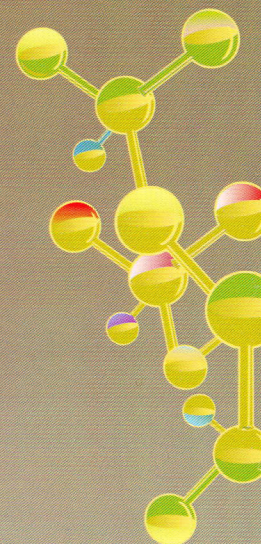
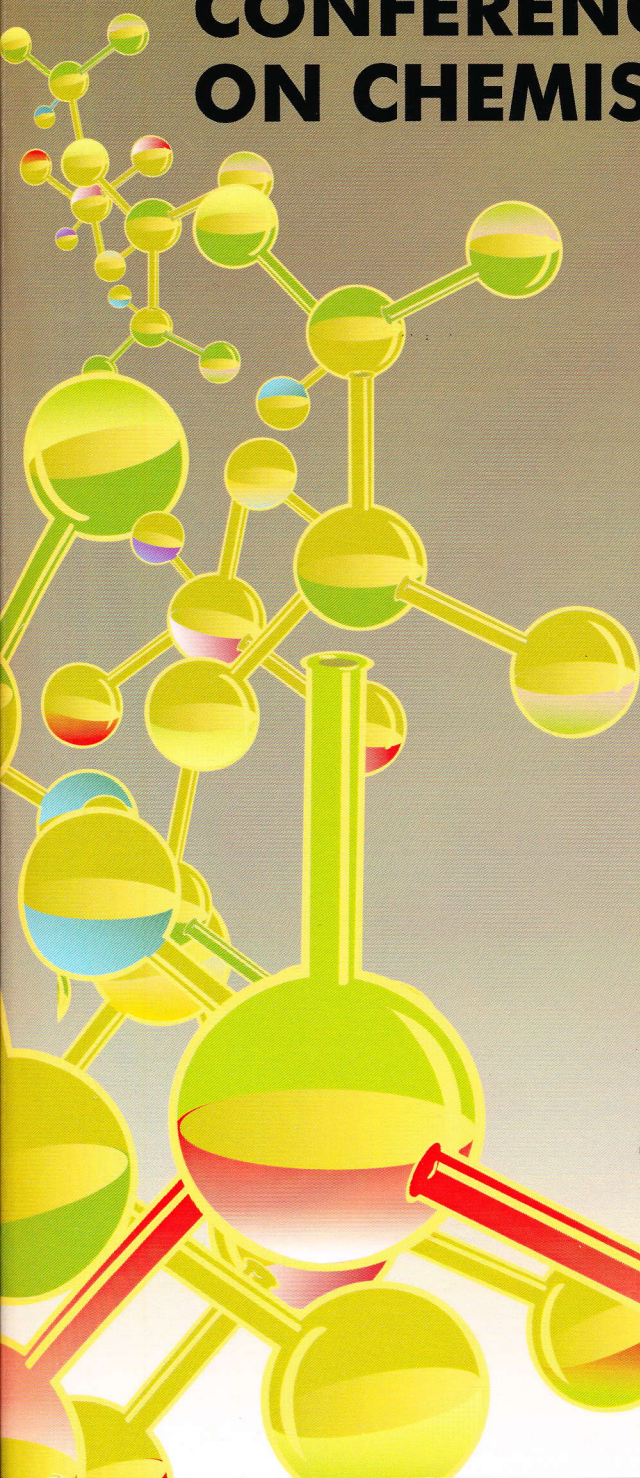


XX. NEMZETKÖZI VEGYÉSZKONFERENCIA

20TH INTERNATIONAL CONFERENCE ON CHEMISTRY

Kolozsvár, 2014. november 6–9.
Cluj-Napoca, November 6–9, 2014



Publisher / Kiadó

Hungarian Technical Scientific Society of Transylvania
Erdélyi Magyar Műszaki Tudományos Társaság (EMT)

Consultant editors / Lektorok

MAJDIK Kornélia
NOVÁK Lajos
KILÁR Ferenc
ZSUGA Miklós
DIBÓ Gábor
HÓRVÖLGYI Zoltán
KÉKEDY-NAGY László

Editor / Szerkesztő

MAJDIK Kornélia

Desktop Publishing / Nyomdai előkészítés

PROKOP Zoltán, Cluj-Napoca / Kolozsvár

Print / Nyomtatás

INCITATO Cluj-Napoca / Kolozsvár

Sponsors / Támogatók



Susținem
CLUJ-NAPOCA 2021
Capitală Culturală Europeană
oraș candidat

Proiect realizat cu sprijinul Primăriei și Consiliului Local Cluj-Napoca.
Proiectul susține Candidatura orașului Cluj-Napoca la titlul de Capitală Culturală Europeană.

