



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3917626 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61P 35/00 (2006.01)

A61K 51/04 (2006.01)

A61K 51/10 (2006.01)

C07B 59/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.10.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.05.31
(86)	European Application Nr.	20702636.0
(86)	European Filing Date	2020.01.30
(87)	The European Application's Publication Date	2021.12.08
(30)	Priority	2019.01.30, EP, 19154500
(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	Technische Universität München, Arcisstr. 21, 80333 München, Tyskland Technische Universität München - Klinikum Rechts der Isar, Ismaningerstrasse 22, 81675 München, Tyskland
(72)	Inventor	WURZER, Alexander Josef, Josephsburgstraße 55a, 81673 München, Tyskland WESTER, Hans-Jürgen, Dinkelweg 4, 85304 Dinkelweg, Tyskland EIBER, Matthias Johannes, Alte Poststraße 142, 85591 Vaterstetten, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **PSMA BINDING DUAL MODE RADIOTRACER AND THERAPEUTIC**

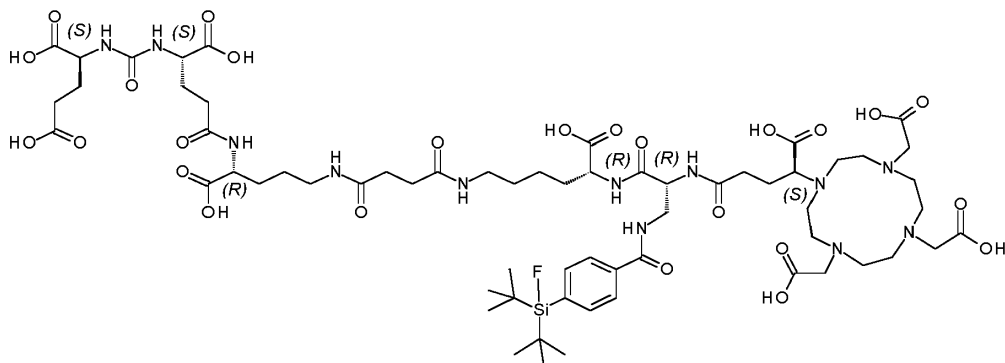
(56) References
Cited:

WO-A1-2019/020831

S. LITAU ET AL: "Next Generation of SiFA lin -Based TATE Derivatives for PET Imaging of SSTR-Positive Tumors: Influence of Molecular Design on In Vitro SSTR Binding and In Vivo Pharmacokinetics", BIOCONJUGATE CHEMISTRY, vol. 26, no. 12, 16 December 2015 (2015-12-16), pages 2350-2359, XP055452403, US ISSN: 1043-1802, DOI: 10.1021/acs.bioconjchem.5b00510

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/>

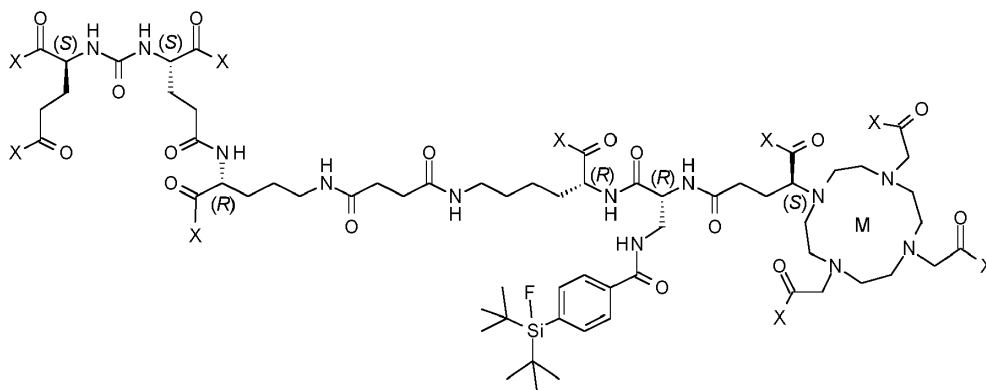
1. Forbindelsen ifølge formel (V):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, som inneholder enten et chelatert radioaktivt

5 kation eller hvori F eventuelt er ^{18}F .

2. Forbindelsen ifølge krav 1 ifølge formel (Va):



(Va)

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori;

10 hver X er uafhængig OH eller O⁻;

M er et chelateret radioaktivt kation eller er fraværende;

og F er eventuelt ^{18}F .

