

Homogene Hydrogenolyse mit molekularem Palladium-Katalysator

Neues Verfahren ermöglicht einfache Tritium Markierung und könnte Mehrwert bei der Arzneimittelkandidatenentwicklung bieten

Das radioaktive Wasserstoff-Isotop Tritium ^3H wird in der Medizinalchemie als Markierung verwendet, um den Verlauf eines Arzneimittels im menschlichen Körper sichtbar zu machen. Auch die Verstoffwechselung chemischer Substanzen im Körper kann durch Tritium markierte Moleküle beobachtet werden, so dass Chemiker das Verfahren gern für die Beurteilung und Testung von Arzneimittelkandidaten verwenden. Ein Team vom Max-Planck-Institut für Kohlenforschung in Mülheim an der Ruhr hat nun eine neue Methode entdeckt, komplexe kleine Moleküle gezielt mit Tritium zu markieren. In einem gemeinsamen Forschungsprojekt mit dem Pharmakonzern Roche haben sie Wege zum Einbau von Tritium in Pharmazeutika und ähnliche Moleküle untersucht, die für die Arzneimittelforschung wichtige Derivate darstellen.

Die Forschenden haben sich die besonderen Eigenschaften von Arylthianthrenium Salzen zu Nutze gemacht, die in der Abteilung von Tobias Ritte am Max-Planck-Institut für Kohlenforschung entwickelt worden waren und es ermöglichen, komplexe Moleküle direkt und vorhersagbar selektiv zu funktionalisieren. „Das Besondere an unserer neuen Arbeit ist die Reaktion von Arylpseudohalogeniden mit Wasserstoff, die erstmals durch einen homogenen Katalysator ermöglicht wurde“, erklärt Tobias Ritter. „Diese Reaktion war mit herkömmlichen Gruppen, die man in Pharmazeutika einführen konnte, bislang nicht bekannt. Bislang genutzte heterogene Katalysatoren zerstörten oft andere funktionelle Gruppen, die gerade in Pharmazeutika häufig zu finden sind“, so der Forschungsdirektor.

Darüber hinaus gibt es noch einen weiteren Mehrwert für Arzneimitteltester: Die Tritium Markierung der Arylthianthreniumsalze erfordert keine inerte Atmosphäre oder trockene Bedingungen und ist somit praktisch in der Anwendung. Sie könnte daher schnell von Forschungsabteilungen genutzt werden.

Originalveröffentlichung

Da Zhao, Roland Petzold, Jiyao Yan, Dieter Muri, Tobias Ritter
Tritiation of aryl thianthrenium salts with a molecular palladium catalyst.
Nature volume 600, pages 444–449 (2021)

[Source](#)

[DOI](#)