

【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10月17日 (2013.10.17)

【公表番号】特表2013-507345(P2013-507345A)

【公表日】平成25年3月4日 (2013.3.4)

【年通号数】公開・登録公報2013-011

【出願番号】特願2012-532624(P2012-532624)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 49/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 5 2

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 K 49/00 A

A 6 1 K 31/551

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/04

【手続補正書】

【提出日】平成25年8月30日 (2013.8.30)

【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

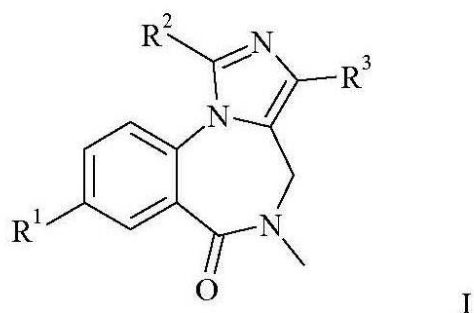
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次の式 I の放射性フッ素化合物。

【化 1】



(式中、

R¹及びR²の一方はC₁₋₄[¹⁸F]フルオロアルキル又はC₁₋₄[¹⁸F]フルオロアルコキシであって、他方は水素であり、

R^3 は $C(=O)-O-R^4$ (式中、 R^4 は水素又は直鎖若しくは枝分れ C_{1-4} アルキルであるか、或いは R^4 は C_{3-5} 複素環である。)である。)

【請求項2】

R^1 及び R^2 の一方が $C_{1-4}[^{18}F]$ フルオロアルコキシである、請求項1記載の放射性フッ素化合物。

【請求項3】

R^3 が $C(=O)-O-R^4$ (式中、 R^4 は直鎖 C_{1-4} アルキルである。)である、請求項1又は請求項2記載の放射性フッ素化合物。

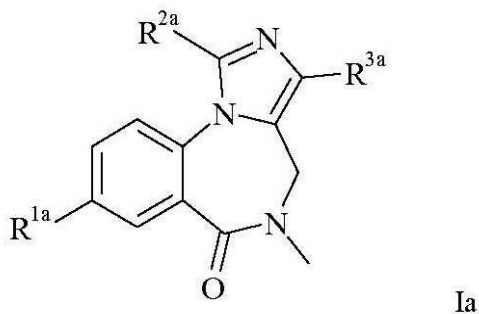
【請求項4】

R^3 が $C(=O)-O-R^4$ (式中、 R^4 は枝分れ C_{1-4} アルキルである。)である、請求項1又は請求項2記載の放射性フッ素化合物。

【請求項5】

請求項1乃至請求項4のいずれか1項記載の放射性フッ素化合物の合成方法であって、次の式I aの前駆体化合物を適当な ^{18}F 供給源と反応させる段階を含んでなる方法。

【化2】



(式中、
 R^{1a} 及び R^{2a} の一方は前駆体基であって、他方はHであり、 R^{1a} が前駆体基である場合にそれは C_{1-4} アルキル-LG、 C_{1-4} アルコシル-LG及びヒドロキシルから選択され、 R^{2a} が前駆体基である場合にそれは C_{1-4} アルキル-LG及び C_{1-4} アルコシル-LGから選択され、LGはプロミド、メシレート及びトシレートから選択される脱離基であり、 R^{3a} は請求項1、請求項3又は請求項4で R^3 に関して定義した通りである。)

【請求項6】

R^{1a} が前記前駆体基である、請求項5記載の方法。

【請求項7】

当該方法が自動化される、請求項5又は請求項6記載の方法。

【請求項8】

請求項7記載の方法を実施するためのカセットであって、

(i) 請求項5又は請求項6記載の方法で定義された式I aの前駆体化合物を含む容器、及び

(ii) 適当な ^{18}F 供給源を用いて容器を溶出するための手段を含んでなるカセット。

【請求項9】

請求項1乃至請求項4のいずれか1項記載の放射性フッ素化合物を、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10】

PETイメージング方法で使用するための、請求項1乃至請求項4のいずれか1項記載の放射性フッ素化合物。

【請求項11】

被験体の中枢神経系(CNS)におけるGABA_A受容体の分布を決定するための陽電子放出断層撮影(PET)イメージング方法であって、

(i) 請求項 1 乃至請求項 4 のいずれか 1 項記載の放射性フッ素化合物を前記被験体に投与する段階、

(i i) 段階 (i) で投与した前記放射性フッ素化合物を前記被験体の C N S 内の G A B A_A 受容体に結合させる段階、

(i i i) 段階 (i i) で結合させた前記放射性フッ素化合物中に存在する ¹⁸F の陽電子放出崩壊から導かれる信号を検出する段階、並びに

(i v) 前記信号の位置及び量の画像を形成する段階であって、前記信号が前記被験体における G A B A_A 受容体の分布を表す段階を含んでなる P E T 方法。

【請求項 1 2】

前記放射性フッ素化合物が請求項 9 記載の放射性医薬組成物として投与される、請求項 1 1 記載の P E T 方法。

【請求項 1 3】

前記被験体に関する治療計画の進行中に繰り返して実施される請求項 1 1 又は請求項 1 2 記載の P E T 方法であって、前記治療計画が G A B A_A 状態と戦うための薬物の投与を含む P E T 方法。

【請求項 1 4】

請求項 1 1 記載の P E T 方法を、G A B A_A 発現の分布を特定の臨床像に帰因させる追加段階 (v) と共に含んでなる診断方法。

【請求項 1 5】

請求項 1 3 記載の P E T 方法又は請求項 1 4 記載の診断方法で使用するための、請求項 1 乃至請求項 4 のいずれか 1 項記載の放射性フッ素化合物。