



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4095130 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 295/145 (2006.01)
A61K 51/04 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07B 59/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.05.06
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.01.31
(86)	European Application Nr.	22178736.9
(86)	European Filing Date	2014.10.17
(87)	The European Application's Publication Date	2022.11.30
(30)	Priority	2013.10.18, EP, 13004991 2014.07.03, EP, 14175612
(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
	Designated Extension States:	BA
(73)	Proprietor	Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Sveits
(72)	Inventor	EDER, Matthias, 68239 Mannheim, Tyskland KOPKA, Klaus, 69221 Dossenheim, Tyskland SCHÄFER, Martin, 69239 Neckarsteinach, Tyskland BAUDER-WÜST, Ulrike, 69198 Schriesheim, Tyskland HABERKORN, Uwe, 68723 Schwetzingen, Tyskland BENESOVA, Martina, 69239 Neckarsteinach, Tyskland MIER, Walter, 64625 Bensheim, Tyskland KLIEM, Hans-Christian, 64646 Heppenheim, Tyskland KRATOCHWIL, Clemens, 69120 Heidelberg, Tyskland EISENHUT, Michael, Heidelberg 69118, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	LABELED INHIBITORS OF PROSTATE SPECIFIC MEMBRANE ANTIGEN (PSMA), THEIR USE AS IMAGING AGENTS AND PHARMACEUTICAL AGENTS FOR THE TREATMENT OF PROSTATE CANCER
(56)	References Cited:	WO-A1-2013/022797

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/>

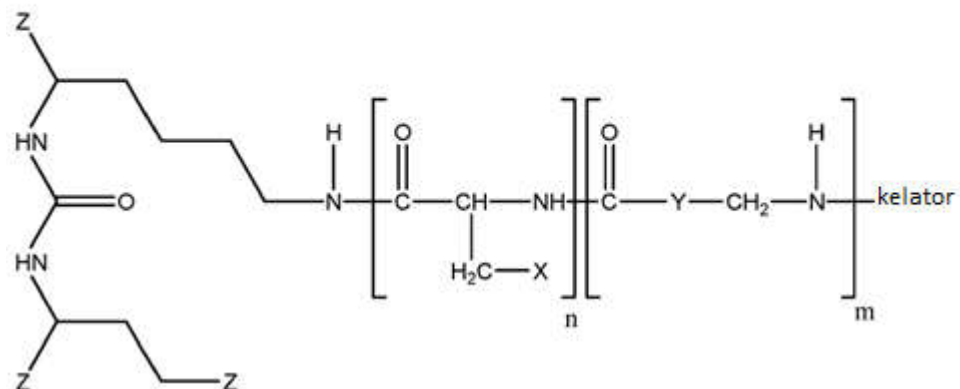
EP4095130

1

Patentkrav

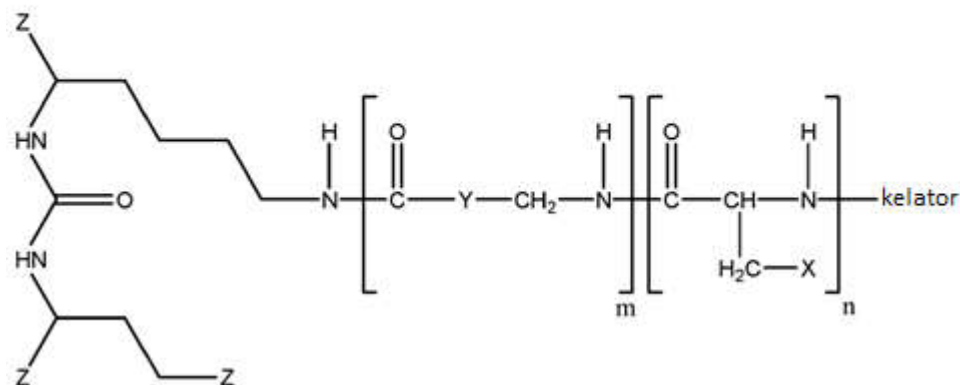
1. Forbindelse med formel (Ia) eller (Ib):

(la)



eller

(lb)



hvor

n er 0 eller 1,

10 m er 1, 2, 3 eller 4,

Z er $-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{SO}_2\text{H}$, $-\text{SO}_3\text{H}$, $-\text{SO}_4\text{H}$, $-\text{PO}_2\text{H}$, $-\text{PO}_3\text{H}$ eller $-\text{PO}_4\text{H}_2$,

