

Neuartige Chelatliganden für innovative Radiopharmaka

Marktpotential und Bedarf

In der modernen Onkologie und Neurologie werden Radiopharmaka in großem Umfang eingesetzt, wobei der Bedarf an Radiopharmaka weltweit kontinuierlich weiter steigen wird. So geht die Unternehmensberatung Frost & Sullivan in ihrer Studie von 2005 von einem Anstieg des Umsatzvolumens für Kontrastmittel von 779,4 Millionen US \$ in 2003 auf 1.238,3 Millionen US \$ in 2010 (37 %) aus.

Um den wachsenden Bedarf für innovative Radiopharmaka zu decken und bestehende und neue nuklearmedizinische Anwendungsfelder zu bedienen, wurden an der Universität Heidelberg und am Forschungszentrum Dresden-Rossendorf neuartige Chelat-Liganden entwickelt, die sich durch die folgenden Vorteile auszeichnen:

Innovation

A) Tetrathiol-Derivate:

Technetium-99m stellt eines der bedeutendsten Radionuklide für die bildgebende Diagnostik dar, weil es über Tc-Generatoren sehr gut verfügbar ist, hervorragende Zerfallseigenschaften aufweist und viele Erfahrungswerte vorliegen. Darüber hinaus wurden die Tetrathiol-Derivate speziell für die Rhenium-Nuklide $^{188/186}\text{Re}$ entwickelt. Insbesondere ^{188}Re bietet durch seine **duale Funktion als γ - und als β^- -Strahler** das Potential, völlig neuartige radiopharmazeutische Produkte zu entwickeln, die z. B. gleichzeitig Diagnostika und Therapeutika in einem sein könnten. So könnte das Einzelpräparat zur prätherapeutischen Dosisabschätzung verwendet und gleichzeitig als therapeutischer Wirkstoff eingesetzt werden.

B) Bispidin-Derivate:

Dieses Ligandensystem ist auf die Bindung von Kupfer-Nukliden spezialisiert, insbesondere auf den diagnostisch bedeutenden Positronenemitter ^{64}Cu und das Therapiekupfer-Nuklid ^{67}Cu , lässt sich aber auch auf andere Nuklide (z. B. $^{99\text{m}}\text{Tc}$, $^{188/186}\text{Re}$, ^{111}In , ^{90}Y oder ^{68}Ga) anwenden. ^{64}Cu weist sehr gute Zerfallseigenschaften auf und zeichnet sich durch seine ausgezeichnete Bildqualität im PET aus. In **präklinischen "proof of concept" Tiermodellen** konnten bereits das **diagnostische Potential** einer **^{64}Cu -Bispidin-Bombesin Verbindung** für das **Prostatakarzinom** überzeugend demonstriert werden (S. Juran *et al.* 2009).

C) Bispidon-Derivate:

Dieses Ligandensystem weist prinzipiell die gleiche Performance wie das Bispidin-System auf, zeichnet sich jedoch gegenüber konventionellen Chelatliganden zusätzlich dadurch aus, dass es nicht für nur ein bestimmtes Radionuklid spezifisch ist, sondern sich gezielt auf eine Vielzahl von metallischen Radionukliden hin anpassen lässt, z. B. $^{99\text{m}}\text{Tc}$, ^{186}Re , ^{188}Re , ^{67}Cu , ^{64}Cu , ^{177}Lu , ^{89}Sr , ^{225}Ac , ^{68}Ga , ^{82}Rb oder ^{90}Y .

Zusätzliche Vorteile

- Hydrolytisch und radiochemisch stabile Liganden mit hervorragendem Komplexierungsvermögen
- Grundgerüst bietet vielfältige Möglichkeiten für die Anbindung von funktionellen Biomolekülen
- Kosteneffizientes und einfaches Verfahren zur Herstellung der Radionuklidkomplexe
- Optimierung der Liganden auf die wichtigsten metallischen Radionuklide ($^{99\text{m}}\text{Tc}$, $^{188/186}\text{Re}$, $^{67/64}\text{Cu}$, ^{68}Ga , ^{111}In , ^{90}Y , ^{177}Lu , ^{89}Sr , ^{225}Ac , ^{82}Rb , etc.) eröffnet weites medizinisches Anwendungsfeld
- attraktives Patent-Portfolio (PCT)

Anwendungsbereiche

Die neuartigen Chelat-Liganden eignen sich für die Herstellung innovativer **Radiopharmaka**, die auf metallischen Radionukliden basieren. Radiopharmaka werden in der Nuklearmedizin bei zahlreichen Anwendungen benötigt:

Radiodiagnostika:

- Kontrastmittel, bildgebende Diagnostik
- Szintigraphie, z. B. von Myokard, Niere, Skelett, Schilddrüse, etc.
- Rezeptorbildgebung (neuroendokrine Tumore)
- Onkologie, Neurologie
- PET und SPECT

Radiotherapeutika:

- Endoradionuklidtherapie, Radioimmunologie
- Tumorthherapie ("Strahlentherapie")
- Schmerztherapie (rheumatoide Arthritis)

Technologietransfer

Die Technologie-Lizenz-Büro GmbH ist mit der Verwertung beauftragt und bietet Unternehmen die Möglichkeit der Lizenznahme.

Weitere Informationen zu "Radiopharmaka":

Dr. Daniel Veith

dveith@tlb.de

Technologie-Lizenz-Büro (TLB)

der Baden-Württembergischen Hochschulen GmbH

Ettlinger Straße 25 | 76137 Karlsruhe | Germany

Tel.: +49-(0)721-79004-0 | Fax: +49-(0)721-79004-79

www.tlb.de

