

Title (en)  
PRODUCTION OF RADIOIODINATED 1-(g(b)-D-ARABINOFURANOSYL)-5(E)-(2-IODOVINYL)URACIL, AND USES THEREOF, AND RELATED ANALOGUES INCORPORATING ALTERNATIVE HALOGEN RADIONUCLIDES, THE GENERAL RADIOHALOGENATION PRECURSORS, 1-(2,3,5-TRI-O-ACETYL-g(b)-D-ARABINOFURANOSYL)-5(Z and E)-(2-TRIMETHYLSILYLVINYL)URAC.

Title (de)  
HERSTELLUNG VON RADIOJODIERTEM 1-(BETA-D-ARABINOFURANOSYL)-5(E)-(2-IODOVINYL)-URACIL, SEINE VERWENDUNG, VERWANDTE ANALOGE, DIE ANDERE HALOGEN-RADIONUKLIDE EINGEBAUT HABEN, DIE ALLGEMEINEN RADIOHALOGENIERUNGSVORSTUFEN 1-(2,3,5-TRI-O-ACETYL-BETA-ARABINOFURANOSYL)-5(Z UND E)-(2-TRIMETHYLSILYLVINYL)URACIL, METHODEN ZUR RADIOHALOGENIERUNG SOLCHER VORSTUFEN UND IHRE VERWENDUNG.

Title (fr)  
PRODUCTION DU 1-(g(b)-D-ARABINOFURANOSYL)-5(E)-(2-IODOVINYL)URACIL ET SES UTILISATIONS, AINSI QUE DES ANALOGUES ASSOCIES RENFERMANT D'AUTRES RADIONUCLIDES HALOGENES, LES PRECURSEURS GENERAUX DE RADIOHALOGENATION, 1-(2,3,5-TRI-O-ACETYL-g(b)-D-ARABINOFURANOSYL)-5(Z ET E)-(2-TRIMETHYLSILYLVINYL)URACI.

Publication  
**EP 0428623 A1 19910529 (EN)**

Application  
**EP 89910499 A 19890808**

Priority  
US 23113788 A 19880810

Abstract (en)  
[origin: WO9001324A1] Radioactive antiviral compounds, with 1-( beta -D-arabinofuranosyl)-5(E)-(2-[<\*>I]-iodovinyl)uracil, hereinafter referred to as "[<\*>I]-IVaraU", as the prototype compound for the class of compounds designated as 1- beta -D-arabinofuranosyl)-5(E)-(2-[<\*>X]- halogenovinyl)uracil, hereinafter referred to as "[<\*>X]-XVaraU", and novel precursors thereof, 1-(2,3,5-tri-O-acetyl- beta -D-arabinofuranosyl)-5(Z and E)-(2-trimethylsilylvinyl)uracil, hereinafter referred to as "TMSVaraU", and processes for the preparation thereof, and uses thereof, wherein "<\*>I" stands for a radionuclide of iodine, and "<\*>X" stands for any other appropriate halogen radionuclide. Inclusion of the appropriate gamma or positron emitting iodine, or other appropriate halogen radionuclide, into the structure of [<\*>I]-IVaraU, makes this agent useful as a diagnostic tool for detection of herpes virus infections in vitro and in vivo. Inclusion of the appropriate alpha- and/or beta- and/or gamma- emitting, and/or Auger electron decay-associated, (specifically-nuclear-toxic) isotopes of iodine, or other appropriate halogen radionuclides, into the structure of this agent makes the agent useful as a unique radiotherapeutic tool for herpes virus infections by precise targeting of the lethal effects of alpha and/or beta radiation and/or Auger electron decay effects to the site of viral infection.

Abstract (fr)  
Composés radioactifs antiviraux renfermant le 1-(beta-D-arabino-furanosyl)-5(E)-(2-[\*I]-iodovinyl)uracil, indiqué ci-après par "[\*I]-IVaraU", comme composé prototype pour la classe de composés désignés sous le nom de 1-(beta-D-arabinofuranosyl)-5(E)-(2-[\*X]- halogénovinyl)uracil, indiqués ci-après par "[\*X]-XVaraU", et les nouveaux précurseurs de ceux-ci, 1-(2,3,5-tri-O-acétyl-beta-D-arabinofuranosyl)-5(Z et E)-(2-triméthylsilylvinyl)uracil, indiqués ci-après par "TMSVaraU", procédés de préparation de ces composés et utilisation de ceux-ci, formules dans lesquelles "\*"I" désigne un radionuclide de l'iode, et "\*"X" désigne toute autre radionuclide halogéné approprié. L'inclusion de l'iode émetteur gamma ou de positron approprié, ou d'un autre radionuclide halogéné approprié, dans la structure de [\*I]-IVaraU, rend cet agent utile comme outil de diagnostic pour la détection des infections in vitro et in vivo dues au virus de l'herpès. L'inclusion d'isotopes de l'iode appropriés émetteurs alpha et/ou bêta et/ou gamma, et/ ou associés à une décroissance électronique Auger (spécifiquement nucléaires-toxiques), ou d'autres radionuclides halogénés appropriés, dans la structure de cet agent rend ledit agent utile comme outil unique radiothérapeutique pour des infections dues au virus de l'herpès, par ciblage précis des effets létaux des radiations alpha et/ou bêta et/ou des effets de décroissance électronique Auger sur le site de l'infection virale.

IPC 1-7  
**A61K 31/70; A61K 49/02; C12Q 1/70**

IPC 8 full level  
**A61K 51/04** (2006.01)

CPC (source: EP)  
**A61K 51/0491** (2013.01); **A61K 2121/00** (2013.01); **A61K 2123/00** (2013.01)

Designated contracting state (EPC)  
AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)  
**WO 9001324 A1 19900222**; EP 0428623 A1 19910529; EP 0428623 A4 19931208

DOCDB simple family (application)  
**US 8903396 W 19890808**; EP 89910499 A 19890808