X er naftyl, fenyl, bifenyl, indolyl (=2,3-benzopyrrolyl) eller benzotiazolyl,

Y er aryl, alkylaryl, syklopentyl, sykloheksyl eller sykloheptyl, og

kelator er

15 1,4,7,10-tetraazasyklododekan-N,N',N'',N'''-tetraeddiksyre (DOTA),

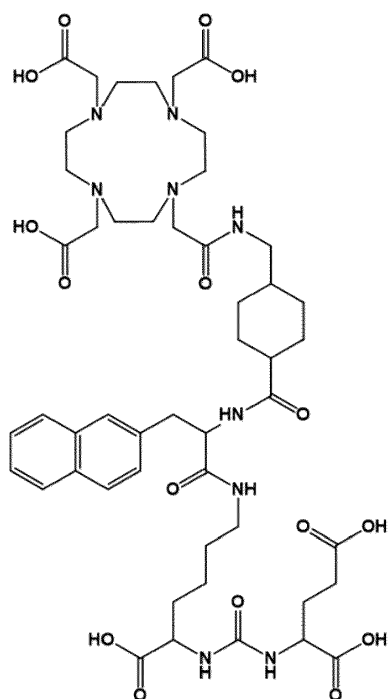
EP4095130

2

- N,N"-bis[2-hydroksy-5-(karboksyetyl)benzyl]etylendiamin-N,N"-dieddiksyre (HBED-CC),
- 1,4,7-triazasyklononan-1,4,7-trieddiksyre (NOTA),
- 2-(4,7-bis(karboksymetyl)-1,4,7-triazonan-1-yl)pentandisyre (NODAGA),
- 5 2-(4,7,10-tris(karboksymetyl)-1,4,7,10-tetraazasyklododekan-1-yl)pentandisyre (DOTAGA),
- 1,4,7-triazasyklononanfosfinsyre (TRAP),
- 1,4,7-triazasyklononan-1-[metyl(2-karboksyetyl)fosfinsyre]-4,7-bis[metyl(2-hydroksymetyl)fosfinsyre] (NOPO),
- 10 3,6,9,15-tetraazabisyklo[9.3.1.]pentadeka-1(15),11,13-trien-3,6,9-trieddiksyre (PCTA), eller
- dietylntriaminpentaeddiksyre (DTPA),
- eller et farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller et solvat derav, eller et solvat av saltet derav, eller en tautomer derav.
- 15
2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er forbindelsen av formel (Ia), eller et farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller et solvat derav, eller et solvat av saltet derav, eller en tautomer derav.
- 20 3. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, hvor X er naftyl, eller et farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller et solvat derav, eller et solvat av saltet derav, eller en tautomer derav.
4. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, hvor Y er sykloheksyl, eller et farmasøytisk
- 25 aksepterbart salt derav, eller et solvat derav, eller et solvat av saltet derav, eller en tautomer derav.
5. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, hvor n er 1, eller et farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller et solvat derav, eller et solvat av saltet derav, eller en tautomer derav.
- 30
6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvor forbindelsen har strukturen:

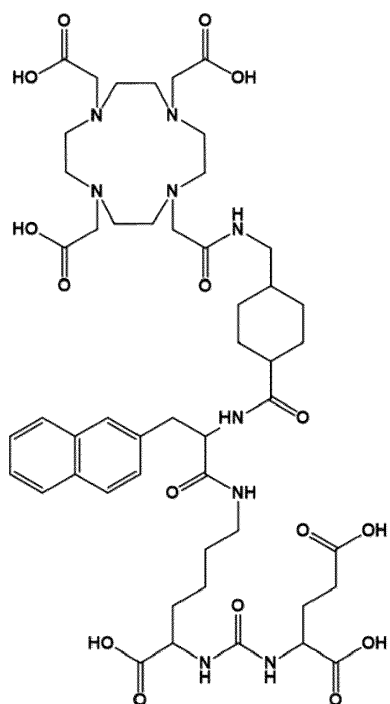
EP4095130

3



eller et farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller et solvat derav, eller et solvat av saltet derav, eller en tautomer derav.

