text{C}_{1-3}$ アルキルである。)を含む二価リンカーであり、

$\text{Ar}^1$ は、放射性ヨウ素で置換され、かつ $\text{C}_{1-3}$ アルキル、ハロ、アミノ、カルボキシル、ヒドロキシル及びこれらの保護バージョンから選択される0～3の他の置換基で置換された六員の $\text{C}_{3-6}$ アリアル基であり、前記アリアル基はN、S及びOから選択される0～3のヘテロ原子を有する。)

$\text{R}^1$ 及び $\text{R}^2$ の他方は-  $\text{L}^2$  -  $\text{R}^*$ 基であり、

(式中、

$\text{L}^2$ は化学結合又は1～6の $\text{L}^*$ リンカー単位(式中、 $\text{L}^*$ は $\text{L}^1$ に関して定義した通りである。))を含む二価リンカーであり、

$\text{R}^*$ は生体分子である。)

$\text{R}^1$ 及び $\text{R}^2$ は任意には適当な保護基を含み、

Xは活性エステル基を表す。

【請求項2】

$\text{A}^1$ がNHである、請求項1記載の方法。

【請求項3】

$\text{A}^1$ がOである、請求項1記載の方法。

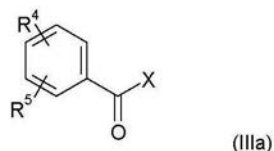
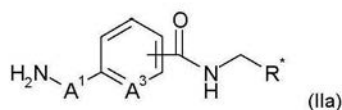
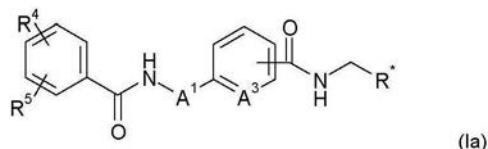
【請求項4】

$\text{R}^1$ が-  $\text{L}^2$  -  $\text{R}^*$ 基であり、 $\text{R}^2$ が-  $\text{L}^1$  -  $\text{Ar}^1$ 基である、請求項1乃至請求項3のいずれか1項記載の方法。

【請求項5】

式Iの化合物が下記の式Iaの化合物であり、式IIの化合物が下記の式IIaの化合物であり、式IIIの化合物が下記の式IIIaの化合物である、請求項1記載の方法。

【化2】



式中、 $\text{A}^3$ はN又はCHであり、 $\text{R}^*$ は請求項1で定義した通りであり、 $\text{R}^4$ 及び $\text{R}^5$ の一方は放射性ヨウ素であり、 $\text{R}^4$ 及び $\text{R}^5$ の他方は水素又はヒドロキシルであり、Xは請求項1で定義した通りである。

【請求項6】

$\text{A}^1$ がNHである、請求項5記載の方法。

【請求項7】

$\text{A}^1$ がOである、請求項5記載の方法。

【請求項8】

$\text{A}^3$ がCHである、請求項5乃至請求項7のいずれか1項記載の方法。

【請求項9】

当該方法が自動化されている、請求項 1 乃至請求項 8 のいずれか 1 項記載の方法。

【請求項 10】

請求項 1 乃至請求項 8 のいずれか 1 項記載の方法で定義した式 I の放射性ヨウ素化合物を、哺乳動物への投与に適した形態の生体適合性キャリアーと共に含んでなる放射性医薬組成物。

【請求項 11】

請求項 1 乃至請求項 9 のいずれか 1 項記載の方法を実施するためのキットであって、

( i ) 請求項 1 記載の方法で定義した式 I I の化合物又は請求項 5 記載の方法で定義した式 I I a の化合物を含む第 1 の容器、及び

( i i ) 請求項 1 記載の方法で定義した式 I I I の化合物又は請求項 5 記載の方法で定義した式 I I I a の化合物を含む第 2 の容器  
を含んでなるキット。

【請求項 12】

請求項 9 記載の方法を実施するためのカセットであって、請求項 11 記載のキットに関して定義した第 1 及び第 2 の容器を含んでなるカセット。