Juin 2021 - Numéro 15

https://www.biocis.universite-paris-saclay.fr/
https://twitter.com/biocis



Conception, Isolement, Synthèse

Chères BioClSiennes, chers BioClSiens,

Le premier semestre de l'année 2021 est jalonné par de nombreux faits marquants en termes succès obtenus par nos chercheurs et enseignants-chercheurs à des AAP, distinctions bien méritées (prix, promotions...), publications, l'organisation de manifestations (DIM1HEALTH, Journées de BioCIS). BioCIS peut être fier pour toutes ces réalisations qui continuent de donner une visibilité à nos thématiques de recherche.

> Bravo à tous pour ce dynamisme! Je vous souhaite à tous un bel été.

Le directeur, Mouad ALAMI

Bienvenue à

Doctorant

Axel LEBLOND, 1er janvier 2021 (Encadrants: Mehdi BENIDDIR et Erwan POUPON)

Doctorants invités

Suzanne DAIGNAN, 17 août 2020 (Encadrant : Alexandre MACIUK) Erick Caique SANTOS COSTA, 1er janvier 2021 - 31 décembre 2021 (Encadrant : Delphine JOSEPH)

Salemon AGNES, 18 janvier 2021-18 juin 2021 (Encadrant : Pierre

Yvette KOUADIO, 18 janvier 2021-18 juin 2021 (Encadrant: Pierre CHAMPY)

Post-doctorants

Boris LETRIBOT a été reconduit jusqu'en mai 2021 au sein de l'équipe CoSMIT

Lizeth Alicia BODERO, 1er janvier 2021, collaboration entre l'équipe Molécules fluorées & peptides d'intérêt thérapeutique FLUOPEPIT et l'équipe Chimie Biologie

Aurélie MAURAS, 1er janvier 2021, équipe Chimiothèrapie Antiparasitaire PARACHEM

Mansour Dolè KERIM, 1er mars 2021, équipe Chimie des Substances **Naturelles**

Léa RADAL, 1er mai 2021, équipe Molécules fluorées & peptides d'intérêt thérapeutique FLUOPEPIT

Alexis PINET, 1er juin 2021, équipe Chimie des Substances **Naturelles**

Personnels de soutien à la recherche

Estelle MESSE, IE, est prolongée jusqu'en juin 2021 au sein de l'équipe CoSMIT

Naomi DÉSIRÉE, CDD de 2 ans en tant que technicienne au sein de l'équipe Chimie des Substances Naturelles, 1er mars 2021

Aurore TOURVILLE, IE au sein de l'équipe Chimie des Substances Naturelles (mais basée à l'ICM), 1er avril 2021

> Camille TOCQUEVILLE, IE au sein de l'équipe CoSMIT (mais basée à l'Institut Gustave Roussy), 10 mai 2021

Professeur invité

Leandro SOTER DE MARIZ E MIRANDA, Université fédérale du Rio de Janeiro, Brésil, dans le cadre de l'appel d'offre «Fellowships in residence Program of the Institute of advanced

studies» de CY Cergy Paris Université, équipe Chimie Biologique, février-novembre 2021

Félicitations à

Morgane de Robichon pour son prix «Des Femmes et des Sciences» de la CY Alliance catégorie «doctorante», obtenu à l'issue de la finale locale de MT180, 15 mars 2021

Samir MESSAOUDI pour son prix Jean-Marie LEHN 2021 de la Division

Chimie Organique (DCO) de la SCF, 23 mars 2021.

Pierre CHAMPY, Emmanuelle DRÈGE, Sébastien POMEL et Jean-Christophe JULLIAN pour leur élection au conseil de l'UFR Pharmacie Paris-Saclay



Félicitations à Mouad ALAMI, promu DRCE et Benoit CROUSSE promu DR1

Participation des BioClSiens

Philippe LOISEAU a co-organisé le séminaire DIM1HEALTH «Infectiologie clinique et environnementale» de la Région Ile-de-France, 7 mai 2021.