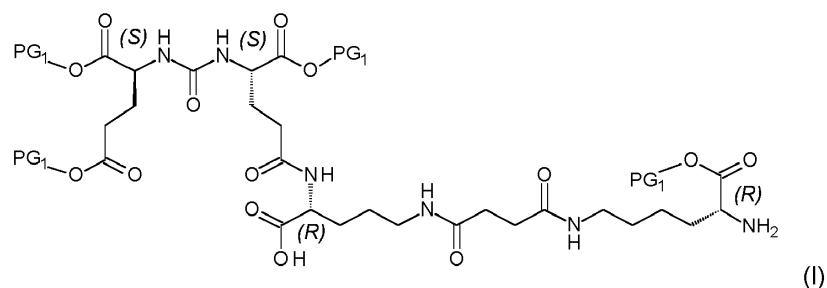
3. Forbindelsen ifølge krav 1 eller krav 2, hvori det chelaterte radioaktive kationet velges
15 fra kationene av Sc, Cu, Ga, Y, In, Tb, Ho, Lu, Re, Pb, Bi, Ac, Er og Th.

4. Forbindelsen ifølge krav 3, hvori det chelaterede radioaktive kationet er Ga.

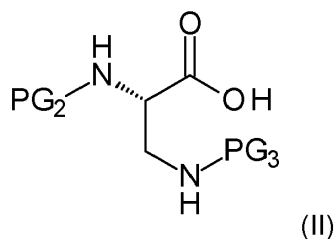
5. Forbindelsen ifølge krav 3, hvori det chelaterede radioaktive kationet er Lu-177, Y-90 eller Ac-225.

6. Fremgangsmåte for fremstilling av forbindelsen ifølge krav 1, omfattende trinnene:

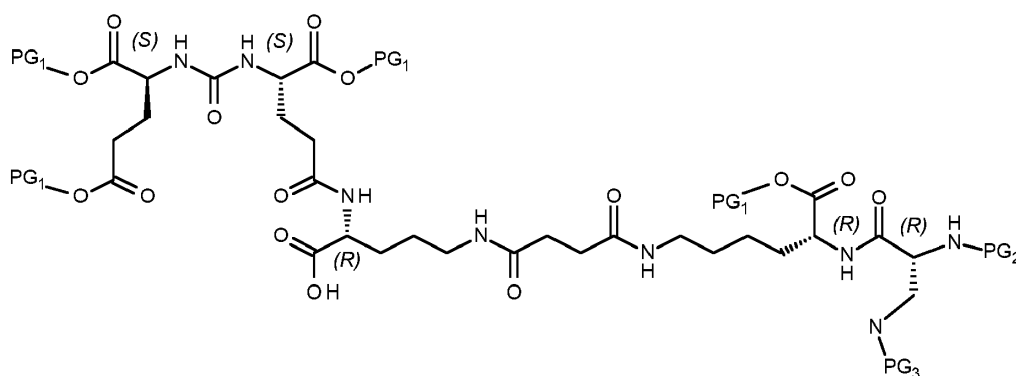
a) å reagere en forbindelse av formel (I):



5 med en forbindelse av formel (II):



for å danne en forbindelse av formel (III):

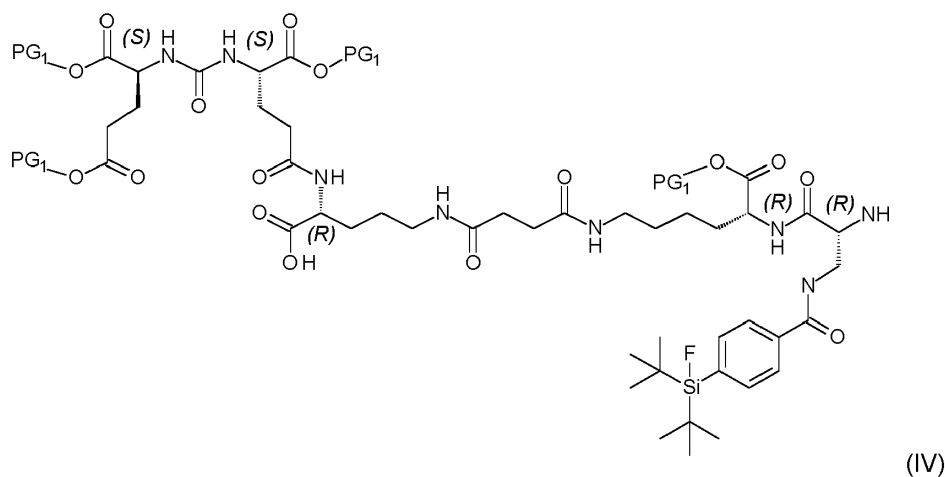


(III)

hvor PG₁ er tBu, PG₂ er Fmoc og PG₃ er Dde;