A Kolozsvári Polgármesteri Hivatal és Városi Tanács által támogatott projekt.
Támogatjuk Kolozsvár Európai Kulturális Fővárosa 2021 jelöltségét.



Bethlen Gábor Alapkezelő Zrt. – Budapest
Bethlen Gábor Foundation – Budapest

Antitrombotikus hatású heparin-analóg pentaszacharid-szulfonsavak szintézise

Synthesis of Antithrombotic Sulfonic Acid Containing Heparin Analogue Pentasaccharides

Dr. HERCZEG Mihály¹, MEZŐ Erika², VARGA Eszter¹, ESZENYI Dániel²,
Dr. BORBÁS Anikó¹

¹DE-GYTK, Gyógyszerészi Kémiai Tanszék, 4010 Debrecen, Pf. 70.

²DE-TTK, Szerves kémiai Tanszék, 4032 Debrecen, Egyetem tér 1.

e-mail: herczeg.mihaly@science.unideb.hu, tel: +36-52-512-900/22896

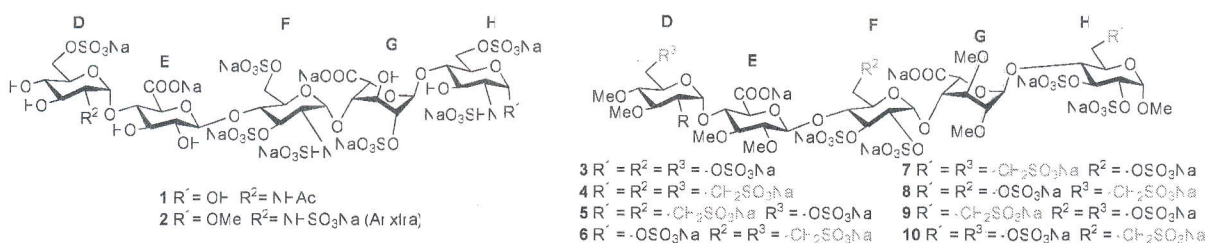
ABSTRACT

In the Department of Pharmaceutical Chemistry of University of Debrecen, we are dealing with the synthesis of new antithrombotic oligosaccharides based on the Idraparinux (3). Our goal is the preparation of anticoagulants by systematic replacement of the key sulfate-ester groups to sulfonatomethyl moieties. Idraparinux (3) and two sulfonic-acid analogues (4, 5), in which the 6-O-sulfate groups on the glucose units F, H and D, F, H are partially replaced with sulfonatomethyl moieties have been prepared until now. Based on the in vitro anticoagulant evaluation the pentasaccharide-disulfonic acid (5) is an outstanding anticoagulant agent, while the pentasaccharide-trisulfonic acid (4) has only a moderate anticoagulant activity. To get more information about the role of the sulfonic acid moieties in the anticoagulant action, synthesis of further sulfonatomethyl-containing pentasaccharides has been decided. Here, we present the synthesis of the new regioisomeric sulfonic-acids (6-10).

Keywords: heparin; anticoagulation; pentasaccharide; sulfonic acid; glycosylation

