



(B) (11) KUULUTUSJULKAISU
UTLAGGNINGSSKRIFT

84833

C (43) Patenttiyhdistys
Patentti- ja rekisterihallitus
15.10.91

(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5

C 07H 15/12

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(21) Patenttihakemus - Patentansökning	862619
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	18.06.86
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag	18.06.86
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	21.12.86
(44) Nähtävääksipanon ja kuul.julkaisun pvm. - Ansökan utlagd och utl.skriften publicerad	15.10.91
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
20.06.85 DE 3521994 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen, BRD, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Lockhoff, Oswald, Morgengraben 14, Köln, BRD, (DE)
2. Hayauchi, Yutaka, Gustav-Freytag-Strasse 4, Leverkusen, BRD, (DE)
3. Stadler, Peter, Am Ideck 2, Haan, BRD, (DE)
4. Stünkel, Klaus Georg, Am Eckbusch 55, Wuppertal, BRD, (DE)
5. Strelssle, Gert, Gellertweg 22, Wuppertal, BRD, (DE)
6. Paessens, Arnold, Stresemannstrasse 56, Haan, BRD, (DE)
7. Klimetzek, Volker, Kant Strasse 64, Velbert-Toenischeide, BRD, (DE)
8. Zeller, Hans-Joachim, Elsbecker Strasse 46, Velbert, BRD, (DE)
9. Metzger, Karl Georg, Pahlkestrasse 75, Wuppertal, BRD, (DE)
10. Kroll, Hein-Peter, Pahlkestrasse 96, Wuppertal, BRD, (DE)
11. Brunner, Helmut, Waldstrasse 10, Wuppertal, BRD, (DE)
12. Schaller, Klaus, Am Sonnenschein 38, Wuppertal, BRD, (DE)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

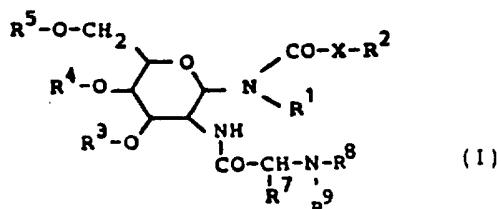
Menetelmä uusien terapeuttisesti käyttökelpoisten N-glykosyylamidien,
N-glykosyylkarbamidien ja N-glykosyylkarbamaattien valmistamiseksi
Förfarande för framställning av nya terapeutiskt användbara N-glykosylamider,
N-glykosylkarbamider och N-glykosylkarbamaater

(56) Viitejulkaisut - Anförda publikationer

FI C 75172 (C 07H 15/12),
Carbohydrate Research, vol. 5 (1967), Yoshimura, J., Hashimoto, H., Ando, H.,
Studies on 2-amino-2-deoxy-D-glucose derivatives. Part XV., p. 82-92,
Chemical Abstracts, vol. 89 (1978), 129847y: Carbohydr. Res., vol. 65 (1978) nro 2, p. 307-310

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee uusia N-glykosyylamideja, N-glykosyylkarbamideja
ja N-glykosyylkarbamaatteja, joilla on yleinen kaava I

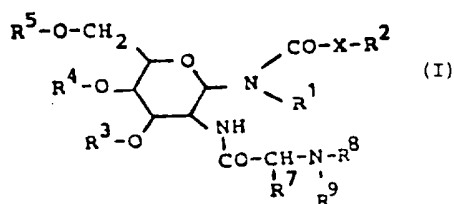


jossa R¹ on H tai alkyylili; X on -CH₂-, -O- tai -NH-; R² on H
tai alkyylili; R³, R⁴ ja R⁵ ovat kukin H tai asyyli;
R⁷ tarkoittaa vetyä, C₁-C₇-alkyyliä; hydroksimetyyliä, 1-hyd-
roksietyyliä, merkaptometyyliä, 2-(metyylitio)-etyyliä, 3-ami-
nopropyyliä, 3-ureidopropyyliä, 3-guanidyylipropyyliä, 4-amino-
butyyliä, karboksietyyliä, karbamoyylimetyyliä, 2-karboksi-
etyyliä, 2-karbamoylietyyliä, bentsyyliä, 4-hydroksibentsyyliä,

84833

3-indolyylimetyyliä tai 4-imidatsolyylimetyyliä; R^8 on H tai CH_3 ja R^9 tarkoittaa vetyä, metyyliä, asetyyliä, bentsoyyliä, triklooriasetyyliä, trifluoriasetyyliä, metoksikarbonyyliä, t-butylylioksikarbonyyliä tai bentsyylioksikarbonyyliä ja R^7 ja R^8 voivat yhdessä tarkoittaa tähdettä $-CH_2-CH_2-CH_2-$, myös L- tai R-muodossa tai mahdollisesti sisäisen, farmaseuttisesti käyttökelpoisen suolansa muodossa, sekä niiden valmistusta. Kaavan I mukaiset yhdisteet ovat käyttökelpoisia lääkeaineina.

Uppfinningen avser nya N-glykosylamider, N-glykosylkarbamider och N-glykosylkarbamater med den allmänna formeln I,



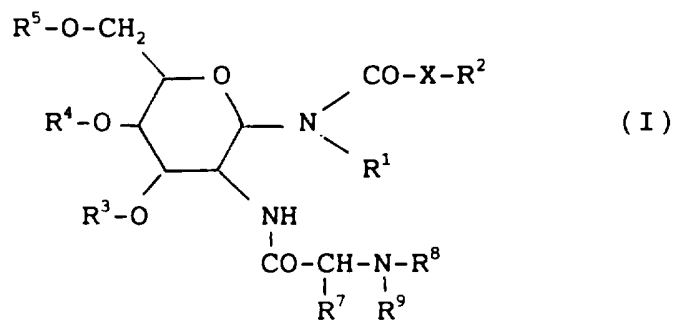
vari R^1 är H eller alkyl; X är $-CH_2-$, $-O-$ eller $-NH-$; R^2 är H eller alkyl; R^3 , R^4 och R^5 är var och en H eller acyl; R^7 betecknar väte, C_{1-7} -alkyl; hydroximetyl, 1-hydroxietyl, merkaptometyl, 2-(metyltio)-etyl, 3-aminopropyl, 3-ureidopropyl, 3-guanidylpropyl, 4-aminobutyl, karboximetyl, karbamoylmetyl, 2-karboxietyl, 2-karbamoyletyl, bensyl, 4-hydroxibensyl, 3-indolylmetyl eller 4-imidazolylmetyl; R^8 är H eller CH_3 och R^9 betecknar väte, metyl, acetyl, bensoyl, trikloracetyl, trifluoracetyl, metoxikarbonyl, t-butyloxikarbonyl eller bentsyloxikarbonyl, och R^7 och R^8 kan tillsammans beteckna resten $-CH_2-CH_2-CH_2-$, även i L- eller R-form eller eventuellt i inre, farmaceutiskt användbar saltform. Föreningarna med formeln I är användbara som läkemedel.

Menetelmä uusien terapeuttisesti käyttökelpoisten N-glykosyyliamidien, N-glykosyylikarbamidien ja N-glykosyylikarbamaattien valmistamiseksi

5 Keksintö koskee menetelmää uusien kaavan I mukaisen N-glykosyyliamidien, N-glykosyylikarbamidien ja N-glykosyylikarbamaattien valmistamiseksi.

Uusilla yhdisteillä on kaava I

10



15

jossa

17 R^1 tarkoittaa tyydytettyä tai yksinkertaisesti tai moninkertaisesti tyydyttämätöntä alkyylitähdettä, jossa on
20 10 -20 hiiliatomia;

X on $-CH_2-$, $-O-$ tai $-NH-$;

22 R^2 tarkoittaa vetyä tai tyydytettyä tai yksinkertaisesti tai moninkertaisesti tyydyttämätöntä alkyylitähdettä,
25 jossa on 10 - 20 hiiliatomia;

R^3 , R^4 ja R^5 tarkoittavat toisistaan riippumattomasti vetyä tai asyyliä $-CO-R^6$, jolloin R^6 tarkoittaa alkyylitähdettä, jossa on enintään 10 hiiliatomia;

27 R^7 tarkoittaa vetyä, C_1 - C_7 -alkyyliä, hydroksimetyyliä, 1-hydroksietyyliä, merkaptometyyliä, 2-(metyylitio)etyyliä, 3-aminopropyliä, 3-ureidopropyliä, 3-guanidyylipropyliä, 4-aminobutyliä, karboksietyyliä, karbamoyylimetyyliä, 2-karboksietyyliä, 2-karbamoylietyyliä, bentsyyliä, 4-hydroksibentsyyliä, 3-indolyylimetyyliä tai 4-imidatsolyylimetyyliä;
30

35

R^8 tarkoittaa vetyä tai metyyliä ja

R⁹ tarkoittaa vetyä, metyyliä, asetyyliä, bentsoyyliä, triklooriasetyyliä, trifluoriasetyyliä, metoksykarbonyyliä, t-butyylimoksykarbonyyliä tai bentsoylimoksykarbonyyliä, ja

5 R⁸ ja R⁹ voivat yhdessä tarkoittaa tähdettä -CH₂-CH₂-CH₂-.

Stereokemia kiraalikeskuksen kohdalla α-aminohapossa on joko L tai R.

