



Des complexes Au-NHC pour lutter contre la leishmaniose

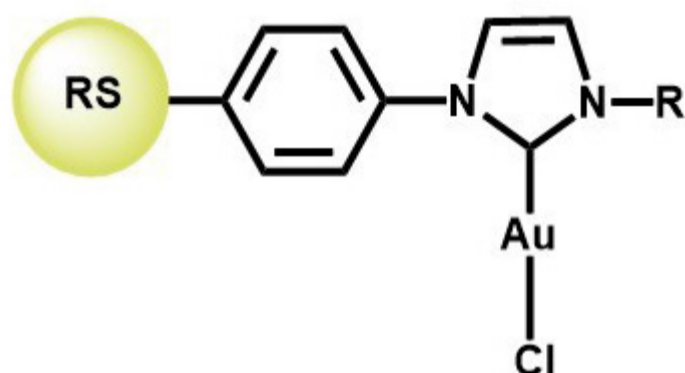
Mots-clés : Or, carbène, Leishmania

Avec une incidence annuelle estimée à un million de cas, la leishmaniose est l'une des cinq principales maladies parasitaires à transmission vectorielle. Les traitements médicaux disponibles comportent des effets secondaires, notamment la toxicité, le ciblage non spécifique et le développement de résistances. Nous avons montré dans des études précédentes que les complexes d'or(I) portant des ligands type carbène *N*-hétérocyclique (NHC) avec des bras latéraux contenant de l'azote ou du soufre ont des activités biologiques intéressantes dans les domaines du cancer et du paludisme, et cette étude permet d'étendre leur spectre d'action à la lutte contre la leishmaniose.

Ainsi, quatre des six complexes d'or étudiés ont des valeurs d' IC_{50} dans la gamme basse ou sub-micromolaire (0,15-1,3 μ M), dont trois avec des valeurs d'indice de sélectivité (IS) comprises

entre 46 et 108. Ces valeurs sont très proches de celles observées pour les médicaments utilisés actuellement dans le traitement de la leishmaniose.

Ces résultats suggèrent une remarquable activité leishmanicide *in vitro* pour trois nouveaux complexes (NHC)Au(I)Cl avec des bras latéraux contenant du soufre (notés RS sur la figure), ce qui en fait des candidats pour d'autres études *in vivo* sur modèles murins, actuellement en cours d'investigation. Une demande de brevet concernant ce type de composés a été déposée en 2020.



$IC_{50} = 0,15 - 1,3 \mu\text{M}$
SI (avec THP1) = 46 à 108

© Heinz GORNITZKA / LCC Toulouse / IPBS

Référence

Synthesis, Characterization, and Antileishmanial Activity of Neutral Gold(I) Complexes with N-heterocyclic Carbene Ligands Bearing Sulfur-Containing Side Arms, Ftouh S., Bourgeade-Delmas S., Belkadi M., Deraeve C., Hemmert C., Valentin A., Gornitzka H., *Organometallics* **2021**, 40, 1466–1473
doi.org/10.1021/acs.organomet.1c00113

Collaboration

Laboratoire PharmaDev, UMR 152 Université de Toulouse, IRD, UPS, France
Laboratoire LSPBE, Département de Génie Chimique, Faculté de Chimie, Université des Sciences et de la Technologie d'Oran Mohamed Boudiaf, Algeria.

Équipe

Chimie médicinale pour l'oncologie