HDR soutenue

Maud LARREGOLA a obtenu l'habilitation à recherches (HDR), 13 janvier 2021

Thèses soutenues

Victor TURPIN, 16 février 2021

Hypothèses de biosynthèse des alcaloïdes indolomonoterpéniques : résolution de mécanismes fondamentaux par la synthèse et par la modélisation

Sen WANG, 19 mars 2021

Synthèse et fonctionnalisation d'azobenzeènes : développement de sondes photocommutables

Hendrik RUSCHE, 12 avril 2021

Réponse immunitaire aberrante aux xénobiotiques déclenchant l'auto-immunité. La preuve de concept des anticorps contre les médicaments biologiques et contre la protéine adhésine d'Haemophilus influenzae de type non déterminable

Alexis PINET, 26 mai 2021

Synthèse et fonctionnalisation de 1,2-endoperoxydes 3,5-

disubstitués, vers la synthèse totale de la mycangimycine



ROYAL SOCIETY REVEW ARTICLE OF CHEMISTRY

Couverture graphique

Une nouvelle couverture graphique issue de BioCIS

An update on the use of sulfinate derivatives as versatile coupling partners in organic chemistry. Aziz J., Hamze A.; Org. Biomol. Chem., 2020, 18, 9136-9159

Quelques publications marquantes depuis décembre 2020

- 1. Diastereoselective Pd-Catalyzed Anomeric C(sp3)-H Activation: Synthesis of α -(Hetero)aryl C-Glycosides. Ghouilem J., Tran C., Grimblat N., Retailleau P., Alami M., Gandon V., Messaoudi S.; *ACS Catal.*, 2021, *11*, 1818-1826
- **2.** Cyclic bridged analogs of isoCA-4: Design, synthesis and biological evaluation. Pecnard S., Provot O., Levaique H., Bignon J., Askenatzis L., Saller F., Borgel D., Michallet S., Laisne M.-C., Lafanechère L., Alami M., Hamze A.; *Eur. J. Med. Chem.*, **2021**, *209*, 112873
- **3.** Glycosamine Derivatives through Metal-Catalyzed C-N Bond Formation on Protected and Unprotected 2-lodoglycals. Malinowski M., Banoun C., De Robichon M., Lubin-Germain N., Ferry A.; *Eur. J. Org. Chem.*, **2021**, DOI: 10.1002/ejoc.202001618
- **4.** Oxidative Ring Expansion of Cyclobutanols: Access to Functionalized 1,2-Dioxanes. Martín López M., Jamey N., Pinet A., Figadère B., Ferrié L.; *Org. Lett.*, **2021**, *23*, 1626-1631
- **5.** Fluorinated Triazole Foldamers: folded or extended conformational preferences. Laxio Arenas J., Xu Y., Milcent T., Van Heijenoort C., Giraud F., Ha-Duong T., Crousse B., Ongeri S.; *ChemPlusChem*, *special issue: Synthesis, Properties, and Applications of Foldamers*, **2021**, *86*, 241-251
- **6.** Peptidotriazolamers Inhibit AB(1-42) Oligomerization and Cross a Blood-Brain-Barrier Model. Tonali N., Hericks L., Schröder D. C., Kracker O., Krzemieniecki R., Kaffy J., Le Joncour V., Laakkonen P., Marion A., Ongeri S., Dodero V. I., Sewald N.; *ChemPlusChem, special issue: Synthesis, Properties, and Applications of Foldamers*, **2021**, *86*, 840-851
- **7.** Bioinspired Early Divergent Oxidative Cyclizations toward Pleiocarpamine, Talbotine, and Strictamine. Jarret M., Abou-Hamdan H., Kouklovsky C., Poupon E., Evanno L., Vincent G.; *Org. Lett.*, **2021**, *23*, 1335-1360
- **8.** *In vitro* identification of imidazo[1,2-a]pyrazine-based antileishmanial agents and evaluation of *L. major* casein kinase 1 inhibition. Bazin M.-A., Cojean S., Pagniez F., Bernadat G., Cavé C., Ourliac-Garnier I., Nourrisson M.-R., Morgado C., Picot C., Leclercq O., Baratte B., Robert T., Späth G.F., Rachidi N., Bacch S., Loiseau P.-M., Le Pape P., Marchand P.; *Eur. J. Med. Chem.*, **2021**, *210*, 112956
- **9.** Enantiopure 5-CF₃-Proline: Synthesis, Incorporation in Peptides, and Tuning of the Peptide Bond Geometry. Sanchez C. A., Gadais C., Chaume G., Girard S., Chelain E., Brigaud T.; *Org. Lett.*, **2021**, *23*, 382–387

