



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2230229 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07C 269/06 (2006.01)
C07B 59/00 (2006.01)
C07B 61/00 (2006.01)
C07C 271/24 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

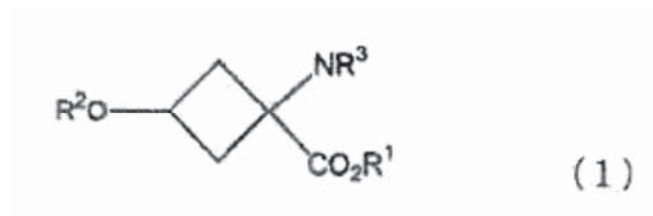
(21)	Translation Published	2017.03.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.10.12
(86)	European Application Nr.	08863261.7
(86)	European Filing Date	2008.12.16
(87)	The European Application's Publication Date	2010.09.22
(30)	Priority	2007.12.19, JP, 2007327444
(84)	Designated Contracting States:	AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MT NL NO PL PT RO SE SI SK TR
(73)	Proprietor	Nihon Medi-Physics Co., Ltd., 3-4-10 Shinsuna Koto-ku, Tokyo 136-0075, JP-Japan
(72)	Inventor	KUROSAKI, Fumie, c/o NIHON MEDI-PHYSICS CO. LTD.3-1 Kitasode, Sodegaura-shiChiba 299-0266, JP-Japan TOYAMA, Masahito, c/o NIHON MEDI-PHYSICS CO. LTD.3-1 Kitasode, Sodegaura-shiChiba 299-0266, JP-Japan HAYASHI, Akio, c/o NIHON MEDI-PHYSICS CO. LTD.3-1 Kitasode, Sodegaura-shiChiba 299-0266, JP-Japan
(74)	Agent or Attorney	Oslo Patentkontor AS, Postboks 7007 Majorstua, 0306 OSLO, Norge

(54)	Title	PROCESS FOR PRODUCTION OF RADIOACTIVE-FLUORINE-LABELED ORGANIC COMPOUND
(56)	References Cited:	WO-A1-2007/063940 WO-A1-2007/132689 JP-A- 11 295 494 JP-T- 2004 529 989 US-A1- 2006 292 073 SHOUP T M ET AL: "Synthesis of $\text{ÅF-18Ü-1-amino-3-fluorocyclobutane-1-carbo xylic acid}$ (FACBC): a PET tracer for tumor delineation" JOURNAL OF LABELLED COMPOUNDS AND RADIOPHARMACEUTICALS, JOHN WILEY, CHICHESTER, GB LNKD-DOI:10.1002/(SICI)1099-1344(199903)42:3<21 5::AID-JLCR180>3.0.CO;2-0, vol. 42, no. 3, 1 January 1999 (1999-01-01), pages 215-225, XP003003890 ISSN: 0362-4803 THE JOURNAL OF NUCLEAR MEDICINE vol. 40, no. 2, 1999, pages 331 - 338 APPLIED RADIATION AND ISOTOPES vol. 58, no. 6, 2003, pages 657 - 666

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

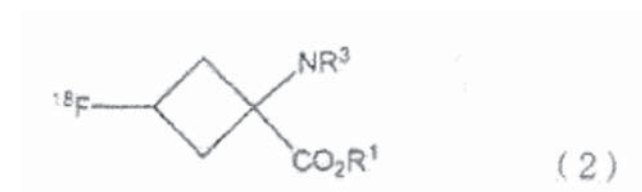
Patentkrav

1. Fremgangsmåte for fremstilling av en radioaktiv fluor-merket organisk forbindelse, hvilken omfatter å underkaste en forbindelse representert ved den følgende formel (1):



5

(hvor R^1 er en rett eller forgrenet alkylkjede med 1-10 karbonatomer eller en aromatisk substituent, R^2 er en rett eller forgrenet haloalkyl-sulfonsyre-substituent med 1-10 karbonatomer, en rett eller forgrenet alkylsulfonsyre-substituent med 1-10 karbonatomer, en fluorsulfonsyre-substituent eller en aromatisk sulfonsyre-substituent, og R^3 er en beskyttende gruppe), til et oppvarmingstrinn i et inert organisk oppløsningsmiddel ved nærvær av en faseoverføringskatalysator, ^{18}F -ioner og kaliumioner, for å danne en forbindelse representert ved den følgende formel (2):



hvor R^1 er en rett eller forgrenet alkylkjede med 1-10 karbonatomer eller en aromatisk substituent, og R^3 er en beskyttende gruppe, hvor oppvarmingstrinnet utføres ved en oppvarmingstemperatur på 40-90°C, faseoverføringskatalysatoren blir inneholdt i det inerte organiske oppløsningsmiddelet ved en konsentrasjon på ikke mindre enn 70 mmol/l, kaliumioner er inkludert i det inerte organiske oppløsningsmiddelet ved en konsentrasjon på ikke mindre enn 27 mmol/l, og faseoverføringskatalysatoren anvendes i et molart forhold på ikke mindre enn 0,7 i forhold til forbindelsen representert ved formel (1).

2. Fremstillingsfremgangsmåte ifølge krav 1, hvor forbindelsen representert ved formelen (1) er inneholdt i et inert organisk oppløsningsmiddel ved en konsentrasjon på ikke mindre enn 50 mmol/l.

25

3. Fremstillingsfremgangsmåte ifølge ethvert av kravene 1 eller 2, hvilken omfatter:

et trinn for å danne en blanding av en faseoverføringskatalysator, ^{18}F -ioner og kaliumioner; og

- 5 et radioaktivt fluorineringsstrinn med tilsetning av en forbindelse av nevnte formel (1) og et inert organisk oppløsningsmiddel til den ovennevnte blandingen, og å holde den resulterende reaksjonsoppløsningen ved en temperatur på 40-90°C under omrøring for å danne en forbindelse representert ved nevnte formel (2).