R¹ tarkoittaa edullisesti suoraketjuista tai haara-
10 rautunutta, tyydytettyä tai tyydyttämätöntä alkyyli-
tähdeettä, jossa on enintään 20 hiiliatomia, erityisen edullisesti 10 - 20 hiiliatomia.

Esimerkkejä suoraketjuisista, tyydytetyistä alkyyli-
litähteistä R¹ ovat metyyli, etyyli, propyyli, butyyli,
15 pentyyli, heksyyli, heptyyli, oktyyli, nonyyli, dekyyli,
undekyyli, dodekyyli, tridekyyli, tetradekyyli, pentadekyyli,
heksadekyyli, heptadekyyli, oktadekyyli, nonadekyyli,
eikosyyli, dokosyyli, tetrakosyyli, heksakosyyli, ok-
takosyyli ja triakontyyli.

Tyydyttämättömiä tähteitä R¹ ovat esimerkiksi vi-
20 nyyli, allyyli, 2-butenyyli, 3-butenyyli, 2-heksenyyli,
3-heksenyyli, 4-heksenyyli, 5-heksenyyli, 2-oktenyyli,
4-oktenyyli, 6-oktenyyli, 7-oktenyyli, 2-dekenyyli, 4-
dekenyyli, 6-dekenyyli, 8-dekenyyli, 9-dekenyyli, 2-do-
dekenyyli, 6-dodekenyyli, 10-dodekenyyli, 11-dodekenyyli,
25 4-tetradekenyyli, 6-tetradekenyyli, 10-tetradekenyyli,
6-heksadekenyyli, 8 heksadekenyyli, 10-heksadekenyyli,
12-heksadekenyyli, 6-heptadekenyyli, 8-heptadekenyyli,
10-heptadekenyyli, 6-oktadekenyyli, 8-oktadekenyyli, 10-
oktadekenyyli, 8,11-heptadekaanidienyyli tai 8,11,14-hep-
30 tadekaanitrienyyli.

Tyydyttämättömistä tähteistä ovat yleensä pitempi-
ketjuiset edullisia, erityisesti yksinkertaisesti tai
kaksinkertaisesti tyydyttämättömät, joissa on 10 - 20
hiiliatomia.

35 Tähteet R¹ voivat olla myös haarauneita, tyydy-
tettyjä tai yksinkertaisesti tai kaksinkertaisesti tyy-

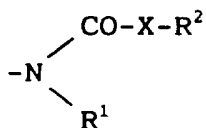
dyttämättömiä alkyylitähteitä. Tällöin ovat alkyyli- tai alkenyyliketjun alkyylisubstituentteina edullisia sellaiset alkyylitähteet, joissa on enintään 12 hiiliatomia.

Esimerkkejä haarautuneista alkyylitähteistä R^1 ovat 2-metyylidodekyyli, 4-metyylidodekyyli, 6-metyylidodekyyli, 8-metyylidodekyyli, 11-metyylidodekyyli, 4-etyylidodekyyli, 8-etyylidodekyyli, 2-metyylitetradekyyli, 4-metyylitetradekyyli, 10-metyylitetradekyyli, 13-metyylitetradekyyli, 2-metyyliheksadekyyli, 4-metyyliheksadekyyli, 8-metyyliheksadekyyli, 15-metyyliheksadekyyli, 1-metyylioktadekyyli, 2-metyylioktadekyyli, 4-metyylioktadekyyli, 10-metyylioktadekyyli, 16-metyylioktadekyyli, 17-metyylioktadekyyli, 1-butyylidodekyyli, 1-dodekyylidodekyyli, 1-dekyylitetradekyyli ja 1-dodekyyliheksadekyyli.

R^2 tarkoittaa edullisesti vetyä tai suoraketjuista tai haarautunutta, tyydytettyä tai tyydyttämätöntä alkyylitähdettä, jossa on enintään 20 hiiliatomia, erityisen edullisesti 8 - 20 hiiliatomia.

Esimerkkejä tähteistä R^2 ovat R^1 :n yhteydessä mainitut tähteet.

Kuten kaavasta I on nähtävissä, on keksinnön mukaisesti valmistettujen yhdisteiden perustana substituoitu 2-amino-2-desoksi-heksoosi. Nämä sokerit ovat aina liittyneet anomeerisen hiiliatomin, C-1:n, välityksellä N-glykosidisesti asyyliamido-, karbamido- tai alkoksikarbonyyliamidoryhmään



jossa symboleilla R^1 , R^2 ja X on edellä mainitut merkitykset.

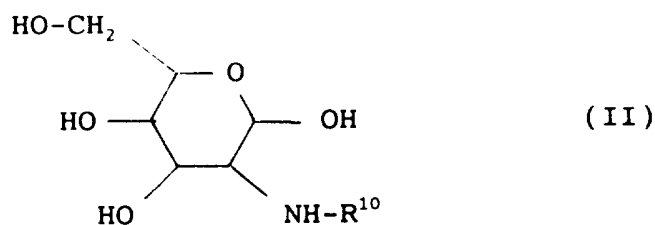
Edullisia aminosokereita keksinnön mukaisesti valmistetuissa yhdisteissä, joilla on kaava I, ovat 2-amino-2-desoksi-D-glukoosi ja 2-amino-2-desoksi-D-galaktoosi.

Keksinnön mukaisesti valmistetuissa yhdisteissä, joilla on kaava I, mainitun aminosokerin 2-aminoryhmä on liittynyt amidisesti α -aminohapon kanssa tai α -aminohappojohdannaisen kanssa.

5 Edullisia aminohappoja ovat luonnon L-aminohapot, kuten glysiini, sarkosiini, hippuurihappo, alaniini, valiini, leusiini, isoleusiini, seriini, treoniini, kysteiini, metioniini, ornitiini, sitrulliini, arginiini, asparagiinihappo, asparagiini, glutamiinihappo, glutamiini, 10 fenyylialaniini, tyrosiini, proliini, tryptofaani ja histidiini. Aminosokerissa voi toimia substituentteina kuitenkin myös D-aminohappoja, kuten D-alaniini, tai aminokarboksyylihappoja, kuten α -aminovoihappo, α -aminovalerianahappo, α -aminokapronihappo tai α -aminoheptaanihappo, 15 sekä D- että myös L-muodossa.

Valmistettaessa kaavan I mukaisia yhdisteitä lähdetään aminoryhmän kohdalla suojatusta 2-amino-2-desoksiglykopyranoosijohdannaisesta II

20



25

jossa R^{10} tarkoittaa aminoryhmien suojaksi tarkoitettua, peptidien synteesistä tunnettua ja mahdollisesti selektiivisesti lohkaistavissa olevaa suojaryhmää.

30

Sopivia suojaryhmiä ovat esim. asyyliryhmät, kuten trifluoriasetyyli- tai triklooriasetyyli-, o-nitrofenyyli- tai p-nitrofenyyli-, 2,4-dinitrofenyyli- tai mahdollisesti substituoitu alempi alkoksikarbonyyli-, kuten metoksikarbonyyli-, t-butyylisulfonyyli-, bentsyylioksidikarbonyyli-, p-metoksibentsyylioksidikarbonyyli- tai 35 2,2,2-trikloorietyylioksidikarbonyyliryhmät, siis yleensä sellaiset ryhmät, jotka ovat jälleen lohkaistavissa se-

lektiivisesti peptideiksi. Sopivat N-suojatut aminosokeri-
 oosijohdannaiset II ovat periaatteessa tunnettuja [esim.
 M. Bergmann ja L. Zervas: Ber. 64, s. 975 (1931); D. Hor-
 ton: J. Org. Chem. 29, s. 1776 (1964); P. H. Gross ja R.
 5 W. Jeanloz: J. Org. Chem. 32, s. 2759 (1967); M. L. Wolf-
 rom ja H. B. Bhat: J. Org. Chem. 32, s. 1821 (1967);
 yleisesti J. F. M. McOmie (Hrsg). Prot. Groups. Org.
 Chem., Plenum Press (1973); Geiger: "The Peptides" vol.
 3, ss. 1 - 99 (1981) Academic Press; ja näissä viitattu
 10 kirjallisuus].

