

## L'imagerie TEP: de la recherche fondamentale en chimie du Fluor-18 à l'application clinique.

**J. Mercier**

*UCB Pharma, Global Chemistry, 1420 Braine l'Alleud, Belgique*

Courriel : [joel.mercier@ucb.com](mailto:joel.mercier@ucb.com)

Le taux d'échec des nouveaux candidats cliniques en neurosciences figure parmi les plus élevés, en particulier en Phase 3 et lorsqu'il s'agit d'une nouvelle cible biologique.<sup>[1]</sup> Afin de remédier à cette situation, l'industrie pharmaceutique doit développer des technologies robustes qui permettront d'améliorer la translation à l'homme et ainsi d'accélérer le processus de prise de décision.<sup>[2]</sup>

En neurosciences, seuls des outils non-invasifs tels que la Tomographie à Emission de Positrons (TEP) peuvent être utilisés. La TEP est une technique d'imagerie moléculaire qui repose sur l'utilisation de molécules radiomarquées (traceurs), typiquement au C-11 ou au F-18. Elle fournit des informations quantitatives au niveau moléculaire qui peuvent permettre d'améliorer la prise de décision à chaque stade du développement pré-clinique et clinique d'un candidat médicament.

Concevoir des traceurs TEP nécessite de développer des molécules ayant des propriétés spécifiques, parfois différentes de celles des candidats médicaments. S'il n'est déjà pas aisé de trouver des molécules qui possèdent les propriétés adéquates, le développement de traceurs TEP fait en plus face à la difficulté supplémentaire du nombre limité de méthodes permettant l'introduction d'un radioisotope, en particulier du F-18.<sup>[3]</sup> A cause de ces nombreux challenges, seulement une cinquantaine de nouveaux traceurs TEP ont été développés avec succès pour l'imagerie clinique chez l'homme et ce, malgré la multitude de nouveaux composés produits chaque année par l'industrie pharmaceutique.<sup>[4]</sup>

Durant cette conférence, nous verrons comment l'imagerie TEP peut améliorer le processus de développement de nouveaux médicaments en neurosciences et nous discuterons des requis nécessaires afin qu'une nouvelle méthode de fluoration au F-18 puisse être utilisée dans le contexte d'une étude clinique. La disponibilité de telles méthodes pourrait étendre l'espace chimique accessible au radiomarquage et permettre de la sorte d'améliorer l'impact de l'imagerie TEP clinique sur le développement de nouveaux candidats médicaments.

### References

[1] Kola, I.; Landis, J. *Nat Rev Drug Discov.* **2004**, *3* (8), 711-715.

[2] Goetghebeur, P.; Swartz, J. *J Psychopharmacol.* **2016**, *30* (7), 586-594.

[3] Preshlock, S.; Tredwell, M.; Gouverneur, V. *Chem Rev.* **2016**, *116* (2), 719-766.

[4] Van de Bittner, G. C.; Ricq, L.; Hooker, J. M. *Acc. Chem. Res.* **2014**, *47*, 3127-3134.