



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2758368 B1

NORWAY

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

Norwegian Industrial Property Office

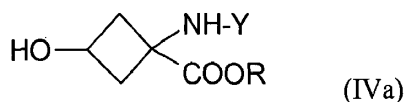
(21)	Translation Published	2015.11.23
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.08.12
(86)	European Application Nr.	12729461.9
(86)	European Filing Date	2012.06.13
(87)	The European Application's Publication Date	2014.07.30
(30)	Priority	2011.06.14, US, 201161496592 P
(84)	Designated Contracting States:	AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO RS SE SI SK SM TR
(73)	Proprietor	GE Healthcare Limited, Amersham Place, Little ChalfontBuckinghamshire HP7 9NA, GB-Storbritannia
(72)	Inventor	BERG, Tom, Christian, GE Healthcare ASPO Box 4220 NydalenNycoveien 1-2, 0401 OsloNorge
(74)	Agent or Attorney	Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	Preparation of pet precursor
(56)	References Cited:	EP-A1- 1 978 015 SHOUP T M ET AL: "Synthesis of $\text{ÄF-18Ü-1-amino-3-fluorocyclobutane-1-carbo xylic acid}$ (FACBC): a PET tracer for tumor delineation", JOURNAL OF LABELLED COMPOUNDS AND RADIOPHARMACEUTICALS, JOHN WILEY, CHICHESTER, GB, vol. 42, no. 3, 1 January 1999 (1999-01-01), pages 215-225, XP003003890, ISSN: 0362-4803, DOI: 10.1002/(SICI)1099- 1344(199903)42:3<215::A ID-JLCR180>3.0.CO;2-0

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/>

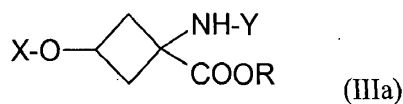
P A T E N T K R A V

1. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse med formel (IVa):



5

fra en forbindelse med formel (IIIa)



10

hvor:

R betegner en alkylgruppe med 1 til 5 karbonatomer;

Y betegner en beskyttelsesgruppe for en amin;

X betegner en beskyttelsesgruppe for en alkohol;

- 15 hvor et reaksjonsmedium som omfatter en forbindelse med formel (IIIa) gjennomgår en katalytisk hydrogenolyse av X med formel (IIIa) ved anvendelse av en ikke-gassformig hydrogenkilde.

- 20 2. Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor R er en etylgruppe, Y er BOC og X er benzyl.

3. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 eller 2, hvor reaksjonsmediet ytterligere omfatter en hydrogenkilde og katalysatoren.

- 25 4. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor den ikke-gassformige hydrogenkilde er valgt fra gruppen cykloheksen, 1,4-dicykloheksadien, ammoniumformiat (HCOONH_4), maursyre, trietylsilan (Et_3SiH) eller en blanding av

trietylsilan og trietylamin ($\text{Et}_3\text{SiH}/\text{Et}_3\text{N}$).

5. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor den ikke-gassformige hydrogenkilde er 1,4-dicykloheksadien eller trietylsilan.

5

6. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvor katalysatoren er valgt fra gruppen bestående av ruthenium, rhodium, palladium, osmium, iridium og platina.

10

7. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvor katalysatoren er palladium.

8. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor katalysatoren er palladium-på-karbon med en palladium-lasting på 1-10%.

15

9. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvor reaksjonsmediet ytterligere omfatter et løsningsmiddel valgt fra gruppen av alkoholer, estere, etere og klorerte løsningsmidler.

20

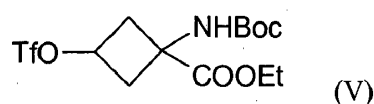
10. Fremgangsmåte ifølge krav 9, hvor løsningsmidlet er etanol.

11. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, hvor reaksjonsblandingen omrøres effektivt under hydrogenolysen.

25

12. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 11, hvor reaksjonsproduktet av hydrogenkilden avdampes etter at prosessen er fullført.

13. Fremgangsmåte for fremstilling av forløperforbindelsen til ^{18}F -FACBC med formel (V):



30

hvor TfO betegner trifluormetansulfonat, som omfatter et trinn med fremstilling av forbindelsen med formel (IVa) ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 12.

35