

【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5月2日(2013.5.2)

【公表番号】特表2012-522051(P2012-522051A)

【公表日】平成24年9月20日(2012.9.20)

【年通号数】公開・登録公報2012-038

【出願番号】特願2012-503472(P2012-503472)

【国際特許分類】

C 07 C 319/20 (2006.01)

C 07 C 323/32 (2006.01)

C 07 H 19/073 (2006.01)

A 61 K 51/00 (2006.01)

C 07 B 59/00 (2006.01)

C 07 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 07 C 319/20

C 07 C 323/32

C 07 H 19/073

A 61 K 49/02 C

C 07 B 59/00

C 07 B 61/00 300

【手続補正書】

【提出日】平成25年3月13日(2013.3.13)

【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】

次の式(I)の化合物の製造方法であって、

Y - (C₁₋₈アルキル) - ¹⁸F (I)

(式中、Yは生物学的ターゲティング部分である。)

適当な溶媒中において塩基及び遷移金属触媒の存在下で、次の式(II)の化合物を次の式(III)の化合物と反応させることを含んでなる方法。

Y - B (Z)₂ (II)

(式中、Yは式(I)の化合物に関して定義した通りであり、Bはホウ素であり、Zはヒドロキシ、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルキル、C₅₋₁₂アリールオキシ及びC₅₋₁₂アリールから選択されるものであって、各Zは任意にはヒドロキシ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ及びハロから選択される1~4の置換基で置換されていてもよく、或いは2つのZはそれらに結合したBと共に有機ホウ素環状部分を形成する。)

X - (C₁₋₈アルキル) - ¹⁸F (III)

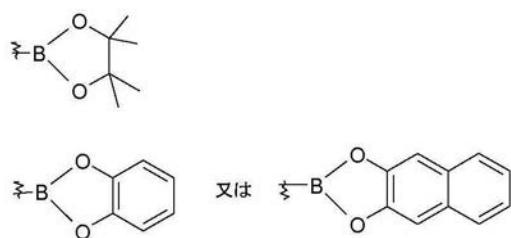
(式中、Xはクロロ、ブロモ、ヨード、C₁₋₆アルキルスルホネート、ハロC₁₋₆アルキルスルホネート又はアリールスルホネートであり、C₁₋₈アルキル基は式(I)の化合物に関して定義した通りである。)

【請求項2】

式(II)の化合物において、Zがヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、メチル及びエチレンから選択されるものであるか、或いは-B (Z)₂基が9-ボラビシクロ[3.3.

1] ノニル及び次式の基のいずれかである、請求項 1 記載の方法。

【化 1】



(式中、アリール環は任意にはヒドロキシ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ及びハロから選択される1~4の置換基で置換されていてもよい。)

【請求項 3】

式(I II)の化合物において、Xがプロモ又はヨードである、請求項1又は請求項2記載の方法。

【請求項 4】

式(I II)の化合物が¹⁸F - C H₂B r、¹⁸F - C H₂C H₂B r及び¹⁸F - C H₂C H₂B rから選択される、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】

請求項1に記載されたP E T用の式(I)の化合物を製造するための放射性医薬品キットであって、

(i) 請求項1又は請求項2に記載された式(I I)の化合物を含む容器、並びに

(ii) 次の式(I V)の化合物及び前記式(I V)の化合物を¹⁸F供給源と接触させる手段を含む容器

を含んでなる放射性医薬品キット。



(式中、Xはクロロ、プロモ、ヨード、C₁₋₆アルキルスルホネート、ハロC₁₋₆アルキルスルホネート又はアリールスルホネートであり、C₁₋₈アルキル基は式(I)の化合物に関する定義した通りであり、Lはクロロ、プロモ、ヨード、C₁₋₆アルキルスルホネート、ハロC₁₋₆アルキルスルホネート及びアリールスルホネートから選択される脱離基である。)

【請求項 6】

式(I II)の化合物において、Xがプロモである、請求項1又は請求項2記載の方法。

。

【請求項 7】

前記溶媒が、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ジクロロメタン、クロロホルム、アセトニトリル、トルエン、テトラヒドロフラン、イソプロパノール、tert-アミルアルコール、ジエチルエーテル又はテトラヒドロフランである、請求項1又は請求項2記載の方法。

【請求項 8】

前記遷移金属触媒がパラジウム又はニッケル触媒である、請求項1又は請求項2記載の方法。

【請求項 9】

前記遷移金属触媒がニッケル触媒である、請求項1又は請求項2記載の方法。

【請求項 10】

前記ニッケル触媒がニッケル/アミノアルコール誘導体、Ni I₂/トランス-2-アミノシクロヘキサノール又はNi C₁₂・グラインム/ブロリノール、或いは微粉又はニッケル反応器の形態のニッケル金属である、請求項9記載の方法。

【請求項 11】

前記遷移金属触媒がパラジウム触媒である、請求項1又は請求項2記載の方法。

【請求項 1 2】

前記パラジウム触媒が P d (P P H₃)₂ C l₂、 P d (P P H₃)₄、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(P d₂(d b a)₃)、P d₂(d b a)₃/P(シクロヘキシル)₃、P d₂(d b a)₃/I P r H C l (式中、 I P r = 1 , 3 - ビス(2 , 6 -ジイソプロピルフェニル)イミダゾール - 2 - イリデン)、[1 , 1 ' - ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(I I)(P d (d p p f) C l₂)、P d (O A c)₂/P(t - B u)₂ M e 又は P d (O A c)₂/P(シクロヘキシル)₃である、請求項 1 1 記載の方法。