БЕНЗОАЗАКРАУН-ЭФИРЫ: НОВЫЕ ЭФФЕКТИВНЫЕ ХЕЛАТОРЫ ДЛЯ РАДИОНУКЛИДОВ

**А.В. Пашанова^{1,2}, А.Д. Зубенко¹, Е.В. Матазова³, Б.В. Егорова³,
О.А. Федорова^{1,2}**

¹Институт элементоорганических соединений им. А. Н. Несмеянова,
119991, Россия, Москва, ул. Вавилова, 28.

²Российский химико-технологический университет им. Д. И. Менделеева,
125047, Россия, Москва, Миусская площадь, 9.

³Московский государственный университет им. М.В. Ломоносова,
Химический факультет, 119991, Россия, Москва, Ленинские горы, д. 1, стр. 3.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-130

E-mail: 1404an99@mail.ru

В последние десятилетия разработка новых хелаторов и получение радиофармпрепаратов на их основе является крайне актуальной задачей ядерной медицины. Применяющиеся в настоящее время хелаторы DOTA и ДТРА имеют ряд недостатков, таких как медленная кинетика комплексообразования или неустойчивость комплексов [1]. В связи с этим, целью данной работы является разработка новых хелаторов с оптимальными свойствами для их применения в радиофармацевтике. Нами были предложены комплексоны на основе бензоазакраун-эфиров, содержащих дополнительные хелатирующие группы.

Для синтезированных соединений методом потенциометрического титрования были получены следующие константы устойчивости комплексов:

Лиганд	lgK				
	Cu ²⁺	Pb ²⁺	Sc ³⁺	Y ³⁺	Bi ³⁺
H3BA3A	18,4	14,0	14,2	11,4	26,9
H4BATA	23,9	22,3	21,17	17,4	32,5

Для лиганда H₄BATA была проведена серия исследований для определения возможности применения как компонента радиофармпрепаратов с ^{213,212}Bi. Показано, что 97–99% катиона связывается менее чем за минуту при комнатной температуре.

В исследованиях меченых соединений *in vitro* установлено, что комплекс BATA•Bi³⁺ обладает высокой стабильностью, а также демонстрирует эффективное выведение и отсутствие диссоциации комплекса в условиях *in vivo*.

Таким образом, H₄BATA является идеальным хелатором для получения на его основе конъюгатов с биомолекулами и создания терапевтических радиофармпрепаратов, содержащих короткоживущие изотопы висмута.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского научного фонда (проект № 18-73-10035).

Литература

[1] E. V. Matazova, B. V. Egorova, E. A. Konopkina et al. Med. Chem. Commun., 2019, 10, 1641-1645.