

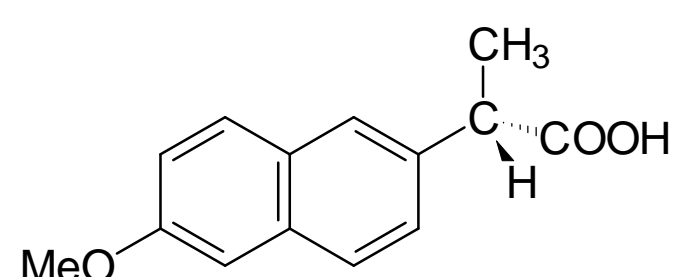
# Teilprojekt B2: Pharmazie-relevante enantioselektive Katalysen - von den Modellen zu den Wirkstoffen

**Projektleiter:** Prof. Dr. Henri Brunner, Institut für Anorganische Chemie, Universität Regensburg, D-93040 Regensburg  
**Industriepartner:** Schering AG, D-13342 Berlin

Heute werden reine Luft, reines Wasser und reine Nahrungsmittel gefordert. Morgen werden auch reine Arzneimittel verlangt werden.

Dabei bezieht sich das „rein“ bei Arzneimitteln auf die Rechts/Links-Problematik, denn auf Qualitätskontrolle wird bei Arzneistoffen von jeher großer Wert gelegt. Die Rechts/Links-Problematik bei Arzneimitteln ist mit der Contergan-Affäre in den frühen 60er Jahren in das Bewußtsein der Öffentlichkeit und des Gesetzgebers getreten. Seitdem spielt die Bild/Spiegelbild-Problematik in der chemischen und pharmazeutischen Industrie bei der Arzneimittelentwicklung eine große Rolle. Dazu sollen im Rahmen des Projekts Beiträge zu folgenden wichtigen Arzneimitteln erbracht werden.

## Naproxen



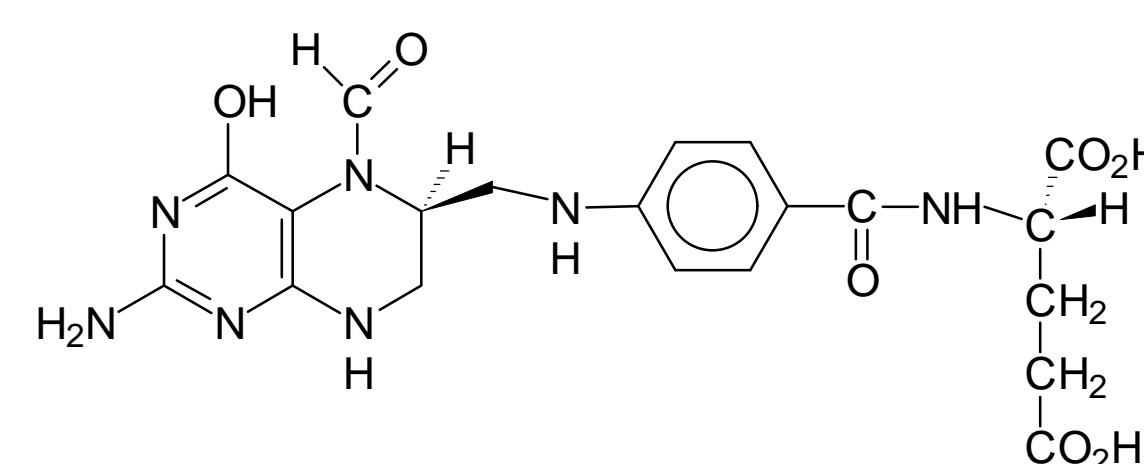
Antiphlogistikum, Antirheumatikum  
Marktwert: 250 Millionen DM/Jahr

Ziel: Synthese von enantiomerenreinem (S)-Naproxen

Weg: Decarboxylierung von 2-(6'-Methoxy-2'-naphthyl)-2-methylmalonsäure

Vorarbeiten: Decarboxylierung von 2-(6'-Methoxy-2'-naphthyl)-2-cyanpropionsäure mit Chinidin als Katalysator (34 % Enantiomerenüberschuß)

## Leucovorin



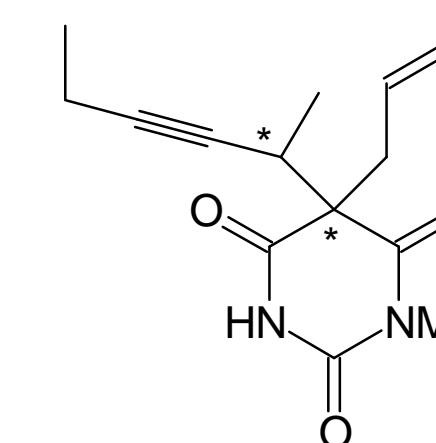
Antikrebsmittel (Knochen-, Darmkrebs)  
Marktwert: 300 Millionen DM/Jahr

Ziel: Synthese von enantiomerenreinem (6S,S)-Leucovorin

Weg: Stereoselektive Hydrierung von Folsäure, Formylierung

Vorarbeiten: Katalytische Hydrierung mit auf Kieselgel immobilisierten Rhodium-Phosphan-Katalysatoren

## Methohexital



Kurznarkotikum, Verwendung zur Einleitung von Millionen Narkosen/Jahr

Ziel: Synthese der reinen Isomeren von Methohexital (Brevimytal)  
Weg: Allylierung von 1-Methyl-5-(1'-methyl-pent-2'-inyl)barbitursäure

Vorarbeiten: Ausarbeitung der Standardreaktion mit Palladium-Phosphan-Katalysatoren (Isomerenanalytik)