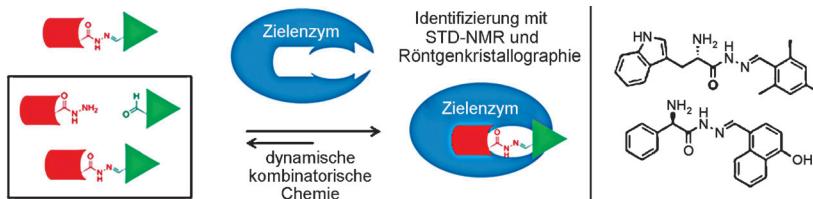


Enzymhemmstoffe

M. Mondal, N. Radeva, H. Köster, A. Park,  
C. Potamitis, M. Zervou, G. Klebe,\*  
A. K. H. Hirsch\* 3324–3328



Strukturbasiertes Design von  
Hemmstoffen der Aspartylprotease  
Endothiapepsin mittels dynamischer  
kombinatorischer Chemie

**Training am Objekt:** Die Kombination von strukturbasiertem De-novo-Design und dynamischer kombinatorischer Chemie wurde für die Identifizierung neuer acylhydrazonebasierter Hemmstoffe für die Aspartylprotease Endothiapepsin ange-

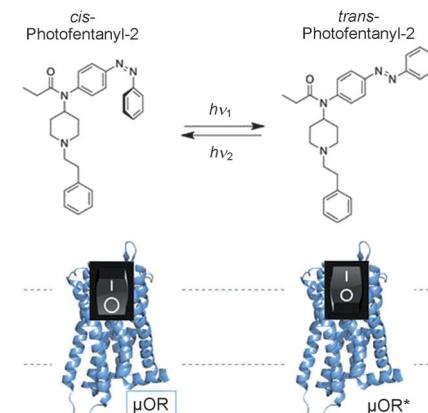
wendet.  $^1\text{H}$ -STD-NMR-Spektroskopie identifizierte die Binder aus den dynamischen kombinatorischen Bibliotheken. Die vorgeschlagenen Bindungsmodi der stärksten Hemmstoffe wurden durch Röntgenkristallographie bestätigt.

Photopharmakologie

M. Schönberger,  
D. Trauner\* 3329–3332

Ein photochromer Agonist für  
 $\mu$ -Opioidrezeptoren

**Es werde Schmerz:** Photofentanyl-2, eine photochrome Version des Analgetikums Fentanyl, ist ein potenter Agonist im Dunkeln (oder unter Bestrahlung mit blauem Licht) und verliert seine Aktivität unter Bestrahlung mit UV-Licht. Es kann dazu genutzt werden, den  $\mu$ -Opioidrezeptor optisch zu kontrollieren und damit einen „blinden“ G-Protein-gekoppelten Rezeptor (GPCR) in einen Photorezeptor umzuwandeln.



DOI: 10.1002/ange.201401087

## Rückblick: Vor 100 Jahren in der Angewandten Chemie

**K**autschuk ist nach den Worten von A. Holt aus Ludwigshafen ein Naturprodukt, „das in riesigen Mengen gewonnen und verbraucht wird und ohne welches unser heutiges Leben kaum mehr zu denken ist“, weshalb „kühn zugreifend“ die Synthese bereits versucht wurde, ohne die völlige theoretische Klärung seiner Konstitution abzuwarten. In seinem auf einem Vortrag basierenden Aufsatz findet man zwei Fließschemata für die Synthese von Butadien und Isopren sowie drei für die Wege von Butadien, Isopren und 2,3-Dimethylbutadien zu Kautschukderivaten. Doch trotz der sehr positiven Re-

sultate bei diesen Versuchen schließt er seinen Vortrag mit der Aussage: „So viel steht aber nach dem Gesagten fest, daß wir heute von dem gesteckten Ziel der künstlichen Darstellung des Kautschuks weiter entfernt sind, als bis vor kurzem angenommen werden durfte.“

Die restlichen zehn Seiten dieses Heftes nehmen „Gerichtliche und patentanwaltliche Entscheidungen, Verträge, Gesetze, Verordnungen, Bekanntmachungen, Statistiken usw. auf dem Gebiete des gewerblichen Rechtsschutzes im Jahre 2012“ ein, und der Text setzt

sich auch noch auf den ersten gut zehn Seiten des Folgehefts fort.

**Lesen Sie mehr in Heft 22/1914**

**O**hne Taschenrechner war so manche Rechnung erheblich zeitaufwendiger als heute. Darum kam der Beitrag von M. Wendriner für einen einfachen Weg, ein Gasvolumen in das unter Normalbedingungen umzurechnen, sicherlich bei vielen „Herren Fachgenossen, welche viel mit Gasberechnungen zu tun haben,“ gut an.

**Lesen Sie mehr in Heft 24/1914**