Erityisen edullisia aminosuojaryhmiä kaavan I mu-
 kaisten yhdisteiden valmistamiseksi ovat BOC-ryhmä (tert-
 butyylioksidikarbonyyli) tai Z-ryhmä (bentsyylioksidikarbo-
 nyyli).

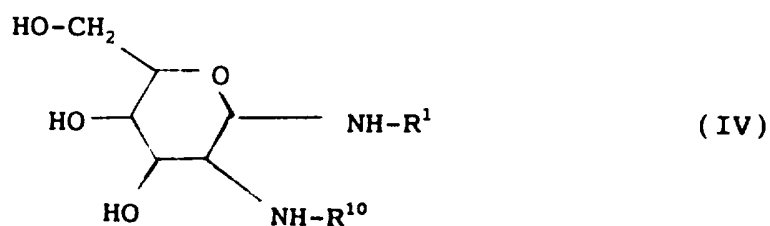
15 Suojatut aminosokerijohdannaiset II saatetaan en-
 simmäisessä reaktiovaiheessa reagoimaan amiinien III
 kanssa



20

jossa R^1 tarkoittaa samaa kuin edellä, glykosyyliamiini-
 neiksi IV

25

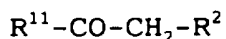


30

Tällaiset glykosyyliamiinien valmistukset ovat pe-
 riaatteessa tunnettuja [Ellis: Advances in Carbohydrate
 Chemistry 10, s. 95 (1955)], ja niitä on erityisesti se-
 lostettu DE-hakemusjulkaisussa 3 213 650.

35

Toisessa reaktiovaiheessa saatetaan glykosyyli-
 amiinit IV reagoimaan sopivien karboksyylihappojohdan-
 naisten V, kuten karboksyylihappohalogenidien tai karbok-
 syylihapoanhydridien kanssa



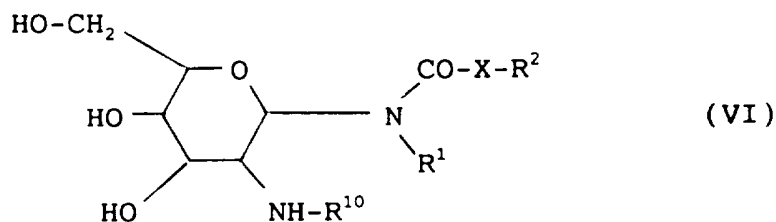
(V)

jossa

5 R^2 tarkoittaa samaa kuin edellä ja R^{11} tarkoittaa halogeenia, kuten esim. klooria tai tähdettä $-O-CO-R^2$, jossa R^2 tarkoittaa samaa kuin edellä, tai $-O-CO-O$ -alempi alkyyliä.

Tällä tavalla saadaan glykosyyliamideja VI

10



15

jossa

R^1 , R^2 ja R^{10} tarkoittavat samaa kuin edellä ja X tarkoittaa tähdettä $-CH_2-$.

20

Tällaisten N-asylointien olosuhteet on esitetty DE-hakemusjulkaisussa 3 213 650.

Eräässä edullisessa suoritusmuodossa saatetaan kaavan IV mukaiset glykosyyliamiinit reagoimaan yhden tai kahden ekvivalentin kanssa karboksyylihappokloridia V tai yhden tai kahden ekvivalentin kanssa seka-anhydridiä, joka on saatu kyseisestä karboksyylihapposta $R^2-CH_2-CO_2H$ ja kloorimuurahaishappoetyyliesteristä tai kloorimuurahaishappoisobutyryliesteristä orgaanisen apuamäksen läsnäollessa kirjallisuuden tuntemilla menetelmillä glykosyyliamidiksi VI, jossa X on $-CH_2-$.

30

Työskentely suoritetaan orgaanisissa tai vesipi-toisissa orgaanisissa liuottimissa 0 - 50 °C:ssa, mahdollisesti epäorgaanisen tai orgaanisen emäksen läsnäollessa. Sopivia laimennusaineita ovat alkoholit, kuten metanoli, etanoli, 1-propanoli tai 2-propanoli, tai eetterit, kuten dietyylietteri, tetrahydrofuraani tai 1,4-dioksa-

35

ni, tai halogeenihiilivedyt, kuten dikloorimetaani, trikloorimetaani, 1,2-dikloorietaani, tai N,N-dimetyyliformamidi.

5 Jos ensimmäisessä vaiheessa saadut glykosyyliamiinit saatetaan reagoimaan halogeenimuurahaishappoesterien VII kanssa



10 jossa R^{12} tarkoittaa halogeenia, esim. klooria tai bromia ja R^2 tarkoittaa samaa kuin edellä, saadaan glykosyylikarbamaatteja VI, jolloin symboleilla R^1 , R^2 ja R^{10} on edellä esitetyt merkitykset ja X tarkoittaa happea.

15 Eräässä edullisessa suoritusmuodossa saatetaan kaavan IV mukaiset glykosyyliamiinit reagoimaan yhden tai kahden ekvivalentin kanssa kloorihiilihappoesteriä VII glykosyylikarbamaatiksi. Työskentely suoritetaan edullisesti orgaanisissa tai vesipitoisissa orgaanisissa liuottimissa 0 - 50 °C:n lämpötilassa, erityisen edullisesti
20 kuitenkin huoneen lämpötilassa. Sopivia liuottimia ovat alkoholit, eetterit, halogeenihiilivedyt tai dimetyyliformamidi, sellaisina kuin ne edellä on mainittu.

Jos ensimmäisessä vaiheessa saadut glykosyyliamiinit IV saatetaan reagoimaan yhden tai kahden ekvivalentin
25 kanssa orgaanista isosyanaattia VIII



30 jossa R^2 tarkoittaa samaa kuin edellä, saadaan kaavan VI mukaisia glykosyylikarbamideja, jolloin symboleilla R^1 , R^2 ja R^{10} on edellä mainitut merkitykset ja X tarkoittaa tähdettä -NH-.

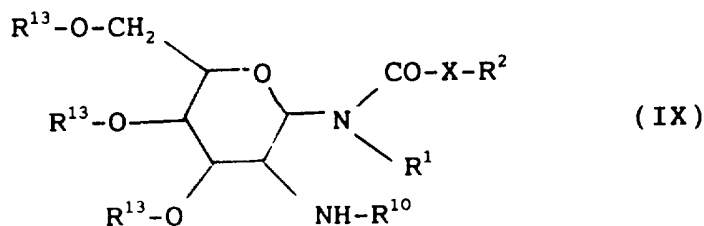
35 Tämä asylointireaktio suoritetaan edellä mainituissa olosuhteissa edullisesti orgaanisissa liuottimissa, jolloin reaktiolämpötilat ovat välillä -20 - 60 °C, edullisesti välillä 0 - 25 °C. Sopivia liuottimia ovat

edellä mainitut alkoholit, eetterit, halogeenihiilivedyt tai dimetyyliformamidi.

Tällä tavalla saadut glykosyyliamidit (VI; X on -CH₂-), glykosyylikarbamaatit (VI; X on -O-) tai glykosyylikarbamidit (VI; X on -NH-) eristetään sinänsä tunnetuilla menetelmillä kiteisinä tai amorfisina aineina ja tarvittaessa puhdistetaan uudelleenkiteytyksen, kromatografian, uuttamisen jne. avulla.

Useissa tapauksissa on myöskin edullista suorittaa samanaikaisesti edellä mainittujen puhdistusvaiheiden kanssa tai niiden sijasta kemiallisen johdannaisen muodostaminen, jolloin saadaan glykosyyliamidien, -karbamaattien ja -karbamidien (VI) johdannainen, jolloin symboleilla R¹, R², R¹⁰ ja X on edellä esitetyt merkitykset, ja jolla johdannaisella on hyvät kiteytymisominaisuudet. Tällaisia kemiallisen johdannaisen muodostamisia ovat, kysymyksen ollessa keksinnön mukaisista glykosyyliamideista, glykosyylikarbamaateista ja glykosyylikarbamideista, esimerkiksi sokeritähteiden hydroksyyliiryhmiin kohdistuvat esteröintireaktiot. Sopivia esteriryhmiä ovat esim. asetyyli-, bentsooyli- tai p-nitrobentsooyliiryhmät.

Glykosyyliamidien, glykosyylikarbamidien tai glykosyylikarbamaattien tri-O-asyylijohtannaisten valmistamiseksi saatetaan vastaavat triolit VI reagoimaan asyloimisaineiden kanssa epäorgaanisten tai orgaanisten, apuna käytettyjen emästen läsnäollessa. Sopivia asyloimisaineita ovat happokloridit, kuten asetyylikloridi, bentsooylikloridi p-nitrobentsooylikloridi, tai anhydritit, kuten esim. asetanhydridi. Tällöin syntyy estereitä, joilla on kaava IX



jossa

R^1 , R^2 , R^{10} ja X tarkoittavat samaa kuin edellä

ja

R^{13} tarkoittaa asetyyliä, bentsoyyliä tai p-nitrobenzoyyliä.

