



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20170453 T1

HR P20170453 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEJVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

A61K 51/04 (2006.01)

A61M 36/14 (2006.01)

C07D 213/16 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 02.06.2017.

(21) Broj predmeta: P20170453T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 20.03.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2009069741
Datum podnošenja međunarodne prijave: 29.12.2009.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 09837135.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 29.12.2009.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2010078370
Datum međunarodne objave: 08.07.2010.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2381967 A1
Datum objave europske prijave patenta: 02.11.2011.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2381967 B1
Datum objave europskog patenta: 18.01.2017.

(31) Broj prve prijave: 141885 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 31.12.2008.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

Avid Radiopharmaceuticals, Inc., 3711 Market Street, 7th Floor, 19104 Philadelphia, PA 19104, US

(72) Izumitelji:

**Tyler Benedum, 3522 Sunnyside Avenue, Philadelphia, PA 19129, US
Geoff Golding, 2419 South Lambert Street, Philadelphia, PA 19145, US
Nathaniel Lim, 700 East Cathedral Road, Philadelphia, PA 19128, US
Wei Zhang, 7 E. Manoa Road, Havertown, PA 19083, US**

(74) Zastupnik:

Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

**SINTEZA STIRILPIRIDINA RADIOAKTIVNO OBILJEŽENIH S 18F IZ TOSILATNIH PRETEČA I
NJIHOVI STABILNI FARMACEUTSKI PRIPRAVCI**

HR P20170453 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

- Postupak pripreme radiofarmaceutskog pripravka za vizualiziranje neurodegenerativnih bolesti mozga pozitronskom emisijskom tomografijom (PET) koji sadrži:
 5 djelotvornu količinu (*(E)*-4-(2-(6-(2-(2-(2-[¹⁸F]fluoretoksi)etoksi)etoksi)piridin-3-il)vinil)-*N*-metilbenzenamina);
 10,0% (vol./vol.) etil-alkohola; i
 0,5 % (tež./vol.) natrijevog askorbata,
 u 0,9% (tež./vol.) vodenoj otopini natrijevog klorida,
naznačen time što postupak obuhvaća:
 10 dobivanje mono-Boc-zaštićenog vinilnilinskog spoja;
 pretvorbu vinilnilinskog spoja u metil-*t*-butil-karbamatni derivat;
 reakciju 2-halogen-5-jodpiridina s trieten-glikolom;
 reakciju metil-*t*-butil-karbamatnog derivata sa spojem dobivenim u koraku reakcije 2-halogen-5-jodpiridina s
 15 trieten-glikolom kako bi se dobilo (*E*)-*tert*-butil-4-(2-(6-(2-(2-(2-hidroksietoksi)etoksi)etoksi)piridin-3-il)vinil)fenil(metil)karbamata; i
 reakciju (*E*)-*tert*-butil-4-(2-(6-(2-(2-(2-hidroksietoksi)etoksi)etoksi)piridin-3-il)vinil)fenil(metil)karbamata s tosil-
 kloridom kako bi se dobilo (*E*)-2-(2-(2-(5-(4-(*tert*-butoksikarbonil(metil)amino)stiril)piridin-2-iloksi)etoksi)etoksi)etil-4-metilbenzensulfonat;
 reakciju (*E*)-2-(2-(2-(5-(4-(*tert*-butoksikarbonil(metil)amino)stiril)piridin-2-iloksi)etoksi)etoksi)etil-4-metilbenzen
 20 sulfonat s [¹⁸F]-fluoridnim ionom u dimetil-sulfoksidnoj (DMSO) otopini ili neprotonskom otapalu visokog vrelišta
 kako bi se dobilo (*E*)-4-(2-(6-(2-(2-(2-[¹⁸F]fluoretoksi)etoksi)etoksi)piridin-3-il)vinil)-*N*-metilbenzenamin);
 izdvajanje (*E*)-4-(2-(6-(2-(2-(2-[¹⁸F]fluoretoksi)etoksi)etoksi)piridin-3-il)vinil)-*N*-metilbenzenamina);
 pročišćavanje (*E*)-4-(2-(6-(2-(2-(2-[¹⁸F]fluoretoksi)etoksi)etoksi)piridin-3-il)vinil)-*N*-metilbenzenamina); i
 formuliranje (*E*)-4-(2-(6-(2-(2-(2-[¹⁸F]fluoretoksi)etoksi)etoksi)piridin-3-il)vinil)-*N*-metilbenzenamina) u 0,9%
 25 (tež./vol.) vodenoj otopini natrijevog klorida u etil-alkoholnoj otopini koja sadrži etil-alkohol u količini od 10,0%
 (vol./vol.) od ukupnog pripravka i natrijev askorbat u količini od 0,5 % (tež./vol.) od ukupnog pripravka.
- Spoj, **naznačen time** što je spoj formule

