



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4249456 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	2024.12.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.09.04
(86)	European Application Nr.	23167668.5
(86)	European Filing Date	2020.01.30
(87)	The European Application's Publication Date	2023.09.27
(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
(62)	Divided application	EP3917626, 2020.01.30
(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, 81673 Munchen, Tyskland WESTER, Hans-Jürgen, 85304 Dinkelweg, Tyskland EIBER, Matthias Johannes, 85591 Vaterstetten, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

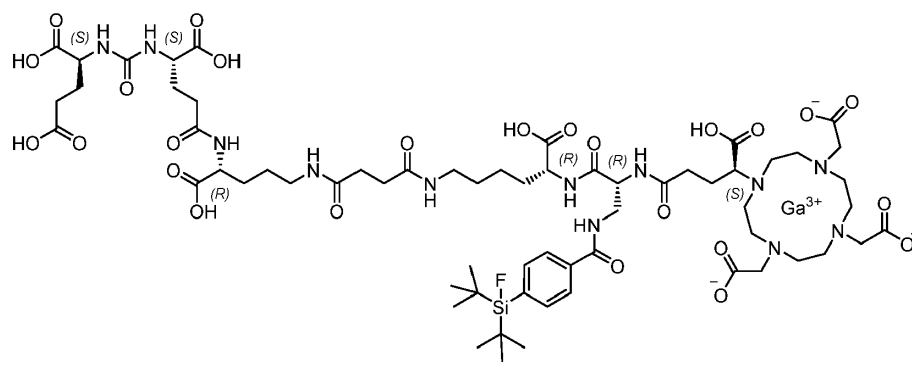
(54)	Title	PSMA BINDING DUAL MODE RADIOTRACER AND THERAPEUTIC
------	-------	---

(56)	References Cited:	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), US, pages 2350 - 2359, XP055452403, 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/>

Patentkrav

1. Forbindelse:



5 eller farmasøytisk akseptabelt salt av dette, der F er enten ^{18}F eller ^{19}F .

2. Forbindelse ifølge krav 1, der F er ^{18}F .

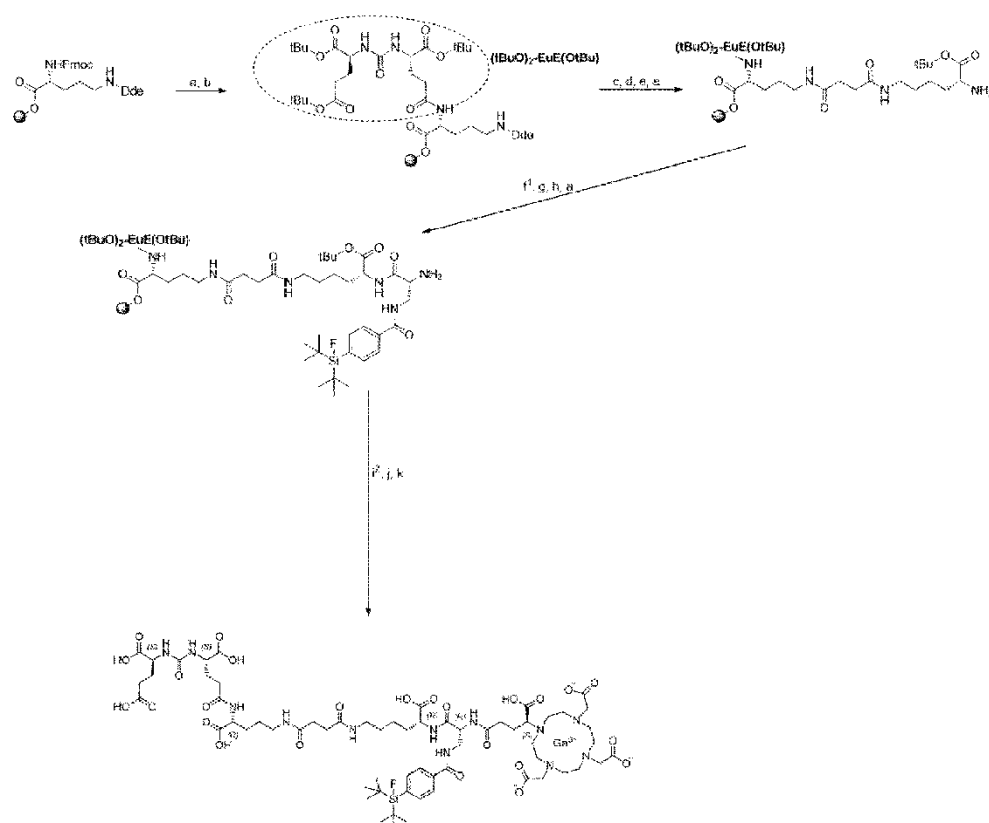
3. Forbindelse ifølge krav 1, der F er ^{19}F .

10

4. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 3, der Ga^{3+} er $^{\text{nat}}\text{Ga}^{3+}$.

5. Forbindelse ifølge krav 1, der F er ^{18}F og Ga^{3+} er $^{\text{nat}}\text{Ga}^{3+}$.

15 6. Framgangsmåte for syntese av forbindelse ifølge krav 1, som omfatter de følgende trinnene:



der prosedyrene representert ved a, b, c, d, e, f¹, g, h, i², j og k er som følger:

a) 20 % piperidin, (DMF);

b) (tBuO)EuE(OtBu)₂, HOAt, TBTU, DIPEA, (DMF);

5 c) 2 % hydrazin (DMF);

d) ravsyreanhydrid, DIPEA, (DMF);

e) Fmoc-D-Lys(OtBu)·HCl, HOAt, TBTU, DIPEA, (DMF);

f¹) Fmoc-D-Dap(Dde)-OH, HOAt, TBTU, 2,4,6-kollidin, (DMF);

g) imidazol, hydroksylaminhydroklorid, (NMP, DMF);

10 h) SiFA-BA, HOAt, TBTU, DIPEA (DMF);

i²) (S)-DOTA-GA(tBu)₄, HOAt, TBTU, 2,4,6-kollidin (DMF);

j) spalting og avbeskyttelse: TFA, TIPS, H₂O;

k) Ga(NO₃)₃, (tBuOH, H₂O).

15 7. Framgangsmåte ifølge krav 6, som ytterligere omfatter et påfølgende trinn med ¹⁸F-merking.

8. Farmasøytisk eller diagnostisk sammensetning som omfatter forbindelse ifølge et av kravene 1 til 5.

20

9. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 5 eller sammensetning ifølge krav 8, til bruk som kreftdiagnose- eller avbildningsmiddel.

10. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 5 eller sammensetning ifølge krav 8, til bruk i behandling av kreft.
- 5 11. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 5 eller sammensetning ifølge krav 8, til diagnose, avbildning eller forebygging av neoangiogenese/angiogenese.
- 10 12. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 5 eller sammensetning ifølge krav 8, til bruk som kreftdiagnose- eller avbildningsmiddel eller til bruk i behandling av kreft, der kreften er prostata-, bryst-, lunge-, tykktarms- eller nyrecellekarsinom.