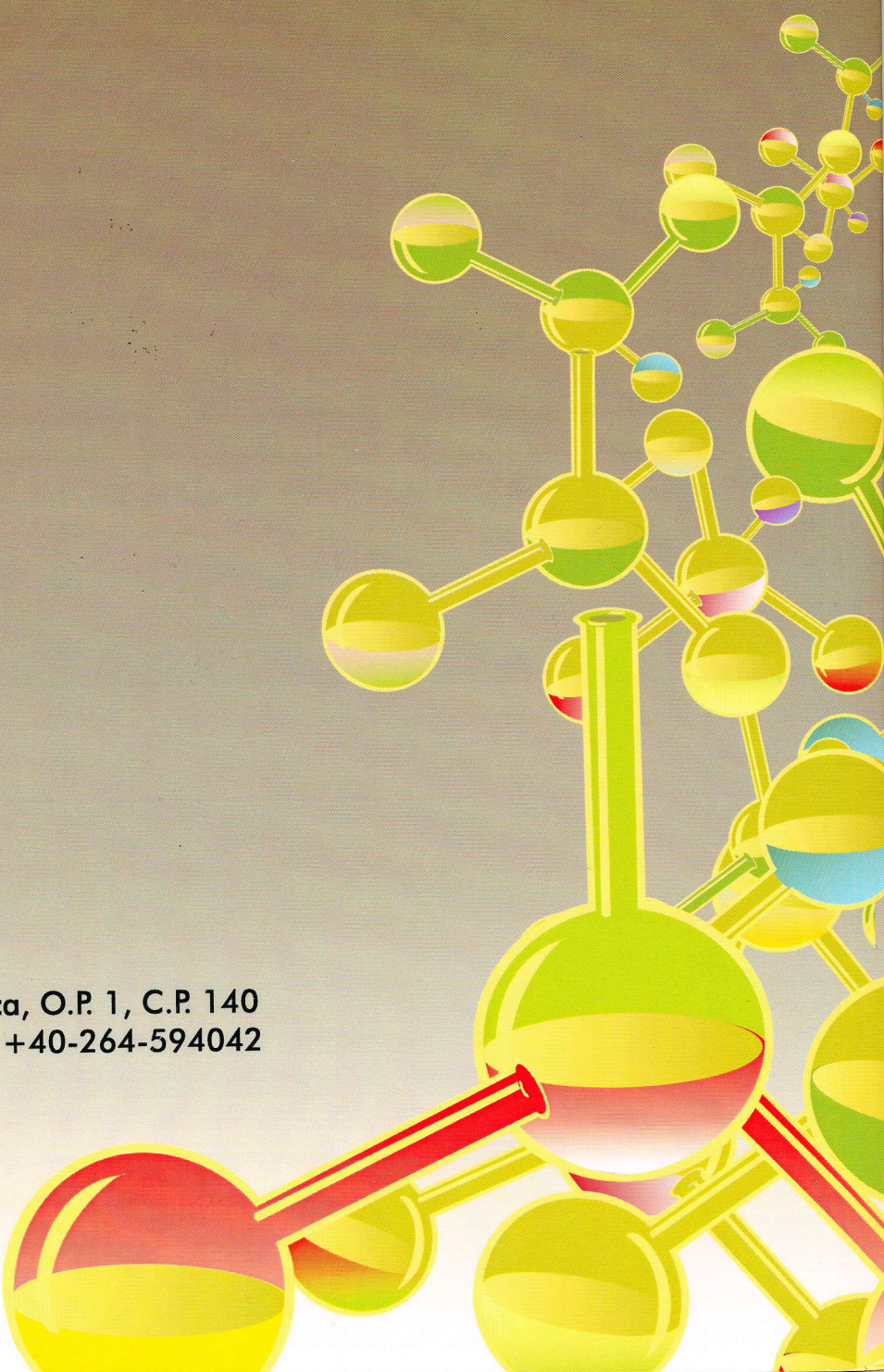
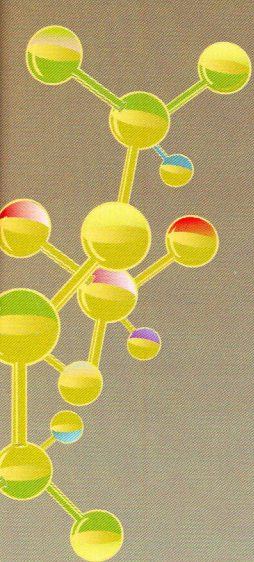
ÖSSZEFOGLALÓ

A Debreceni Egyetem Gyógyszerészi Kémiai Tanszékén az Idraparinux vezérmolekulából kiindulva új típusú antitrombotikumok szintézisét kutatjuk. Célunk az antikoaguláns hatásban kulcsszerepet játszó szulfátészterek szisztematikus cseréjével szulfonsav-típusú véralvadásgátlók előállítását. E kutatások keretében már előállítottuk az Idraparinuxot (3) és két szulfonsav mimetikumát (4, 5), amelyekben az F, H és a D, F, H glükóz egységek 6-O-szulfát-csoportjait metánszulfonsav csoportra cseréltük. In vitro véralvadásgátlási mérések alapján a pentaszacharid-diszulfonsav (5) kiemelkedő véralvadásgátló hatású szer, míg a pentaszacharid-triszulfonsav (4) csak közepes antikoaguláns hatással bír. A véralvadásgátlás értékekben lévő különbségek szerkezeti okainak meghatározása érdekében célul tűztük ki újabb 6-szulfonátometil-tartalmú pentaszacharidok szintézisét. Előadásunkban az újabb, regioizomer szulfonsavak (6-10) szintézisében elért eredményeinket mutatjuk be.



Kulcsszavak: heparin, antikoaguláció, pentaszacharid, szulfonsav, glikozilezés

This research was supported by the **European Union** and the **State of Hungary**, co-financed by the **European Social Fund** in the framework of TÁMOP 4.2.4. A/2-11-1-2012-0001⁶ National Excellence Program⁷.



✉: RO-400750 Cluj-Napoca, O.P. 1, C.P. 140
Tel./fax: +40-264-590825; +40-264-594042
E-mail: emt@emt.ro
<http://chem.emt.ro>

ISSN 1843-6293