

^{223}Ra calix[4]areen-krooneterverbindings met teenligaampies as radiofarmaseutiese middels vir die behandeling van kanker

**Authors:**

J. Ackermann^{1,2}
 D. Jansen²
 N. Jarvis²
 A. Muller¹
 J-R. Zeevaart²

Affiliations:

¹Department of Chemistry,
 University of Johannesburg,
 South Africa

²Radiochemistry, Department
 of Applied Chemistry, Nesca,
 South African Nuclear Energy
 Corporation Limited,
 South Africa

Corresponding author:
 J. Ackermann,
 jolambyburgh@gmail.com

How to cite this abstract:
 Ackermann, J., Jansen, D.,
 Jarvis, N., Muller, A. &
 Zeevaart, J-R., 2016,
 ^{223}Ra calix[4]areen-
 krooneterverbindings met
 teenligaampies as
 radiofarmaseutiese middels
 vir die behandeling van
 kanker, *Suid-Afrikaanse
 Tydskrif vir Natuurwetenskap
 en Tegnologie* 35(1), a1406.
[http://dx.doi.org/10.4102/
 satnt.v35i1.1406](http://dx.doi.org/10.4102/

 satnt.v35i1.1406)

Copyright:
 © 2016. The Authors.
 Licensee: AOSIS. This work
 is licensed under the
 Creative Commons
 Attribution License.

Read online:

Scan this QR
 code with your
 smart phone or
 mobile device
 to read online.

^{223}Ra calix[4]arene-crown ether antibody conjugates as potential radiopharmaceuticals for the treatment of cancer. Radium possesses a self-directing capability to accumulate in bones for treatment of bone cancer. The treatment of other cancers requires a method that will shield the Ra from bone absorption and direct it towards specific cancers. This study investigates the probability of tailored Ra/Ba-calixarene systems for such purposes.

Radioimmunotherapy (RIT) is 'n metode van kankerbehandeling wat gebruik maak van 'n kankerspesifieke teenligaampie, gemerk met 'n gekonjugeerde radio-isotoop. Aangesien RIT geteiken is, kan 'n hoë dosis bestraling toegedien word op kancerselle terwyl normale selle gespaar word.

^{223}Ra het die gepaste radiochemiese en radiobiologiese eienskappe om effektiel te wees in die gebruik van geteikende radioterapie. In biologiese stelsels boots radium die gedrag van kalsium na en hoop dit dus in die skelet op. Dit is hierdie eienskap wat geleid het tot die gebruik van ^{223}Ra -dichloried in die behandeling van beenmetastases. Dit is onlangs as radioterapeutiese middel goedgekeur en word tans vervaardig onder die handelsnaam Xofigo (Kim & Brechbiel 2012). Radium se natuurlike affinititeit vir been is ook 'n nadeel, aangesien dit nie gebruik kan word in die behandeling van ander kankertipes nie. Die suksesvolle gebruik van radium in die behandeling van kanker verg, anders as met beenkanker, 'n metode wat radium teen die chemiese interaksies in die liggaam beskerm en op spesifieke kancerselle sal rig, en dus opeenhoping in die bene sal vermy.

Calix[4]areen-krooneterverbindings het die vermoë om radium selektief te bind in verskeie toepassings, byvoorbeeld in radioterapie en die ekstraksie van radium uit industriële afval (Chen *et al.* 1999; Van Leeuwen *et al.* 2005a, 2005b). Die doel van hierdie studie is om die stabiliteit van Ba/Ra-kompleksse met die calix[4]arene-krooneterverbindings onder fisiologiese toestande te toets en hierdie verbindings aan nuut ontwikkelde teenligaampies te koppel om spesifieke tipes kanker te teiken. Omrede alle isotope van radium radioaktief is, behels die aanvanklike studies die gebruik van barium om die hantering van die verbindings in standaardlaboratoriums te vergemaklik. Die chemiese eienskappe van barium en radium stem grootliks ooreen, en dus kan enige positiewe evalueringsresultate met barium oorgedra word na die kompleksingreaksies met radium.

Literatuurverwysings

- Chen, X., Ji, M., Fisher, D.R. & Wai, C.M., (1999), 'Ionizable calixarene-crown ethers with high selectivity for radium over light alkaline earth metal ions', *Inorganic chemistry*, 38(23), 5449–5452. <http://dx.doi.org/10.1021/ic990135>
- Kim, Y. & Brechbiel, M.W., (2012), 'An overview of targeted alpha therapy', *Tumor biology*, 33(3), 573–590. <http://dx.doi.org/10.1007/s13277-011-0286-y>
- Van Leeuwen, F.W., Beijleveld, H., Miermans, C.J., Huskens, J., Verboom, W. & Reinhoudt, D.N., (2005a), 'Ionizable (thia) calix[4]crowns as highly selective ^{226}Ra ionophores', *Analytical chemistry*, 77(14), 4611–4617. <http://dx.doi.org/10.1021/ac050524n>
- Van Leeuwen, F.W., Beijleveld, H., Velders, A.H., Huskens, J., Verboom, W. & Reinhoudt, D.N., (2005b), 'Thiacalix [4] arene derivatives as radium ionophores: A study on the requirements for Ra^{2+} extraction', *Organic & Biomolecular Chemistry*, 3(10), 1993–2001. <http://dx.doi.org/10.1039/b501587a>

Note: A selection of conference proceedings: Student Symposium in Science, 29–30 October 2015, University of the Free State, South Africa. Organising committee: Mr Rudi Pretorius and Ms Andrea Lombard (Department of Geography, University of South Africa); Dr Hertzog Bisset (South African Nuclear Energy Corporation (NECSA); Dr Ernie Langner and Prof Jeanet Conradie (Department of Chemistry, University of the Free State).