

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2007 年 11 月 22 日 (22.11.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/132689 A1

- (51) 国際特許分類:
C07C 227/18 (2006.01) C07C 229/48 (2006.01)
C07C 227/20 (2006.01) C07B 59/00 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2007/059459
- (22) 国際出願日: 2007 年 5 月 7 日 (07.05.2007)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2006-132089 2006 年 5 月 11 日 (11.05.2006) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本メジフィジックス株式会社 (NIHON MEDI-PHYSICS CO., LTD.) [JP/JP]; 〒6620918 兵庫県西宮市六湛寺町 9 番 8 号 Hyogo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 林 明希男 (HAYASHI, Akio) [JP/JP]; 〒2990266 千葉県袖ヶ浦市北袖 3-1 日本メジフィジックス株式会社内 Chiba (JP). 黒崎 文枝 (KUROSAKI, Fumie) [JP/JP]; 〒2990266 千葉県袖ヶ浦市北袖 3-1 日本メジフィジックス株式会社内 Chiba (JP). 外山 正人 (TOYAMA, Masahito) [JP/JP]; 〒2990266 千葉県袖ヶ浦市北袖 3-1 日本メジフィジックス株式会社内 Chiba (JP).

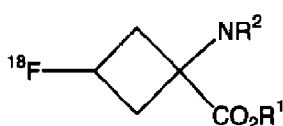
新村 俊幸 (SHINMURA, Toshiyuki) [JP/JP]; 〒2990266 千葉県袖ヶ浦市北袖 3-1 日本メジフィジックス株式会社内 Chiba (JP). 金子 恵美 (KANEKO, Emi) [JP/JP]; 〒2990266 千葉県袖ヶ浦市北袖 3-1 日本メジフィジックス株式会社内 Chiba (JP).

- (74) 代理人: 井出正威, 外 (IDE, Masatake et al.); 〒1020076 東京都千代田区五番町 3-1 五番町グラントビル 9 階井出国際特許事務所 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,

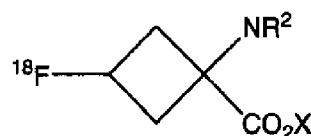
[続葉有]

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCTION OF RADIOACTIVE FLUORINE-LABELED ORGANIC COMPOUND

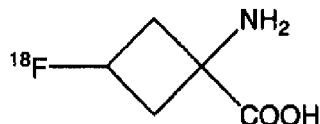
(54) 発明の名称: 放射性フッ素標識有機化合物の製造方法



(1)



(2)



(3)

(57) Abstract: [PROBLEMS] To provide a process for production of [^{18}F]FACBC, which can reduce the amount of an impurity produced during the process. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] A process for production of a radioactive fluorine-labeled organic compound, comprising the following steps: a deesterification step for retaining a compound represented by the formula (1) in a reverse-phase column, charging an alkaline solution into the column to deesterify the compound, and then discharging the alkaline solution from the column to produce a compound represented by the formula (2); and a deprotection step for deprotecting an amino-protecting group in the compound produced in the deesterification step to produce a compound represented by the formula (3). (1) [wherein R¹ represents a linear or branched alkyl chain having 1 to 10 carbon atoms or an aromatic substituent; and R² represents a protecting group.] (2) [wherein X represents sodium or potassium.] (3)

[続葉有]



IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, 添付公開書類:
 TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, — 国際調査報告書
 ML, MR, NE, SN, TD, TG).

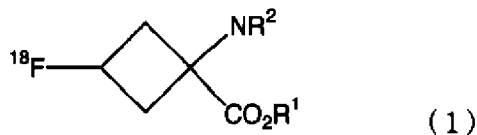
[続葉有]

(57) 要約:

【課題】 $[^{18}\text{F}]$ FACBCの製造において、生成する不純物の量を減ずることができる製造方法を提供する。

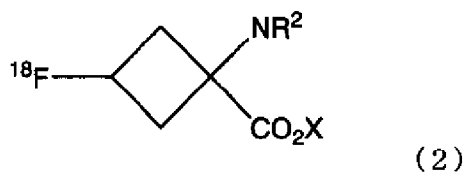
【解決手段】下記式(1):

【化8】



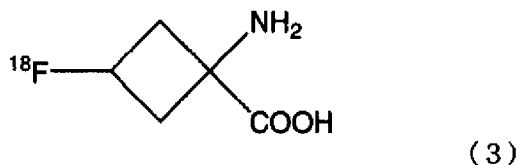
(式中、 R^1 は、直鎖若しくは分岐鎖の炭素数1～10のアルキル鎖又は芳香族置換基、 R^2 は、保護基である)で表される化合物を逆相カラムに保持して該カラムにアルカリ溶液を充填して前記化合物を脱エステル化し、次いで該カラムから該アルカリ溶液を排出することにより下記式(2):

【化9】



(式中、Xはナトリウム又はカリウムである)で表される化合物を得る脱エステル化工程と、脱エステル化工程にて得られた前記化合物につきアミノ保護基の脱保護を行って下記式(3):

【化10】



で表される化合物を得る脱保護工程と、を含むことを特徴とする、放射性フッ素標識有機化合物の製造方法。



2文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。