

Title (en)  
RADIOLABELLED SOMATOSTATIN DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND USE.

Title (de)  
RADIOAKTIV MARKIERTE SOMATOSTATINDERIVATE, IHRE HERSTELLUNG UND VERWENDUNG.

Title (fr)  
DERIVES DE SOMATOSTATINE RADIOMARQUES, LEUR PREPARATION ET UTILISATION.

Publication  
**EP 0588905 A1 19940330 (EN)**

Application  
**EP 92912727 A 19920602**

Priority  
NL 9100954 A 19910603

Abstract (en)  
[origin: WO9221383A1] Radioactive-technetium-labelled and radioactive-rhenium-labelled somatostatin derivatives are disclosed for the selective detection/localisation or for the selective therapeutic treatment of tumours with somatostatin receptors. The labelled polypeptides are characterised by the general formula: R1-S1-A1-A2-(D)Trp-A3-A4-A5-Thr-S2-R2, wherein R1 is a hydrogen atom or a C1-C4 alkylcarbonyl group, R2 is an amino group, a hydroxy group or a C1-C4 alkoxy group, A1 and A5 each independently are Phe, MePhe, EtPhe, Tyr, Trp, Nal (naphthylalanyl), or Cys, A2 is Phe, MePhe, EtPhe, Tyr, Trp or Nal, A3 is Lys, MeLys or ( epsilon -Me)Lys, A4 is Thr or Val, S1 is an amino acid sequence of 1 to 6 amino acids, selected from the group consisting of Ala, Cys, Asn, Phe, MePhe, EtPhe, Tyr, Trp, Nal, Gly, Lys, MeLys, ( epsilon -Me)Lys, Thr, Val, Asn and Ser, and S2 is an amino acid sequence of 0 to 3 amino acids selected from the group mentioned sub S1, with the proviso that the polypeptide comprises two cysteine amino acid radicals, the metal-radionuclide being selected from a radioactive Tc or Re isotope which, as a cation, is bound covalently to the mercapto groups of the cysteine amino acid radicals.

Abstract (fr)  
L'invention concerne des dérivés de somatostatine marqués au technetium radioactif et marqués au rhénium radioactif utilisés dans la détection/localisation sélective ou dans le traitement thérapeutique sélectif de tumeurs à l'aide de récepteurs de somatostatine. Les polypeptides sont caractérisés par la formule générale R1-S1-A1-A2-(D)Trp-A3-A4-A5-Thr-S2-R2, dans laquelle R1 représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkylcarbonyle C1-C4, R2 représente un groupe amino, un groupe hydroxy ou un groupe alcoxy C1-C4, A1 et A5 représentent chacun indépendamment Phe, MePhe, EtPhe, Tyr, Trp, Nal (naphtylalanyle), ou Cys, A2 représente Phe, MePhe, EtPhe, Tyr, Trp ou Nal, A3 représente Lys, MeLys ou (epsilon-Me)Lys, A4 représente Thr ou Val, S1 représente une séquence d'acides aminés comprenant 1 à 6 acides aminés, choisis dans le groupe constitué par Ala, Cys, Asn, Phe, MePhe, EtPhe, Tyr, Trp, Nal, Gly, Lys, MeLys, (epsilon-Me)Lys, Thr, Val, Asn et Ser, et S2 représente une séquence d'acides aminés comprenant 0 à 3 acides aminés choisis dans le groupe appelé sous-S1, à condition que le polypeptide comprenne deux radicaux d'acides aminés de cystéine, le radionuclide de métal étant choisi entre un isotope Tc et Re radioactif, lequel en tant que cation, est lié de manière covalente aux groupes mercapto des radicaux d'acides aminés de cystéine.

IPC 1-7  
**A61K 49/02**; **A61K 43/00**

IPC 8 full level  
**A61K 38/16** (2006.01); **A61K 51/00** (2006.01); **A61K 51/08** (2006.01); **A61P 35/00** (2006.01); **C07K 1/113** (2006.01); **C07K 14/575** (2006.01); **C07K 14/655** (2006.01)

CPC (source: EP)  
**A61K 51/083** (2013.01); **A61K 51/088** (2013.01); **A61P 35/00** (2017.12); **C07K 14/6555** (2013.01); **A61K 2121/00** (2013.01); **A61K 2123/00** (2013.01)

Citation (search report)  
See references of WO 9221383A1

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

DOCDB simple family (publication)  
**WO 9221383 A1 19921210**; AU 2017492 A 19930108; AU 657770 B2 19950323; CA 2102633 A1 19921204; EP 0588905 A1 19940330; JP H06508357 A 19940922

DOCDB simple family (application)  
**US 9204559 W 19920602**; AU 2017492 A 19920602; CA 2102633 A 19920602; EP 92912727 A 19920602; JP 50059693 A 19920602