5

O-asylointireaktiot suoritetaan edullisesti orgaanisissa, inerteissa liuottimissa. Tällaisina mainittakoon halogeenihiilivedyt, kuten dikloorimetaani, trikloorimetaani tai 1,2-dikloorietaani, eetterit, kuten tetrahydrofuraani tai 1,4-dioksaani, esterit, kuten etikkahappoetyyliesteri, ja amidit, kuten dimetyyliformamidi. Sopivina liuottimina voidaan lisätä myös orgaanisia emäksiä yksistään, kuten trietyyliamiinia tai pyridiiniä.

10

Emäksinä voidaan käyttää kaikkia orgaanisessa kemiassa O-asylointiin käytettyjä emäksiä. Edullisesti käytetään trietyyliamiinia, pyridiiniä tai pyridiinin ja 4-dimetyyliaminopyridiinin seosta.

15

Triesterit IX ovat helposti kiteytettävissä orgaanisista liuottimista. Erityisen edullisia kiteytystä varten ovat polaariset liuottimet, kuten lyhytketjuiset alkoholit, esim. metanoli, etanoli, n-propanoli tai isopropanoli. Muita triesterin IX kiteytykseen soveltuvia liuottimia ovat orgaanisten liuottimien seokset polaaristen epäorgaanisten tai orgaanisten liuottimien kanssa, esim. tetrahydrofuraani/metanoli-, tetrahydrofuraani/vesi-, etanoli/vesi- ja isopropanoli/vesiseokset.

20

25

Kertaalleen tai mahdollisesti useita kertoja suoritettun uudelleenkiteytyksen avulla puhdistetut triesterit IX muutetaan kolmen O-asetyyliryhmän saippuoittamisen tai vaihtoesteröinnin avulla takaisin trioleiksi VI.

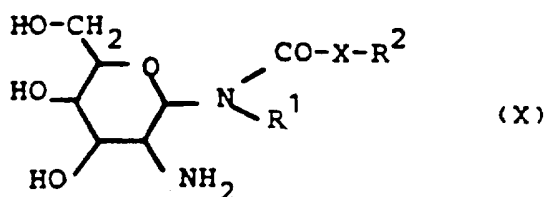
30

Esterin lohkaisut ovat orgaanisessa kemiassa tunnettuja monenlaisessa muodossa. Triolien VI valmistamiseksi triestereistä IX mainittakoon asyyliryhmien vaihtoesteröinti metanolin ja katalyyttisten natriummetanolaattimäärien läsnäollessa, mikä vaihtoesteröinti on orgaanisessa kemiassa tunnettu ZEMPLÉN-saippuoittamisena.

35

Kolmas reaktiovaihe keksinnön mukaisten yhdisteiden, joilla on kaava I, valmistuksessa käsittää kaavan VI mukaisissa yhdisteissä sokerin 2-aminoryhmän suojar ryhmän selektiivisen lohkaisun. Tässä reaktiossa huolehditaan erityisesti siitä, ettei samanaikaisesti lohkea pois myöskin kaavan VI mukaisissa yhdisteissä sokeriosassa oleva 1-amido- tai 1-karbamido tai 1-(alkoksidikarbonyyliamido)-ryhmä.

Aminoheksosin C-2-kohdalla oleva edullisesti käytetty bentsyylioksidikarbonyyliryhmä on lohkaistavissa hydrogenolyttisissä olosuhteissa kvantitatiivisesti ja selektiivisesti, jolloin saadaan 1-amido-, 1-karbamido- tai 1-alkoksidikarbonyyliamidofunktio. Tämä hydrogenolyysi tuottaa glykosyyliamideja, glykosyylikarbamideja tai glykosyylikarbamaatteja, joiden sokeriosassa on vapaa 2-aminoryhmä, ja joilla on seuraava rakennekaava X



jossa R^1 , R^2 ja X tarkoittavat samaa kuin edellä.

Sopivia katalysaattoreita hydrogenolyysiä varten ovat esim. jalometallit, kuten platina tai palladium aktiivihielellä.

On edullista käyttää palladiumia hiilellä (5 % tai 10 %). Hydrogenolyysi voidaan suorittaa normaalipaineessa tai kohotetussa paineessa sopivassa paineastiassa. Liuottimina hydrausta varten tulevat kysymykseen inertit liuottimet, kuten esim. alkoholit, kuten metanoli, etanoli ja propanoli, eetterit, kuten tetrahydrofuraani tai 1,4-dioksaani, tai karboksyylihapot, kuten etikkahappo, tai mainittujen liuottimien seok-

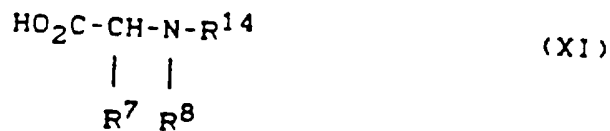
5 set, mahdollisesti käyttäen lisänä vettä tai laimennettuja happoja, kuten suolahappoa tai rikkihappoa. Lisättäessä happoja saadaan kaavan X mukaiset 2-amino-2-desoksi-glykosyyliamidit, -karbamaatit tai -karbamidit näiden hap-

Samoin kaavan VI mukaisissa yhdisteissä edullisesti käytetty t-butyylimoksidikarbonyylisuojarahyhmä on poistettavissa kirjallisuuden tuntemilla menetelmillä mineraalihappojen, kuten suolahapon tai rikkihapon avulla.

10 Myös tässä tapauksessa saadaan selektiivisesti kaavan X mukaisia 2-amino-2-desoksi-glykosyyliamideja, -karbamaatteja tai -karbamideja, jotka saadaan tällöin lohkaistavien happojen ammoniumsuoloina.

15 Keksinnön mukaisten yhdisteiden, joilla on kaava I, synteesin neljäs reaktiovaihe käsittää sopivan aminohappojohdannaisen liittämisen kaavan X mukaisiin aminoglykosyyliamideihin, -karbamaatteihin tai -karbamideihin tai näiden suoloihin.

20 Sopivia aminohappojohdannaisia ovat N-suojatut aminohapot XI



jossa

25 R^7 tarkoittaa samaa kuin edellä,
 R^8 tarkoittaa vetyä tai metyyliä ja
 R^{14} tarkoittaa peptidisynteesissä tavallisesti käytettyä, selektiivisesti jälleen peptidiyhdisteen saamiseksi lohkaistavissa olevaa suojarahyhmää.

30 Edullisesti käytettyjä suojarahyymiä kaavassa XI olevaa aminofunktiota varten ovat edellä mainitut, jolloin erityisen edullinen on bentsyylioksidikarbonyyli- tai t-butyylimoksidikarbonyyliryhmä.

35 Kaavan X mukaisen 2-amino-2-desoksi-glykosyyliamidin, -karbamaatin tai -karbamidin liittäminen kaavan XI mukaiseen aminohappojohdannaiseen voidaan suorittaa so-

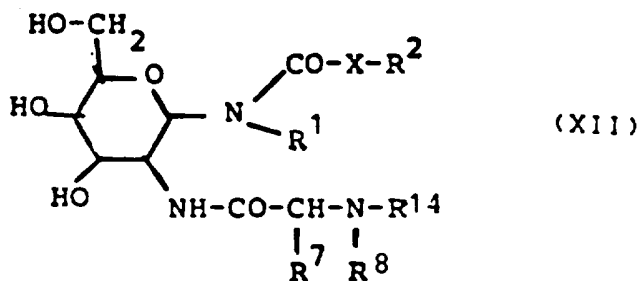
pivien peptidisynteesimenetelmien mukaan [E. Wunsch et al.; Synthese von Peptiden; teoksessa Methoden der Org. Chemie (Houben-Weyl) (E. Müller, Hrsg.). vol XV/I ja XV/2, 4. painos. Thieme Verlag Stuttgart (1974)].

5 Sopivia menetelmiä ovat esim. kaavan X mukaisessa yhdisteessä olevan aminofunktion kondensoiminen aminohap-
pojohdannaisen XI kanssa vettä poistavien aineiden, esim.
disykloheksyylikarbodi-imidin tai di-isopropyylikarbodi-
imidin läsnäollessa.

