

Ritkaföldfém(III)-ionok kelálására alkalmas di- tri- és tetrapikolinát származékok előállítása és jellemzése diagnosztikai és terápiás alkalmazásokhoz

Synthesis and characterization of di-, tri- and tetrapicolinate derivatives for the complexation of rare earth(III) ions for diagnostic and therapeutic applications

SZILÁGYI Balázs* ^{1,2}, MADARASI Enikő^{1,2}, Antía FREIRE-GARCÍA³, Fátima LUCIO-MARTÍNEZ³, Roció UZAL-VARELA, Paulo PÉREZ-LOURIDO⁵, Yasniel BABÍ ARAUJO⁴, Melinda WUEST⁴, Laura VALENCIA⁵, Saray ARGIBAY-OTERO^{3,5}, Aurora RODRÍGUEZ-RODRÍGUEZ³, David ESTEBAN-GÓMEZ³, Nicolas LEPAREUR⁶, TÓTH Éva⁷, Frank WUEST⁴, Carlos PLATAS-IGLESIAS³, TIRCSÓ Gyula¹

¹ Debreceni Egyetem (DE), Debrecen, Egyetem tér 1, H-4032, Magyarország.

² Kémia Tudományok Doktori Iskola (DE), Debrecen, Egyetem tér 1, H-4032, Magyarország.

³ Universidade da Coruña, Centro Interdisciplinar de Química e Bioloxía (CICA) and Departamento de Química, Facultade de Ciencias, 15071, A Coruña, Galicia, Spain.

⁴ Department of Oncology, University of Alberta, Edmonton, Alberta T6G 1Z2, Canada.

⁵ Departamento de Química Inorgánica, Facultad de Ciencias, Universidade de Vigo, As Lagoas, Marcosende, 36310, Pontevedra, Spain.

⁶ Centre Eugène Marquis, Inrae, Inserm, Institut NUMECAN (Nutrition, Métabolismes et Cancer) University of Rennes UMR_A 1341, UMR_S 1317, F-35000 Rennes, France

⁷ Centre de Biophysique Moléculaire, CNRS UPR 4301, Université d'Orléans rue Charles Sadron, 45071 Orleans, France

* szilagyi.balazs@science.unideb.hu, <https://kemia.unideb.hu/node/439>

ABSTRACT

Imaging (e.g., MRI, PET etc.) and therapeutic methods utilizing rare earth(III) ion-based continuous require the development of new and more efficient chelating agents. Due to the lanthanide contraction, ligands with different denticities are required to achieve Ln(III) complexes with optimal thermodynamic stability and kinetic inertness. A major advancement was the investigation of the rigid backbone *CHXOCTAPA* ligand, which forms highly stable and inert Ln(III) complexes. In this presentation I will introduce the synthesis of a series of di-, tri-, and tetrapicolinate derivatives based on the 1,2-diaminocyclohexane backbone, the detailed physicochemical characterization of their Ln(III) complexes and the most relevant results from our *in vivo* studies.

Keywords: rare earth complexes, thermodynamic stability, kinetic inertness, radiolabeling

ÖSSZEFOGLALÓ

A ritkaföldfém(III)-ionokat alkalmazó képalkotó diagnosztikai (pl.: MRI, PET stb.) és terápiás módszerek folyamatosan igénylik az új, hatékonyabb komplexképző ágensek fejlesztését. A lantanoida-kontrakció miatt különböző denticitású ligandumokra van szükség ahhoz, hogy a megfelelő termodinamikai és kinetikai tulajdonságokkal rendelkező Ln(III)-komplexeit állíthassunk elő. Jelentős előrelépést hozott a merev vázas *CHXOCTAPA* ligandum stabil és inert Ln(III)-komplexeinek vizsgálata. Az előadásomban bemutatom az 1,2-diaminociklohexán alapú ligandumcsalád di- tri- és tetrapikolinát származékainak előállítását, és Ln(III)-komplexeik részletes fizikai- kémiai jellemzését, valamint az *in vivo* vizsgálataink legfontosabb eredményeit.

Kulcsszavak: ritkaföldfém(III)-komplexei, oldategyensúly, kinetika, radiokémiai jelölés

Köszönetnyilvánítás: A Kulturális és Innovációs Minisztérium EKÖP-25-3-II-DE-42 kódszámú Egyetemi Kutatói Ösztöndíj Programjának a Nemzeti Kutatási, Fejlesztési és Innovációs alapról finanszírozott szakmai támogatásával készült