

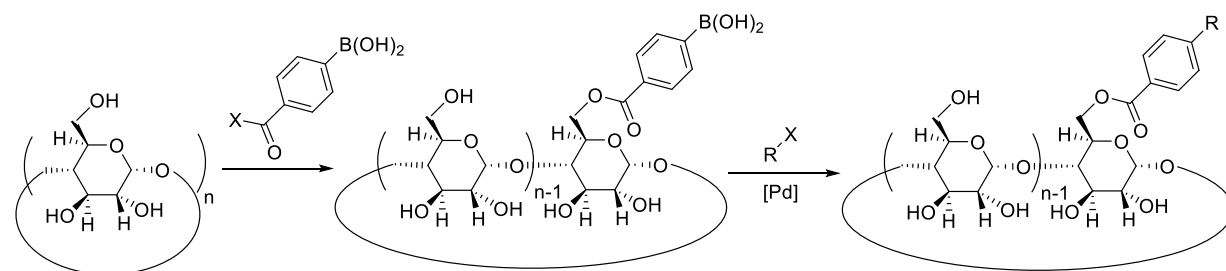
Proposition de stage

Coordonnées	Tuteur : Stéphane Menuel Équipe/laboratoire : Equipe CASU / UCCS Artois Adresse : Univ. Artois, Faculté des Sciences - Lens E-mail : stephane.menuel@univ-artois.fr Tél. : 03.21.79.17.73
Titre du stage	Synthèses de dérivés phénylboroniques de cyclodextrines comme molécules plateforme pour la pharmacie

Résumé

Les cyclodextrines (CDs) sont actuellement largement utilisées dans des applications pharmaceutiques^[1] ou médicales^[2]. L'utilisation de la cavité hydrophobe des cyclodextrines est traditionnellement utilisée pour créer des assemblages supramoléculaires. La fonctionnalisation sélective des cyclodextrines offre la possibilité d'améliorer les capacités de reconnaissance ou d'association par le choix judicieux de substituants.

Nous proposons d'utiliser comme plateforme pour la synthèse des dérivés phénylboroniques de cyclodextrines (PBA-CD)^[3] puis de mettre à profit la fonction acide boronique afin de réaliser des réactions de couplages de Suzuki^[4].



Les structures obtenues pourront jouer le rôle de prodrogues pour de nombreuses molécules d'intérêt pharmaceutique. Ainsi, une amélioration de la biodisponibilité pourrait être observée. Profitant de l'expérience de notre laboratoire^[5], les réactions seront réalisées en voie solvant (activation thermique) et en voie sèche (activation mécano-chimique) afin d'étudier l'influence du milieu réactionnel sur les réactivités. Cette dernière voie sera privilégiée afin de limiter la présence de solvants résiduels.

- [1] aH. Shelley, R. J. Babu, *Journal of Pharmaceutical Sciences* **2018**, *107*, 1741-1753; bY. Vikas, K. Sandeep, D. Braham, C. Manjusha, V. Budhwar, *Asian Journal of Pharmaceutics* **2018**, *12*, S394-S409; cT. F. Cova, D. Murtinho, A. A. C. C. Pais, A. J. M. Valente, *Frontiers in Chemistry* **2018**, *6*.
- [2] R. Pinalli, A. Pedrini, E. Dalcanale, *Chemical Society Reviews* **2018**, *47*, 7006-7026.
- [3] K. Nakamura, T. Seki, Y. Egawa, R. Miki, Y. Oda, T. Yamanoi, T. Seki, *Chemical & Pharmaceutical Bulletin* **2013**, *61*, 1188-1191.
- [4] H. DeFrancesco, J. Dudley, A. Coca, in *Boron Reagents in Synthesis, Vol. 1236* (Ed.: A. Coca), **2016**, pp. 1-25.
- [5] S. Menuel, B. Doumert, S. Saitzek, A. Ponchel, L. Delevoeye, E. Monflier, F. Hapiot, *Journal of Organic Chemistry* **2015**, *80*, 6259-6266.