10 Kaavan X mukaisten yhdisteiden kondensoiminen kaa-
van XI mukaisten yhdisteiden kanssa voidaan suorittaa
myös siinä tapauksessa, että karboksyyliiryhmä on aktivoi-
tu. Aktivoitu karboksyyliiryhmä voi olla esim. happoanhyd-
ridi, edullisesti seka-anhydridi, kuten hapon asetaatti,
15 tai hapon amidi, kuten imidatsoli, tai aktivoitu esteri.
Aktivoituja estereitä ovat esim. syanometyyliesteri,
pentakloorifenyyliesteri ja N-hydroksiftaali-imidiesteri.
Aktivoituja estereitä voidaan saada myös haposta XI ja
N-hydroksisukkinimidistä tai 1-hydroksibentsotiatsolista
20 vettä poistavan aineen, kuten karbodi-imidin läsnäollessa.

Aminohappojen johdannaiset ovat tunnettuja ja nii-
tä voidaan valmistaa tunnetulla tavalla.

Aminoyhdisteen X kondensointi mahdollisesti akti-
voitujen karboksyyliyhdisteiden XI kanssa antaa kaavan
25 XII mukaisia peptidoglykolipidejä,



30

jossa symboleilla R¹, R², R⁷, R⁸, R¹⁴ ja X on edellä
esitetty merkitykset.

Kaavan I mukaisten yhdisteiden valmistuksen eräässä viimeisessä menetelmävaiheessa lohkaistaan kaavan XII mukaisissa yhdisteissä oleva suojaryhmä R^{14} pois.

5 Tällöin tulee huolehtia siitä, etteivät kaavan XII mukaisissa yhdisteissä olevat muut amidi-, uretaani- tai karbamidifunktiot lohkea pois.

10 Kaavan XII mukaisissa yhdisteissä edullisesti käytetyt suojaryhmät R^{14} , N-karbobentsoksiryhmä ja N-tert.-butyylioksidikarbonyyliryhmä ovat lohkaistavissa pois, jolloin saadaan amidi-, uretaani- tai karbamidifunktio.

15 Karbobentsoksiryhmä on lohkaistavissa pois selektiivisesti hydrogenolyysin avulla jalometallien, kuten esim. palladium/hiili-katalysaattorin läsnäollessa sopivassa liuotuksessa, kuten etanolissa, metanolissa, jääetikassa tai tetrahydrofuraanissa, olipa sitten kysymys puhtaasta liuotuksesta tai näiden keskinäisestä yhdistelmästä tai myös yhdistelmästä veden kanssa, jolloin voidaan työskennellä sekä normaalipaineessa että myös kohotetussa paineessa.

20 Kaavan XII mukaisissa yhdisteissä oleva tert.-butyylioksidikarbonyyliryhmä R^{14} on lohkaistavissa pois asidolyyttisen menetelmän avulla. Sopivia olosuhteita ovat esim. kloorivedyn käyttäminen sopivissa liuotimissa, kuten esim. jääetikassa, dietyylieetterissä, dioksaanissa tai etikkahapon etyyliesterissä huoneen lämpötilassa.

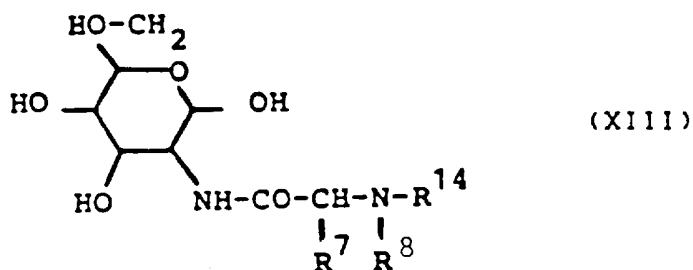
Tällaiset menetelmät t-butyylikarbamaattien lohkaistamiseksi ovat periaatteessa tunnettuja.

30 Tällä tavalla saadut kaavan I mukaiset peptidoglykossyyliamidit, -karbamaatit ja -karbamidit eristetään sinänsä tunnettujen menetelmien mukaan kiteisinä tai amorfisina aineina ja puhdistetaan tarvittaessa uudelleenkiteytyksen, kromatografian, uuttamisen jne. avulla.

35 Keksinnön mukaisia yhdisteitä, joilla on kaava I voidaan valmistaa yhtä hyvin tuloksin myös eräällä toisella valmistustavalla.

Tämä toinen synteesimenetelmä eroaa edellä kuvatusta siinä, että synteessin rakenneosien, joita ovat aminosokeri, aminohappo, amiini R^1-NH_2 ja karboksyylihappo $R^2-CH_2-CO_2-H$ tai hiilihappojohdannainen R^2-O-CO -halogeeni tai R^2-NCO , joissa symbolien R^1 ja R^2 merkitykset ovat samat kuin edellä, liittämisyjärjestys on toisenlainen.

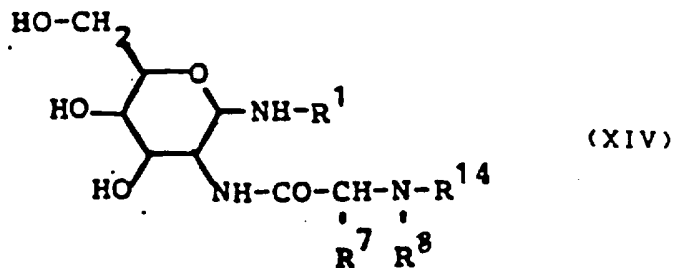
Tässä menetelmässä käytetään sopivia 2-N-(amino-
asyyli)-aminosokereita, joilla on kaava XIII



jossa symbolien R^7 ja R^8 merkitykset ovat samat kuin edellä ja R^{14} tarkoittaa peptidikemiassa tunnettua aminosuojaryhmää, edullisesti bentsyylioksidikarbonyyli- tai t-butyylidoksidikarbonyyliryhmää.

Tällaisen 2-aminoasyyli-aminosokerin valmistus on periaatteessa tunnettu [esim. MIYAZEKI et al., Yakugaku Zasshi, 100, (1980) s. 95].

Näin saadut kaavan XIII mukaiset yhdisteet kondensoidaan sen jälkeen kaavan III mukaisten aminoyhdisteiden kanssa glykosyyliamiineiksi, joilla on yleinen kaava XIV

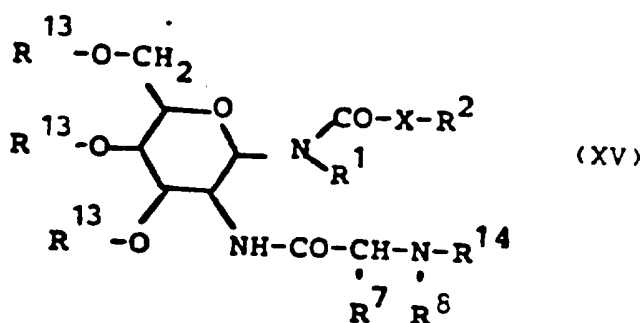


jossa symboleilla R^1 , R^7 , R^8 ja R^{14} on edellä esitetyt merkitykset.

5 Kaavan XIV mukaisten yhdisteiden valmistamiseksi voidaan käyttää kaikkia menetelmiä, jotka on edellä esitetty kaavan IV mukaisten yhdisteiden valmistamiseksi.

10 Kaavan XIV mukaiset yhdisteet saatetaan sen jälkeen reagoimaan joko edellä mainittujen karboksyylihappojohdannaisten V kanssa tai halogeenimuurahaishappoesterien VII kanssa tai orgaanisten isosyanaattien VIII kanssa 2-(ami-
noasyyli)-aminoglykosyyliamideiksi XII (X on $-\text{CH}_2-$) tai
-karbamaateiksi XII (X on $-\text{NH}-$). Nämä asyloimisreaktiot voi-
daan suorittaa yleensä myös edellä esitettyjen menetelmien
mukaisesti glykosyyliamiinien saattamiseksi reagoimaan kar-
boksyyli- tai hiilihappojohdannaisten kanssa.

15 Tällä tavalla saadut välituotteet XII voidaan puhdistaa edellä mainittujen fysikaalisten puhdistusmenetelmien avulla. On kuitenkin suositeltavaa muuttaa yhdisteet XII edellä esitettyjen O-asyloimismenetelmien avulla tri-O-asetateiksi tai tri-O-bentsoateiksi, joilla
20 on kaava XV



30 jossa R^1 , R^2 , R^7 , R^8 , R^{13} , R^{14} ja X tarkoittavat samaa kuin edellä.

