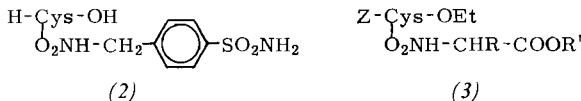
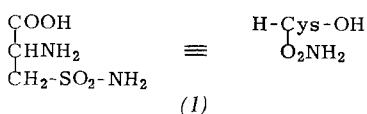


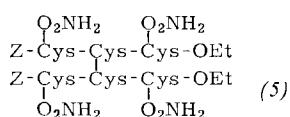
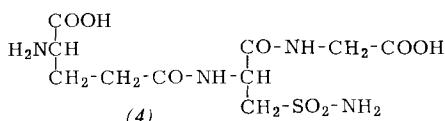
Synthese von modifizierten Aminosäuren und Peptiden mit antikoagulativer, bactericider oder vitamin-K-ähnlicher Wirkung^[**]

Von Boris Aleksiev^[*]

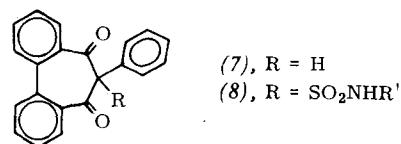
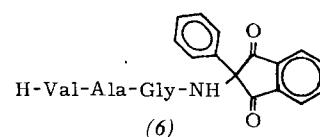
Die bekannte Synthese^[1] des Cysteinsäuresulfonamids (2-Amino-3-sulfamoyl-propionsäure) (1) wurde wesentlich verbessert^[2]. Durch Umsetzung der Sulfonylchloride mit Aminen konnten wir eine Reihe seiner Derivate synthetisieren^[3], darunter auch den bacteriostatisch wirkenden Marfanil-Abkömmling (2). Andere in der Sulfonamidgruppe substituierte Verbindungen (3) entstehen, wenn man Aminosäureester auf das geschützte Sulfonylchlorid einwirken läßt^[4].



Wir haben weiter festgestellt, daß sich das Azid- und Carbo-diimid-Versfahren auf Cysteinsäuresulfonamid (1) anwenden lassen^[4]; es konnten mehrere, dieses Sulfonamid enthaltende Peptide hergestellt werden. Auf diese Weise wurde z. B. erstmals das Sulfonamid-Derivat des Glutathions (4) und ein schwefelreiches Hexapeptid (5) synthetisiert.



Eine andere Reihe modifizierter Aminosäuren und Peptide erhielten wir mit 2-Amino-2-phenyl-1,3-indandion sowie 1,3-Dioxo-2-phenyl-2-indan-essigsäure. Nach dem Carbo-diimid-Versfahren wurde u. a. das modifizierte Tripeptid (6) mit sehr guter Ausbeute hergestellt^[6]. Für solche Verbindungen ist eine antikoagulative Wirkung zu erwarten. Im Gegensatz zum 2-Phenyl-1,3-indandion zeichneten sich sein aus Phenylsägsäure und Diphensäureanhydrid synthetisiertes^[7] Analogon (7) und dessen Derivate durch eine starke vitamin-K-ähnliche Wirkung aus, die der des Vitamins K₃ nahe ist^[8]. Über das Sulfonylchlorid^[9] haben



wir mehrere Derivate vom Typ (8) (auch Aminosäure-Derivate) dieses Analogons synthetisiert.

Die erhaltenen Verbindungen werden z. Z. auf ihre physiologische Wirkung untersucht.

[Vortrag im Deutschen Wollforschungsinstitut, am 16. Juli 1971 in Aachen] [VB 318]

[1] H. Heymann, T. Ginsberg, Z. Gulik, E. Konopka u. R. Mayer, J. Amer. Chem. Soc. 81, 5125 (1959); D. Ross, C. Skinner u. W. Shive, J. Org. Chem. 24, 1372 (1959); B. Bhide, J. Indian Chem. Soc. 36, 134 (1959).

[2] B. Aleksiev u. S. Stoev, Pharmazie 24, 305 (1969).

[3] B. Aleksiev u. S. Stoev, Pharmazie 26, 469 (1971).

[4] B. Aleksiev, S. Stoev u. S. Balkandžieva, C. R. Acad. Bulg. Sci. 24, 479 (1971).

[5] B. Aleksiev, S. Stoev u. M. Kostov, Pharmazie 26, 18 (1971); B. Aleksiev, P. Nišanjan, S. Stoev u. V. Doseva, Hoppe-Seylers Z. Physiol. Chem., im Druck.

[6] B. Aleksiev u. S. Minčev, noch unveröffentlicht.

[7] B. Aleksiev u. M. Milošev, Chem. Ber. 100, 701 (1967).

[8] M. Milošev, M. Nikolova, O. Angelova u. B. Aleksiev, Pharmazie, im Druck.

[9] M. Milošev u. B. Aleksiev, Monatsh. Chem. 101, 1658 (1970).

Radiochemische Untersuchungen an Edelgasverbindungen

Von J. P. Adloff^[*]

Die Edelgase nehmen einen wichtigen Platz in der Radiochemie ein. Zahlreiche Kernreaktionen führen zu Edelgasnukliden, besonders die Kernspaltung. Spaltxenon und Spaltkrypton werden in steigendem Maß in Aufarbeitungsanlagen für Kernbrennstoff gewonnen.

Die chemische Reaktivität der Edelgase steigt mit der Ordnungszahl des Elementes, doch kennt man bis jetzt beim Xenon die meisten Verbindungen. Untersuchungen an Radonverbindungen können nur mit Indikatormengen des Elementes ausgeführt werden, da das langlebigste Isotop, ²²²Rn, mit einer Halbwertszeit von nur 3.8 Tagen zerfällt. Radondifluorid ist in Halogenfluoriden und in flüssigem Fluorwasserstoff löslich. Radondifluoridlösungen werden auch durch spontane Reaktion von Radon mit FCl, F₃Cl, F₅Br usw. erhalten; je nach Lösungsmittel fungiert Radon als Kation oder Anion. Radonverbindungen haben einen viel ausgeprägteren Ionencharakter als die entsprechenden Xenonverbindungen.

[*] Prof. Dr. J. P. Adloff
Laboratoire de Chimie Nucléaire, Université de Strasbourg
F-67 Strasbourg 3, B. P. 20 CRO

[*] Dr. B. Aleksiev
Höheres chemisch-technologisches Institut, Sofia 56 (Bulgarien)
z. Z. Deutsches Wollforschungsinstitut
51 Aachen, Veltmanplatz 8

[**] Abkürzungen: Et = Äthyl, Z = Benzyloxycarbonyl.