

Title (en)

COMPOUNDS FOR SITE-ENHANCED DELIVERY OF RADIONUCLIDES AND USES THEREOF.

Title (de)

VERBINDUNGEN ZUR ERHÖHTEN ZIELSPEZIFISCHEN ABGABE VON RADIONUKLIDEN UND DEREN VERWENDUNGEN.

Title (fr)

COMPOSES POUR L'ADMINISTRATION, AVEC SITE PREFERENTIEL, DE RADIONUCLEIDES ET LEUR UTILISATION.

Publication

**EP 0187832 A1 19860723 (EN)**

Application

**EP 85903633 A 19850715**

Priority

US 63231484 A 19840719

Abstract (en)

[origin: WO8600898A1] A dihydropyridine <SIGN> pyridinium salt type of redox, or chemical, delivery system for the site-specific and/or site-enhanced delivery of a radionuclide to the brain. A chelating agent capable of chelating with a radionuclide and having a reactive hydroxyl, carboxyl, amino, amide or imide group is coupled to a carrier moiety comprising a dihydropyridine <SIGN> pyridinium salt nucleus and then complexed with a radionuclide to provide a new radionuclide pharmaceutical that, in its lipoidal dihydropyridine form, penetrates the blood-brain barrier ("BBB") and allows increased levels of radionuclide concentration in the brain, particularly since oxidation of the dihydropyridine carrier moiety in vivo to the ionic pyridinium salt retards elimination from the brain while elimination from the general circulation is accelerated. This radionuclide delivery system is well suited for use in scintigraphy and similar radiographic techniques.

Abstract (fr)

On propose un type de système de distribution de rédox ou de produits chimiques, du type à sel dihydropyridine\$(1,7)\$pyridinium pour l'administration au cerveau et à d'autres organes d'un radionucléide, spécifique au site et/ou à site préférentiel. Un agent de chélation, capable d'effectuer la chélation avec un radionucléide et possédant un groupe réactif d'hydroxyle, carboxyle, amino, amide ou imide, peut être couplé à une moitié porteuse comprenant un noyau de sel dihydropyridine \$(1,7)\$pyridinium et ensuite complexé avec un radionucléide pour créer un nouveau produit radiopharmaceutique, qui sous sa forme dihydropyridine lipoïdale pénètre la barrière BBB (barrière sang-cerveau) et permet des concentrations de radionucléides plus élevées dans le cerveau, en particulier étant donné que l'oxydation de la moitié dihydropyridine *in vivo* en sel pyridinium ionique ralentit son élimination du cerveau, tout en accélérant son élimination de la circulation générale. Ce système d'administration de radionucléides est bien adapté à des utilisations en scintigraphie et dans des techniques radiographiques semblables.

IPC 1-7

**C07D 213/82**; **C07B 59/00**

IPC 8 full level

**A61K 51/00** (2006.01); **C07B 59/00** (2006.01); **C07D 207/404** (2006.01); **C07D 211/90** (2006.01); **C07D 213/80** (2006.01); **C07D 213/82** (2006.01); **C07D 215/12** (2006.01); **C07D 215/54** (2006.01); **C07D 277/04** (2006.01); **C07D 285/00** (2006.01); **C07D 401/12** (2006.01); **C07K 5/06** (2006.01); **C09K 3/00** (2006.01); **C07D 207/40** (2006.01)

CPC (source: EP KR)

**A61K 51/00** (2013.01 - KR); **C07C 323/00** (2013.01 - EP); **C07D 207/404** (2013.01 - EP); **C07D 211/90** (2013.01 - EP KR); **C07D 213/82** (2013.01 - EP); **C07D 277/04** (2013.01 - EP); **C07D 285/00** (2013.01 - EP); **C07D 401/12** (2013.01 - EP); **C07K 5/06026** (2013.01 - EP)

Citation (search report)

See references of WO 8600898A1

Cited by

US8701166B2

Designated contracting state (EPC)

AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)

**WO 8600898 A1 19860213**; AU 4635885 A 19860225; CA 1267899 A 19900417; DK 124786 A 19860520; DK 124786 D0 19860318; EP 0187832 A1 19860723; ES 552072 A0 19870416; ES 8704900 A1 19870416; FI 861118 A0 19860318; FI 861118 A 19860318; GR 851792 B 19851126; JP S61106556 A 19860524; KR 860000871 A 19860220; KR 900007514 B1 19901011; NO 860981 L 19860520; PT 80841 A 19850801; PT 80841 B 19870603; ZA 855476 B 19870325

DOCDB simple family (application)

**US 8501334 W 19850715**; AU 4635885 A 19850715; CA 487165 A 19850719; DK 124786 A 19860318; EP 85903633 A 19850715; ES 552072 A 19860217; FI 861118 A 19860318; GR 850101792 A 19850718; JP 16004085 A 19850719; KR 850005137 A 19850718; NO 860981 A 19860314; PT 8084185 A 19850719; ZA 855476 A 19850719