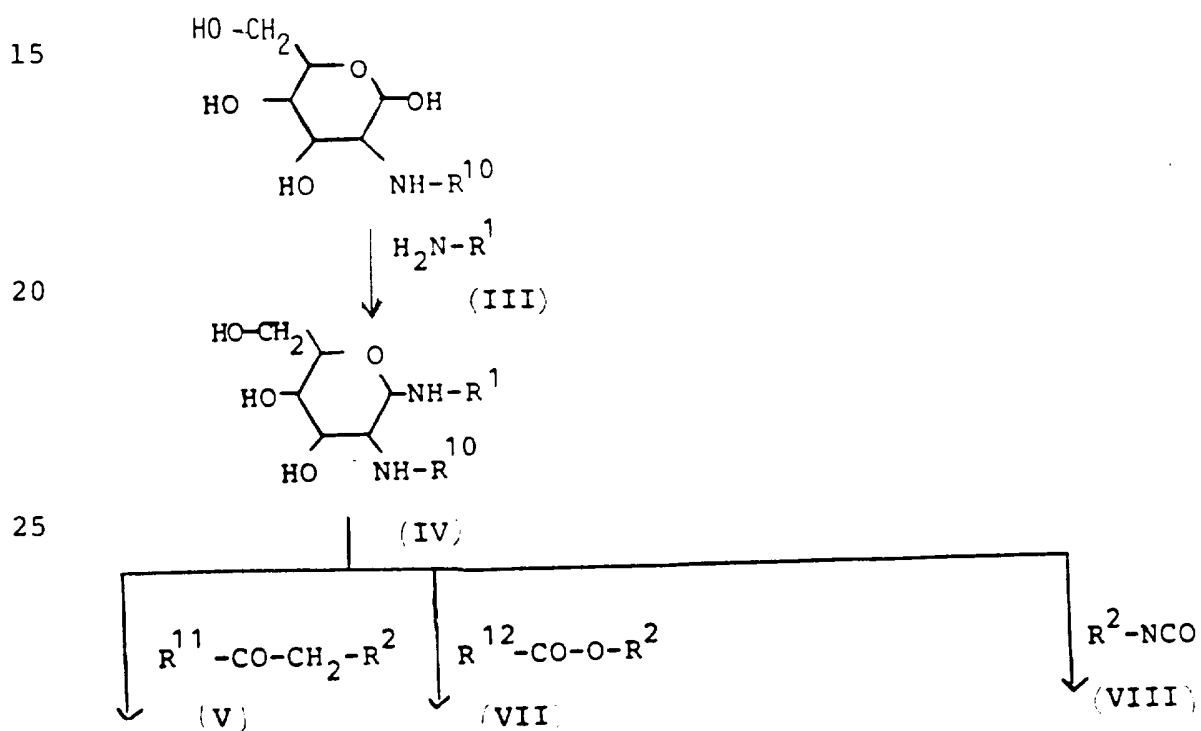
Nämä yhdisteet ovat kiteytettävissä ja siten puhdistettavissa hyvin edullisesti polaarista liuottimista, kuten metanolista tai etanolista.

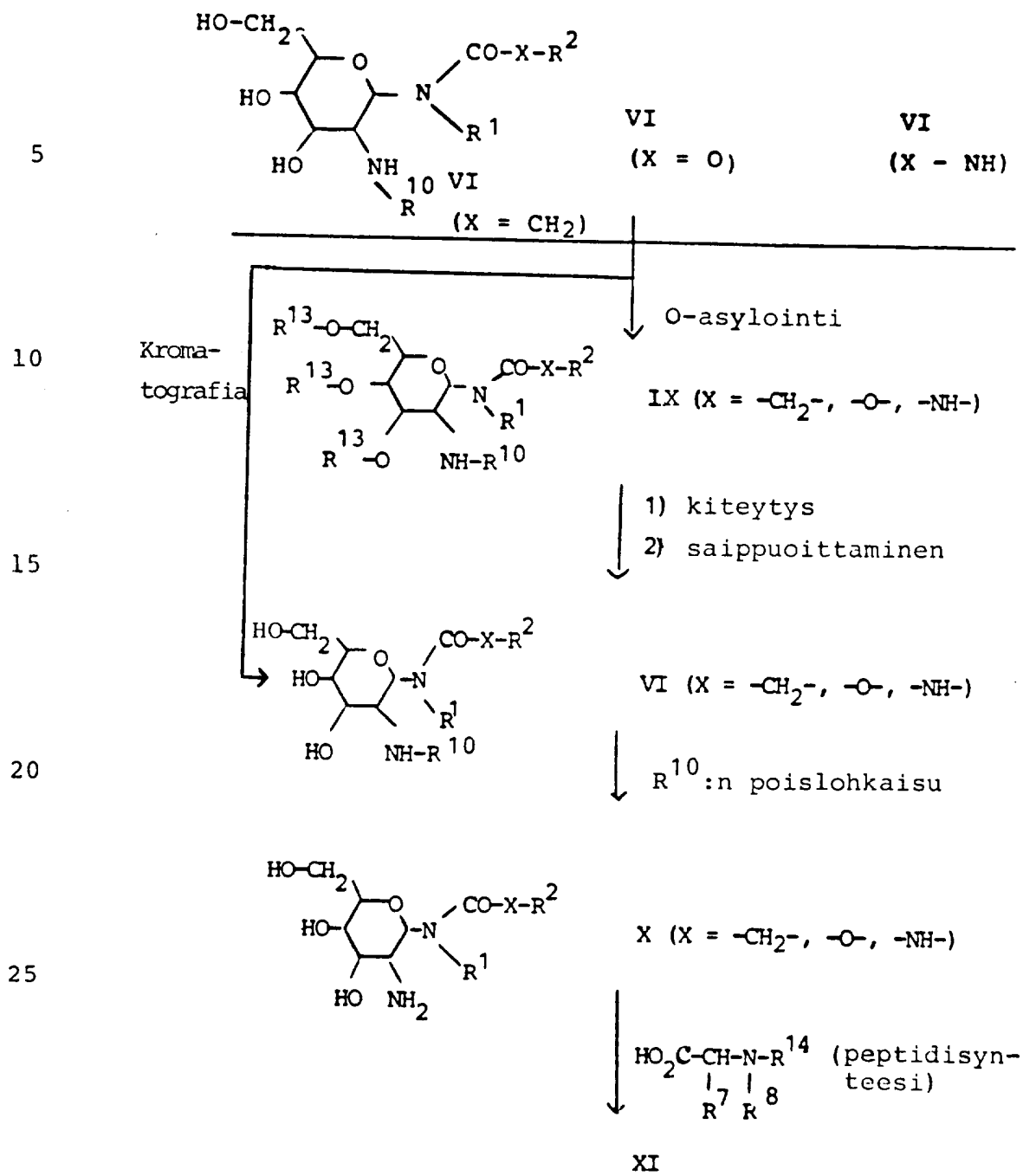
Kiteiset, puhdistetut johdannaiset XV muutetaan sen jälkeen trioleiksi XII edellä esitettyjen esterin saippuoittamismenetelmien avulla, joita usein käytetään erityisesti sokerikemiassa.

