

Synthèse du triazacyclononane et nouveaux dérivés N/C fonctionnalisés

triazacyclononane / agent chélatant / radioélément / métaux / chimie / synthèse / imagerie médicale



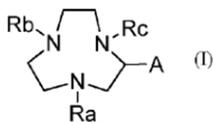
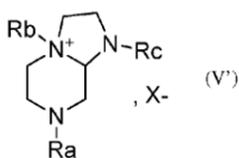
CONTEXTE

Les polyzamacrocyclus et leurs dérivés sont des macrocyclus azotés connus pour leurs propriétés de séquestration vis-à-vis des métaux de transition et des métaux lourds. Parmi ces systèmes macrocycliques, les dérivés du ligand tridentate 1,4,7-triazacyclononane (TACN) présentent de très bonnes propriétés complexantes, les rendant susceptibles d'être utilisés dans de nombreuses applications, de la catalyse à la complexation de radiométaux pour l'imagerie et la thérapie médicale.

DESCRIPTION

L'invention concerne la préparation aisée du TACN et ses dérivés N- et C-fonctionnalisés (formule I) via l'intermédiaire bicyclique clé (formule V'). La méthode de synthèse développée par les chercheurs de l'ICMUB (Institut de Chimie Moléculaire de l'Université de Bourgogne) est bien plus performante que celles existantes en terme de conditions de réaction, rendement, coût et production de déchets et sous-produits.

L'invention permet notamment l'accès aux dérivés C-fonctionnalisés du TACN, qui sont des importants précurseurs d'agents chélatants bifonctionnels pour la conjugaison de biomolécules (peptides, anticorps, etc.) et la complexation de radioéléments.



AVANTAGES COMPÉTITIFS

- Procédé de synthèse plus efficace : moins d'étapes, pas de conditions drastiques, moins de déchets
- Accès à une nouvelle famille d'agents chélatants bifonctionnels (dérivés C-fonctionnalisés)
- Synthèse plus rentable que celles existantes



Marchés et applications

Chimie pharmaceutique :
agents chélatants de radioéléments utilisés en imagerie médicale (PET ou SPECT) et/ou radiothérapie

Chimie environnementale :
traitement d'effluents contaminés (métaux lourds toxiques et éléments radioactifs)



Stade de développement

Synthèse du TACN et ses dérivés C-fonctionnalisés à l'échelle de la centaine de grammes ; études de radiomarquage (^{68}Ga et ^{64}Cu) et imagerie PET *in vivo* sur petit animal (modèles cancer du sein)



Propriété intellectuelle

Brevet européen délivré (PCT du 21/11/2013) ; brevets US délivrés (dépôt le 13/11/2013)



Partenariat recherché

Licence de brevet

CONTACTEZ-NOUS

Daniel KIRCHHERR

Chargé de Développement

+33 (0)7 76 16 66 90

daniel.kirchherr@sayens.fr