

RADIOAKTIVE MARKIERUNG VON PROTOPORPHYRIN IX, HAEMATOPORPHYRIN UND MESO-TETRAPHENYLPORPHYRIN MIT [⁶⁸Ga]GaCl₃

P J Riß¹, F-P Montforts², F Rösch¹

¹Institut fuer Kernchemie, Universitaet Mainz, Mainz, Germany, 55128;

²Institut für Organische Chemie, Universität Bremen

Einführung:

Polypyrrrol-Makrozyklen besetzen eine essentielle Funktionen in der Biochemie des Lebens. So sind beispielsweise Magnesiumkomplexe der Bakteriochlorine (Chlorophyll) Grundlage der Photosynthese und somit Grundlage für natürliche Kohlehydrate. Vitamin B12 enthält Cobalamin, dessen Hauptbestandteil der Cobaltkomplex des Corrins darstellt. Im menschlichen Körper erfüllen Polypyrrrole verschiedenste Aufgaben, z.B. Cytochrom P 450, als Metall(Kupfer-)komplexe in den aktiven Zentren wichtiger Oxidoreduktasen oder als Sauerstoff-tragende Funktion des Haemoglobins.^[2]

Aufgrund ihrer sehr selektiven Aufnahme in Tumorgewebe erscheinen Radiogallium-markierte Polypyrrrole als geeignete Radiotracer für die Tumordiagnostik. In Zusammenarbeit mit Prof. Montforts vom Organisch Chemischen Institut der Universität Bremen sollen eine Reihe asymmetrischer Polypyrrrole, die bereits eine hohe selektive Aufnahme in Tumorgewebe gezeigt haben^[1,3], markiert und am Kleintier-PET-Scanner im Tiermodell untersucht werden.

Experimenteller Teil:

400 µl des Generatoreluats wurden in einem offenen PTFE-Reaktor unter Rühren zum Sieden erhitzt und bis zur Trockne eingeeengt. Der Rückstand wurde in 500 µl trockenem MeOH/Chloroform aufgenommen und auf 60°C

temperiert. Anschließend wurden 100 µl einer molaren Lösung der Verbindungen **1-3** in MeOH/Chloroform zugegeben. Mit Hilfe einer DC-Kapillare wurden in Abständen von 1, 3, 5, 7 und 10 Minuten Aliquote aus der Reaktionslösung entnommen und Dünnschicht-chromatographisch auf Kieselgel, Cellulose und Aluminiumoxid ausgewertet.

Ergebnisse und Diskussion:

1, **2** und **3** wurden als Vorarbeit für weiterführende Untersuchungen mit [⁶⁸Ga]GaCl₃ markiert. Dabei wurden sowohl geeignete Markierungsbedingungen als auch eine Radioanalytik mittels RadioDC etabliert.

Schlussfolgerung:

Die am Beispiel der Modellverbindungen entwickelten Bedingungen können nun auf komplexere Analogverbindungen übertragen werden. Dadurch können die neuen Polypyrrrole im Tiermodell evaluiert und auf ihre Eignung als Tumortracer untersucht werden.

Referenzen:

- [1] Kusch, Kirk; Toellner, Elke; Linche, Anngret; Montforts, Franz-Peter *Angewandte Chemie, International Edition* (1995), 34(7), 784-7
- [2] *Porphyrin Handbook* (2000)
- [3] Montforts, Franz-Peter; Glasenapp-Breiling, Martina *Progress in Heterocyclic Chemistry* (1998), 10, 1 ff.