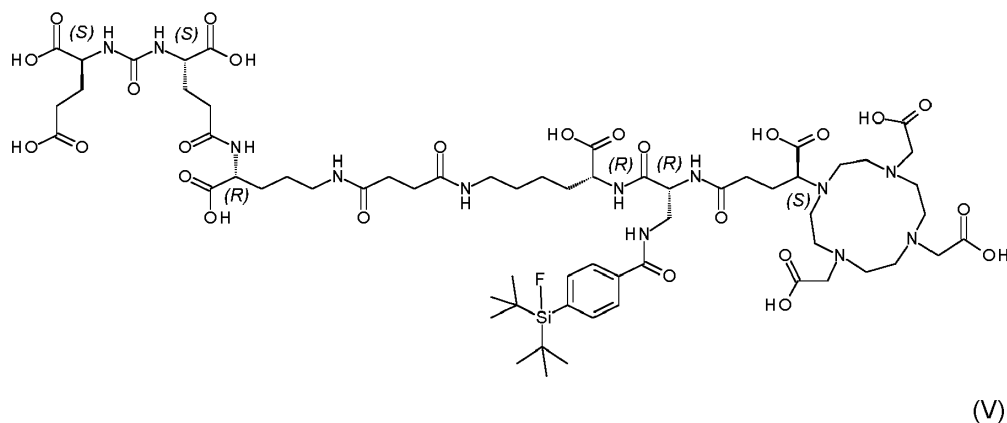
10 og reaksjonsbetingelsene involverer anvendelsen av en base, hvor basen er 2,4,6-kollidin eller 2,6-dimetylpyridin;

b) å reagere forbindelsen av formel (III) under forhold egnet for å danne en forbindelse av formel (IV):



og

c) å reagere forbindelsen av formel (IV) under forhold egnet for å danne forbindelse (V):

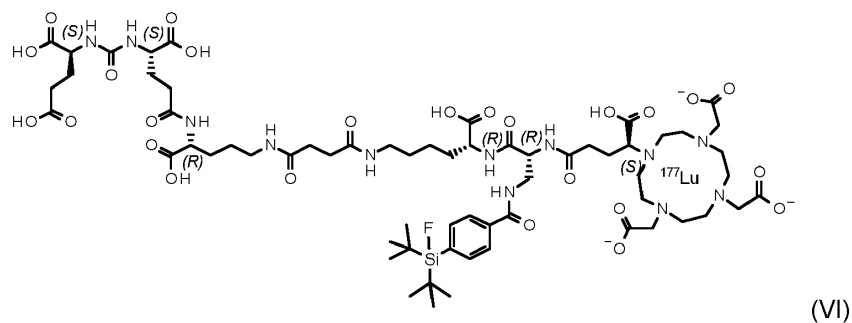


5

7. Fremgangsmåten ifølge krav 6, hvori forbindelse (II) preaktiveres ved reaksjon med 2-(1H-benzotriazol-1-yl)-1,1,3,3-tetrametylaluminiumtetrafluorborat (TBTU), 1-hydroksy-7-azabenzotriazol (HOAt) og 2,4,6-kollidin før reaksjon med forbindelse (I).

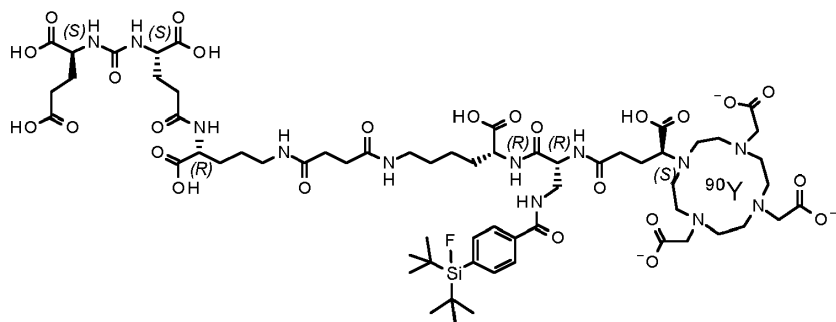
10 8. Fremgangsmåten ifølge krav 7, hvori preaktiveringen finner sted i 5 minutter eller mindre.

9. Forbindelsen ifølge krav 1 eller krav 2 av formel (VI)



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10. Forbindelsen ifølge krav 1 eller krav 2 av formel (VII)



(VII)

- 5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

11. Farmasøytisk eller diagnostisk sammensetning omfattende forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, 9, 10.

- 10 12. Forbindelse eller sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, 9–11 for anvendelse som et kreftdiagnostisk eller bildedannende middel.

13. Forbindelse eller sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, 9–11 for anvendelse i behandlingen av kreft.

- 15 14. Forbindelse eller sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, 9–11 for diagnostisering, bildedanning eller forebygging av neoangiogenese/angiogenese.

15. Forbindelse eller sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, 9–11 for
20 anvendelse som et kreftdiagnostisk eller bildedannende middel eller for anvendelse i behandlingen av kreft hvori kreften er prostata-, bryst-, lunge-, kolorektal- eller nyrecellekarsinom.