

【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 0 7 C 319/20 (2006.01)

C 0 7 C 323/32 (2006.01)

C 0 7 H 19/073 (2006.01)

A 6 1 K 51/00 (2006.01)

C 0 7 B 59/00 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 319/20

C 0 7 C 323/32

C 0 7 H 19/073

A 6 1 K 49/02 C

C 0 7 B 59/00

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【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

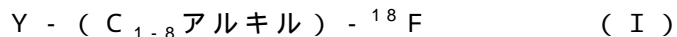
【補正方法】変更

【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、

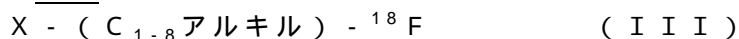


(式中、Y は生物学的ターゲティング部分である。)

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。



(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、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル、 C_{5-12} アリールオキシ及び C_{5-12} 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、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} 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。)



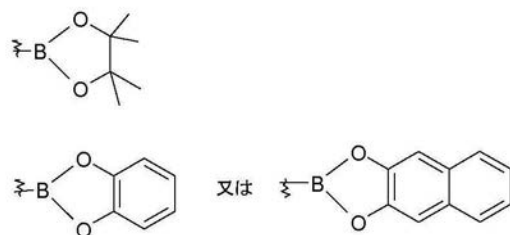
(式中、X はクロロ、ブロモ、ヨード、 C_{1-6} アルキルスルホネート、ハロ C_{1-6} アルキルスルホネート又はアリールスルホネートであり、 C_{1-8} アルキル基は式 (I) の化合物に関して定義した通りである。)

【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、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} 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(III)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(III)の化合物が $^{18}F-CH_2Br$ 、 $^{18}F-CH_2CH_2Br$ 及び $^{18}F-CH_2CH_2CH_2Br$ 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PET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(II)の化合物を含む容器、並びに

(ii) 次の式(IV)の化合物及び前記式(IV)の化合物を ^{18}F 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、 C_{1-6} アルキルスルホネート、ハロ C_{1-6} 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、 C_{1-8} アルキル基は式(I)の化合物に関して定義した通りであり、Lはクロロ、プロモ、ヨード、 C_{1-6} アルキルスルホネート、ハロ C_{1-6} 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(III)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、 NiI_2 /トランス-2-アミノシクロヘキサノール又は $NiCl_2 \cdot$ グライム/プロリノール、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 12】

前記パラジウム触媒が $\text{Pd}(\text{PPH}_3)_2\text{Cl}_2$ 、 $\text{Pd}(\text{PPH}_3)_4$ 、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム($\text{Pd}_2(\text{dba})_3$)、 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3/\text{P}(\text{シクロヘキシル})_3$ 、 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3/\text{IPrHCl}$ (式中、 $\text{IPr} = 1,3\text{-ビス}(2,6\text{-ジイソプロピルフェニル})\text{イミダゾール}-2\text{-イリデン}$)、 $[1,1'\text{-ビス}(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]$ ジクロロパラジウム(II)($\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$)、 $\text{Pd}(\text{OAc})_2/\text{P}(\text{t-Bu})_2\text{Me}$ 又は $\text{Pd}(\text{OAc})_2/\text{P}(\text{シクロヘキシル})_3$ である、請求項11記載の方法。