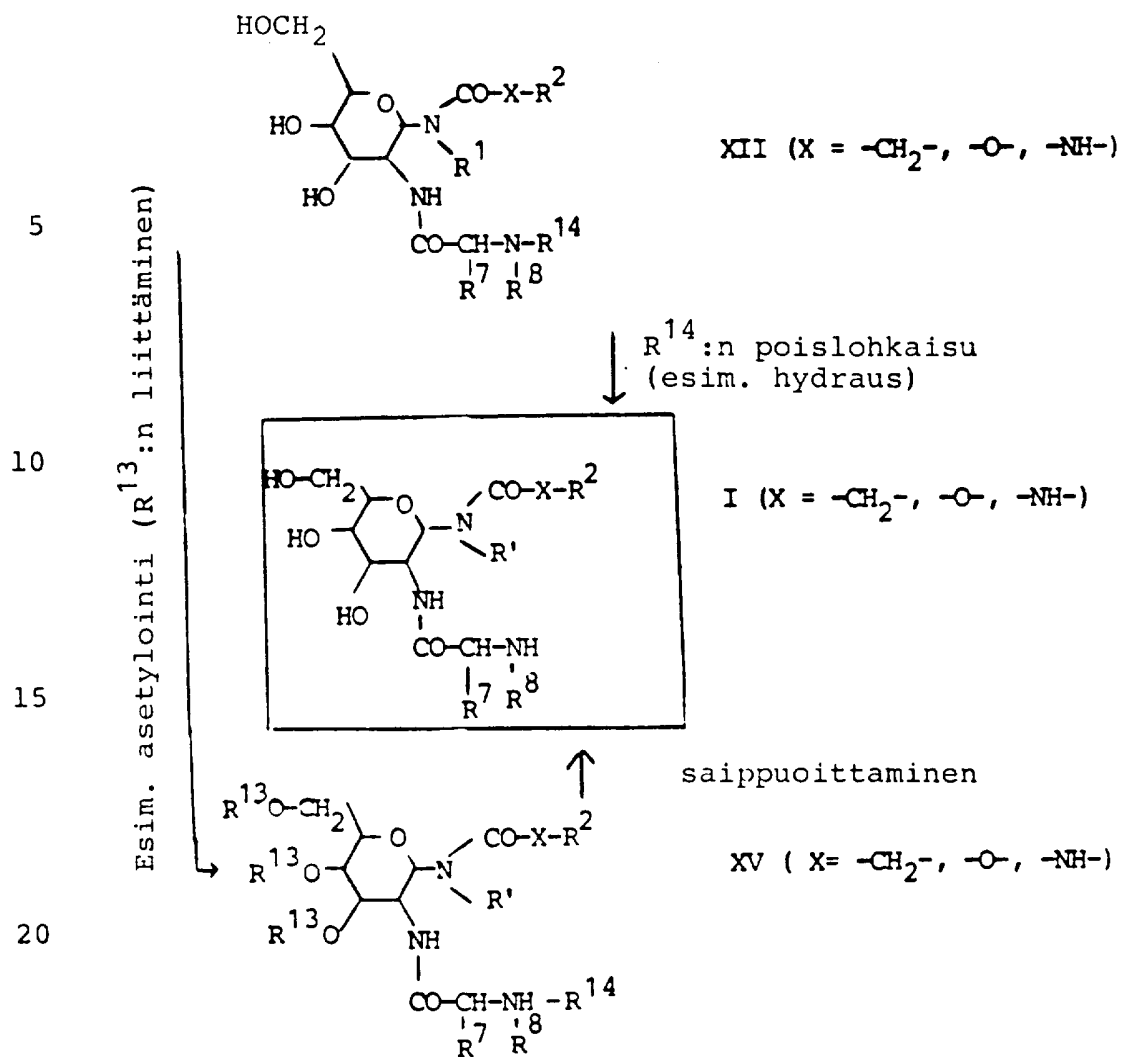
5 Kaavan XII mukaisissa yhdisteissä aminohapossa olevien suojaryhmien lopuksi suoritettu lohkaus on jo selostettu edellä kaavan I mukaisten yhdisteiden valmistuksen yhteydessä.

10 Keksinnön mukaista menetelmää kaavan I mukaisten yhdisteiden valmistamiseksi voidaan kuvata kaaviomaisesti seuraavalla tavalla:

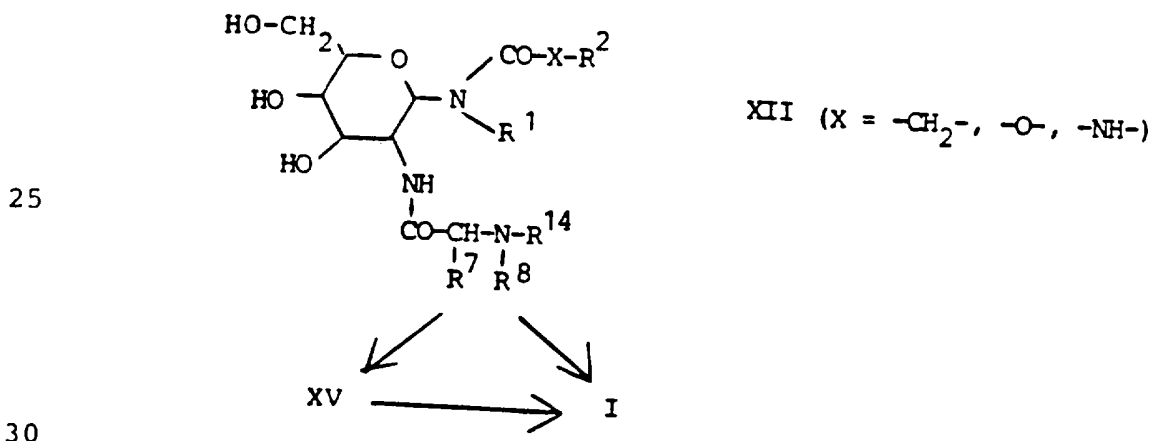
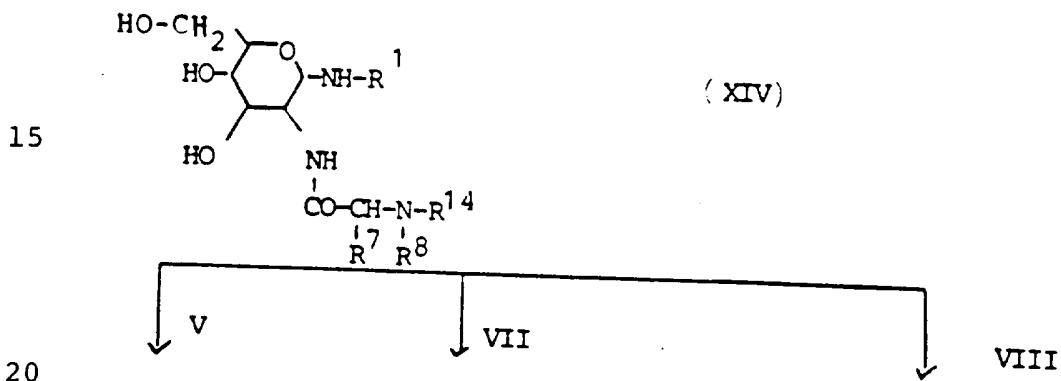
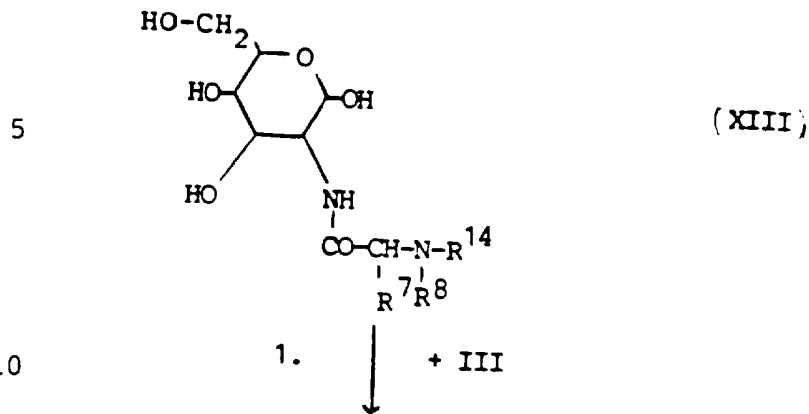
1. menetelmä







2. menetelmä



35

Keksinnön piiriin kuuluvat myös kaavan I mukaisten yhdisteiden suolat. Tällöin on kysymys ensisijaisesti tavallisesti farmaseuttisesti käyttökelpoisista, myrkyttömistä suoloista, esim. kaavan I mukaisten yhdisteiden klorideista, asetaateista ja laktaateista tai myös inerteistä suoloista.

Keksinnön mukaiset yhdisteet osoittavat korostunutta torjuntakykyä lisäävää vaikutusta. Todettiin, että yhdisteluokka kiihdyttää immuunijärjestelmän vasta-ainesynteesiä antigeeni-spesifisesti ja sen lisäksi vahvistaa epäspesifistä isäntäyksilön torjuntakykyä. Nämä tulokset saatiin seuraavan koejärjestelyn yhteydessä.

Primäärin humoraalisen immunitetin voimistuminen in vitro lampaan punasoluja (SE = Schaferythrozyten) vastaan.

10 Kokeellisesti on mahdollista aloittaa humoraalisen immuunivasteen kehittäminen vieraslajisilla punaisilla verisolulla hiiren pernasolujen primäärin immuunisoinnin avulla suspensioviljelmissä in vitro (R.I. Mishell ja R.W. Dutton, J. Exp. Med. 126, 423 (1967)).

15 Tätä varten viljellään Balb/c hiiren pernasoluja 5 päivää antigeenin (SE) ja koestettavan aineen läsnäollessa. Solusato korjataan talteen, pestään ja valmistetaan levyiksi yhdessä antigeenin ja komplementin kanssa puolijähmeässä agarissa ja haudotaan 2 tuntia 37°C:ssa (N.K. Jerne, A.A. Nordin ja C. Henry teoksessa "Cell bound Antibodies", toimittajat Amos ja Koprowski, Wistar Inst. Press, Philadelphia, USA, s 109 (1963)). Hiiren imusolujen antigeeni-herkistäminen primääriviljelmässä aikaansaa vasta-aineiden synteesin ja vapautumisen. Spesifiset, erittyneet vasta-aineet sitoutuvat SE-antigeeniin ja liuottavat nämä solut komplementin läsnäolon johdosta (täplän muodostuminen). Kyseisen yhdisteluokan aineet kykenevät lisäämään annoksesta riippumatta välillä 0,3 - 100 µg/ml vasta-ainetta muodostavien solujen lukumäärää (taulukko 1).