Financements

Félicitations aux équipes lauréates pour le financement de leurs projets :



- **Projet DECIDE** financé par 80 Prime CNRS : Conception et réalisation d'un outil décisionnel pour l'analyse de données en masse en chimie des substances naturelles <u>Porteur</u> : Mehdi BENIDDIR (équipe Chimie des Substances Naturelles) en collaboration avec Meltem OZTURK (LAMSADE, Université Paris-Dauphine)

- **Projet** financé par la fondation **Pierre Potier** via l'INC. Synthèse totale, méthodologie et conception d'une chimiothèque à visée antivirale d'endoperoxydes sesterterpéniques : les Mycaperoxydes. Obtention d'un financement pour un post-doc de 12 mois : recrutement de Mansour DOLÉ KÉRIM

<u>Porteurs</u>: Laurent FERRIÉ et Laurent EVANNO (équipe Chimie des Substances naturelles)

- **Projet ALLCOV :** financé par l'ANR : Allergies aux vaccins COVID-19 porté par Luc de CHAISEMARTIN (INSERM UMR 996)

<u>Partenaire</u>: Delphine JOSEPH (équipe Chimie des Substances naturelles)

Une p'tite vidéo du projet européen ET-OPEN «NoPEST»

Équipe FLUOPEPIT

Le projet FET-OPEN «NoPEST», lancé en janvier 2019, vise à trouver des alternatives aux sels de cuivre



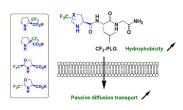
utilisés massivement contre les oomycètes, responsables en particulier du mildiou. Il implique cinq partenaires académiques (italien, français, espagnol, suédois et israélien) et un industriel italien. L'équipe FLUOPEPIT est en charge de la synthèse de peptidomimétiques dérivés d'aptamères peptidiques inhibant les enzymes biosynthétiques de la paroi cellulaire. https://eugloh-network.pageflow.io/no-pest

Peptides fluorés : hydrophobie et activité analgésique

Équipe de Chimie Biologique

En chimie médicinale, l'ajout d'atomes de fluor sur un principe actif a permis d'améliorer les propriétés pharmacologiques attendues d'un candidat médicament (augmentation de la stabilité

plasmatique, durée de demi-vie, interactions avec leurs sites de reconnaissance renforcées, ...). Dans l'équipe Chimie Biologique (CB) de Cergy, il a été montré que l'introduction d'un groupement CF₃ sur la proline du tripeptide PLG augmente son activité



analgésique.¹ L'augmentation d'hydrophobie du peptide fluoré a été mesurée par HPLC (indice d'hydrophobie) et l'augmentation du transport de ce peptide à travers la BHE par diffusion passive a été démontrée par la méthode PAMPA (Parallel Artificial Membrane Permeability Assay).² Des travaux sont actuellement en cours pour exemplifier ces effets.

1.(a) Jlalia I., Lensen N., Chaume G., Dzhambazova E., Astasidi L., Hadjiolova R., Bocheva A., Brigaud T.; *Eur. J. Med. Chem.,* 2013, 62, 122-129; (b) Bocheva A., Nocheva H., Jlalia I., Lensen N., Chaume G., Brigaud T.; *Med. Chem.,* 2013, 3, 206-209.

2. Oliver M., Gadais C., García-Pindado J., Teixidó M., Lensen N., Chaume G., Brigaud T.; RSC Adv., 2018, 8, 14597-14602.

À vos agendas!

Agenda

Web-meetings:

3 juin 2021 : Séminaire IRN, niveau europeen inpchem, coordonné par Mehdi BENIDDIR

10 juin 2021 : Journée BioCIS : «Chimie des petites molécules fluorées et des peptides/peptidomimétiques»

7-9 juillet 2021 : 56e Rencontres Internationales de Chimie Thérapeutique (RICT) 2021 : https://www.rict2021.org/

21 juillet 2021: Visite de nos futurs locaux de BPC

Congrès reportés :

-3º Colloque Français de Chimie du Fluor, prévu 17-20 mai 2021, est reporté au 16-19 mai 2022 à Forges-Leaux