

Title (en)

NOVEL RADIOPHARMACEUTICALS AND CHELATING AGENTS USEFUL IN THEIR PREPARATION.

Title (de)

NEUE RADIOPHARMAZEUTISCHE VERBINDUNGEN UND CHELATIERUNGSMITTEL NÜTZLICH BEI IHRER HERSTELLUNG.

Title (fr)

PRODUITS RADIOPHARMACEUTIQUES ORIGINAUX, ET AGENTS DE CHELATION UTILES POUR LEUR PREPARATION.

Publication

**EP 0191788 A1 19860827 (EN)**

Application

**EP 85903750 A 19850715**

Priority

US 63238384 A 19840719

Abstract (en)

[origin: WO8600897A1] A dihydropyridine <SIGN> pyridinium salt type of redox, or chemical, delivery system for the site-specific and/or site-enhanced delivery of a radio-nuclide to the brain. A chelating agent capable of chelating with a radionuclide and having a primary, secondary or tertiary amino function can be converted to the corresponding analogue in which said function is replaced with a dihydropyridine <SIGN> pyridinium salt redox system and then complexed with a radionuclide to provide a new radiopharmaceutical 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 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 du rédox ou de produits chimiques, du type à sel dihydropyridine\$(1,7)\$pyridinium pour l'envoi 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 une fonction amino primaire, secondaire ou tertiaire, peut être transformé dans un agent analogue correspondant dans lequel ladite fonction est remplacée par un système rédox à sel dihydropyridine\$(1,7)\$pyridinium et ensuite complexée avec un radionucléide pour créer un nouveau produit radiopharmaceutique qui sous sa forme dihydropyridine lipoïdale pénètre la barrière BBB (barrière sang-cerveau) et autorise 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'envoi de radionucléides est bien adapté à des utilisations en scintigraphie et dans des techniques radiographiques semblables.

IPC 1-7

**C07D 213/20; C07B 59/00**

IPC 8 full level

**C07D 211/82** (2006.01); **A61K 51/00** (2006.01); **C07B 59/00** (2006.01); **C07D 211/90** (2006.01); **C07D 213/53** (2006.01); **C07D 213/82** (2006.01); **C07D 215/12** (2006.01); **C07D 215/48** (2006.01); **C07D 215/54** (2006.01); **C07D 217/00** (2006.01); **C07D 217/04** (2006.01); **C07D 217/10** (2006.01); **C07D 217/14** (2006.01); **C07D 217/26** (2006.01); **C07D 277/04** (2006.01); **C07D 285/00** (2006.01); **C07D 417/14** (2006.01); **C07F 13/00** (2006.01); **C07K 5/06** (2006.01); **C09K 3/00** (2006.01)

CPC (source: EP KR)

**A61K 51/00** (2013.01 - KR); **C07C 323/00** (2013.01 - EP); **C07D 211/90** (2013.01 - KR); **C07D 213/53** (2013.01 - EP); **C07D 213/82** (2013.01 - EP); **C07D 277/04** (2013.01 - EP); **C07D 285/00** (2013.01 - EP); **C07F 13/005** (2013.01 - EP); **C07K 5/06026** (2013.01 - EP)

Citation (search report)

See references of WO 8600897A1

Designated contracting state (EPC)

AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)

**WO 8600897 A1 19860213**; AU 4632085 A 19860225; CA 1266864 A 19900320; DK 124686 A 19860520; DK 124686 D0 19860318; EP 0191788 A1 19860827; ES 545395 A0 19861001; ES 552090 A0 19870501; ES 8700236 A1 19861001; ES 8705389 A1 19870501; FI 861119 A0 19860318; FI 861119 A 19860318; GR 851793 B 19851126; IL 75845 A0 19851129; JP S61112054 A 19860530; KR 870000935 A 19870310; KR 900008168 B1 19901105; NO 860980 L 19860506; PT 80842 A 19850801; PT 80842 B 19870527; ZA 855477 B 19870325

DOCDB simple family (application)

**US 8501333 W 19850715**; AU 4632085 A 19850715; CA 487166 A 19850719; DK 124686 A 19860318; EP 85903750 A 19850715; ES 545395 A 19850719; ES 552090 A 19860217; FI 861119 A 19860318; GR 850101793 A 19850718; IL 7584585 A 19850718; JP 16003985 A 19850719; KR 850005136 A 19850718; NO 860980 A 19860314; PT 8084285 A 19850719; ZA 855477 A 19850719