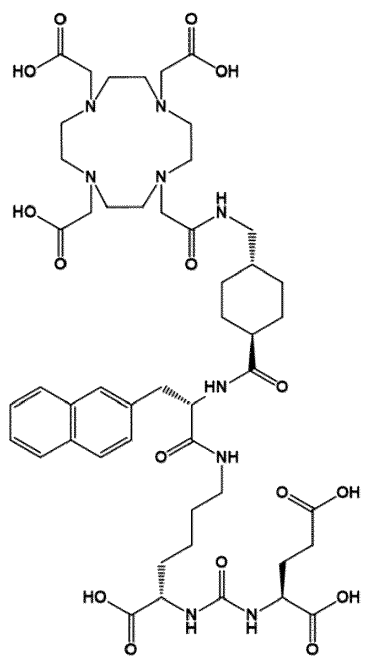
- 5 7. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvor forbindelsen har strukturen:



EP4095130

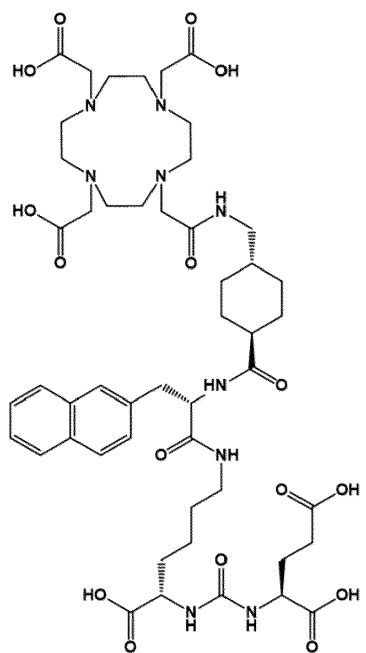
4

8. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor forbindelsen har strukturen:



5 eller et farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller et solvat derav, eller et solvat av saltet derav, eller en tautomer derav.

9. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvor forbindelsen har strukturen:



EP4095130

5

10. Metallkompleks, som omfatter: forbindelsen eller det farmasøytisk aksepterbare salt derav, eller solvat derav, eller solvat av saltet derav, eller en tautomer derav ifølge et hvilket som helst av de foregående krav; og en radionuklide, hvor radionukliden er kompleksert med kelatoren.

5

11. Metallkompleks ifølge krav 10, hvor radionukliden velges blant ^{89}Zr , ^{44}Sc , ^{111}In , ^{90}Y , ^{66}Ga , ^{67}Ga , ^{68}Ga , ^{177}Lu , $^{99\text{m}}\text{Tc}$, ^{61}Cu , ^{62}Cu , ^{64}Cu , ^{67}Cu , ^{149}Tb , ^{152}Tb , ^{155}Tb , ^{161}Tb , ^{153}Gd , ^{155}Gd , ^{157}Gd , ^{213}Bi , ^{225}Ac , ^{230}U , ^{223}Ra , ^{165}Er eller Fe.

10 12. Metallkompleks ifølge krav 11, hvor radionukliden velges blant ^{111}In , ^{90}Y , ^{68}Ga , ^{64}Cu , ^{153}Gd , ^{155}Gd , ^{213}Bi , ^{225}Ac , Fe eller ^{177}Lu .

13. Metallkompleks ifølge krav 12, hvor radionukliden er ^{177}Lu .

15 14. Farmasøytisk sammensetning som omfatter forbindelsen eller det farmasøytisk aksepterbare salt derav, eller solvat derav, eller solvat av saltet derav, eller en tautomer derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9, eller metallkomplekset ifølge et hvilket som helst av kravene 10-13, og en farmasøytisk akseptierbar bærer.

20 15. Forbindelse eller farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller solvat derav, eller solvat av saltet derav, eller en tautomer derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9, eller metallkomplekset ifølge et hvilket som helst av kravene 10-13, for anvendelse som et medikament.

25 16. Forbindelsen eller farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller solvat derav, eller solvat av saltet derav, eller en tautomer derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9, eller metallkomplekset ifølge et hvilket som helst av kravene 10-13, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av prostatakreft og/eller metastaser derav.

30

17. Forbindelse eller farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller solvat derav, eller solvat av saltet derav, eller en tautomer derav ifølge et hvilket som helst av kravene

EP4095130

6

1-9, eller metallkomplekset ifølge et hvilket som helst av kravene 10-13, for anvendelse i en fremgangsmåte for avbildning av en pasient.

- 5 18. Forbindelse eller farmasøytisk aksepterbart salt derav, eller solvat derav, eller solvat av saltet derav, eller en tautomer derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9, eller metallkomplekset ifølge et hvilket som helst av kravene 10-13, for anvendelse i en fremgangsmåte for diagnostisering av prostatakreft og/eller metastaser derav.