Taulukko 1

Esillä olevaan yhdistelukseen kuuluvien erilaisten, valittujen peptidoglykolipidi-analogien vaikutus vasta-ainesynteesiin in vitro

Aineet Vasta-ainetta erittäviä soluja/viljelmä riippuvuussuhteessa annoksesta ($\mu\text{g/ml}$)

Esimerkki nro	0	1	3	10	30	100
M 61	1595	2600	2190	7380	10,200	9920
M 34	1710	2450	5700	8260	6240	10,640
M 66	1710	1390	3480	6160	7600	8640
M 51	1710	1260	3560	5560	7600	n.d. 1)
M 54	1595	1910	2230	6160	6460	n.d. 1)

1) n.d. = ei suoritettu

Primäärisen humoraalisen immunitetin voimistuminen in vivo liukoista ovalbumiiniantigeenia vastaan.

NMRI-hiiret immunoitiin antamalla niille suboptimaalinen antigeeniannos (1 μ g/eläin, päivänä 0) subkutaanisesti (s.c.). Suboptimaalisen antigeenistimulaation yhteydessä aktivoituu vain vähäinen lukumäärä eläinten imusoluista vasta-ainesynteesiin. Käsittelmällä eläimiä lisäksi esillä olevan keksinnön mainittujen esimerkkien mukaisilla yhdisteillä on mahdollista yhden kerran suoritettuna käsittelyn avulla, jolloin annetaan 0,3 - 30 mg/kg subkutaanisesti, lisätä huomattavasti eläinten seerumin vasta-ainetiitteriä. Vasta-ainetiitterin määrittäminen suoritetaan punasolujen epäsuoran agglutinaation avulla 10. päivänä. Käsittelyn vaikutus ilmaistaan \log_2 -tiitterin geometrisen keskiarvon avulla (taulukko 2).

Mainittujen yhdisteiden immunostimuloiva vaikutus on päinvastoin kuin muiden, esim. bakteriaalisten immunostimulanttien, kuten gram-negatiivisista bakteereista saadun LPS:n, antigeenistä riippuvainen, s.o. aineet aikaansaavat yllättäen vasta-ainesynteesin voimistumisen vain yhdessä antigeenisen ärsykkeen (tässä SE tai ovalbumiini) yhteydessä. Niillä ei ole päinvastoin kuin mainituilla tavanomaisilla immunostimulanteilla mitään mitogeenisiä ominaisuuksia.

Keksinnön mukaiset yhdisteet vaikuttavat in vitro ja in vivo myös makrofagien aktivoitumistilan voimistumiseen. Voimistunut aktivoitumistila on osoitettavissa in vitro makrofagien antimikrobiaalisen tehon suurentumisen perusteella.

Taulukko 2

Keksinnön mukaisten eri yhdisteiden lisävaikutus in vivo liukoisen antigeenin, ovalbumiinin esimerkitapauksessa

Aineet Esimerkki nro	Punasolujen agglutinaatio-tiitteri (\log_2)			
	0	3	10	30
M 17	4,2	4,4 ¹⁾	5,6	6,6
M 34	4,8	5,6 ¹⁾	6,2	7,2
M 1	5,4	5,4 ¹⁾	6,4	7,6
M 41	4,2	5,6	5,4	6,6
M 66	4,0	6,2	6,6	7,2
M 74	4,4	5,8	6,6	7,0

1) ei merkittävä;

muut arvot ovat suurentuneet merkittävästi ($p \leq 0,05$)

Keksinnön mukaiset yhdisteet kykenevät toisaalta parantamaan yhdessä antigeenin kanssa tämän immunogeeniteettiä, toisaalta systeemisesti annettaessa lisäämään käsiteltävän organismin immunologista reaktiviteettiä. Tällöin kykenevät mainitut aineet aktivoimaan vasta-aineiden muodostuksesta vastuussa olevia imusoluja.

Uusia yhdisteitä voidaan siten käyttää apuaineina yhdessä rokotusaineiden kanssa rokotustuloksen parantamiseksi ja immuniteetin avulla aikaansaadun infektiosuojan parantamiseksi bakteriaalisia, virusperäisiä tai loisperäisiä ärsykeitä vastaan.

Lisäksi soveltuvat esitetyt yhdisteet seoksena mitä erilaisimpien antigeenien kanssa adjuvanteiksi valmistettaessa kokeellisesti tai teollisesti vastaseerumia terapiaa ja diagnostiikkaa varten.

Kokeen selostus

Lisävaikutus käytettäessä virusrokotteita

Ihorokahtuma-rokote:

Kaniininpoikasten munuaissoluja viljeltiin menetelmällä, jonka N.J. Schmidt on esittänyt (teoksessa: Viral, Rickettsial and Chlamydial Infections, E.H. Lennette ja N.J. Schmidt, toimittajat, s. 89, American Public Health Association, Inc., Washington, 1979), käyttämällä ravintoväliaineena Minimum Essential Medium Eagle'a (MEME) ja 10 %:ista vasikan veriheraa. Niin pian kuin oli muodostunut yhtenäinen solumatto, infektoitiin soluviljelmät ihorokahtuma-viruksella tyyppiä I (HSV I). 48 tuntia infektion jälkeen jäädytettiin soluviljelmät ja ravintoväliaine -80°C :ssa, sulatettiin ja sentrifugoitiin käyttäen alhaista kierrosnopeutta. Soluviljelmän yläpuolella oleva neste, joka sisälsi 10^7 ZKID₅₀ (soluviljelmää infektoivia annoksia), otettiin erilleen ja jäädytettiin käyttöajankohtaan asti -80°C :seen.

Spear'in ja muiden menetelmää (Journal of Virology 9, 143-159 (1972)) käytettiin muunnoksineen HSV I:n puhdistukseen.

5 HSV I-pitoiset soluviljelmäsakan peittävät nesteet pelletesoitettiin ultrasentrifugoimalla (4°C) TI45-roottorin kierrosnopeuden ollessa 40 000 r/min.

Viruspitoiset pelletit otettiin pieneen tilavuuteen 0,01M tripuskuria, pH 7,5, ja käsiteltiin ultraäänellä (5 x, 2 sek.; Branson Sonifier).

10 Näytteeseen lisättiin sakkaroosia niin paljon, että pitoisuudeksi tuli 50 % (paino/paino) ja kulloinkin lisättiin 10 ml näytettä 38 ml:n vetoisiin sentrifugointiputkiin sentrifugoimista varten sentrifugissa (SW28 Rotor). Epäjatkuva gradientti puhdistettiin
15 Spears'in menetelmän (katso edellä) mukaan, sentrifugoitiin ja sato korjattiin talteen.

Tähän liittyvä viruksen konsentroidi ultrasentrifugoimalla tapahtui käyttämällä sakkaroosityynyä, joka oli säädetty karbamidin osalta 1-molaariseksi.

20 Saatu pelletti otettiin 0,01 M Tris-puskuriin, pH 7,4, käsiteltiin ultraäänellä ja säädettiin ekstinktio E^{280} -arvoon = noin 2-3 mg/ml.

Tämän jälkeen eristettiin viraalinen "Envelope"-antigeeni (EAG) puhdistetusta viruksesta Klein'in ja
25 muiden menetelmään nojautuen (Archives of Virology 68, 73-80 (1981)). Puhdistettu virus, jonka ekstinktio E^{280} = 2,8 mg/ml, säädettiin Triton[®]X-100:n osalta 1 %:iseksi ja haudottiin yön yli 4°C:ssa. Detergentillä käsitelty virus lisättiin kaliumtartraattigradienttia
30 (5-40 %) käyttäen 0,01 M Tris-puskuriin, pH 7,4 ja sentrifugoitiin SW28 Rotor-kojeessa 18 tuntia kierrosluvun ollessa 28 000 r/min.

35 Gradientin ylemmästä kolmanneksesta otetut näytteet, joiden absorptio arvolla 280 nm oli suurempi kuin 0,1, yhdistettiin, väkevöitiin tyhjödialyysin avulla,

dialysoitiin PBS:ä vastaan ja jäädytettiin -80°C :seen vastaista käyttöä varten.

Kaniininpoikasten munuaissoluista saatua täydellistä HSV I inaktivoitiin 4 tuntia 60°C :ssa. Täydellistä inaktivoitua HSV I ja EAG käytettiin hiirien immuni-

soimiseksi HSV I:n avulla aiheutettua infektiota vastaan.

Valevesikauhuvirusrokote:

Valevesikauhuvirusta viljeltiin E.A. Rollinson'in ja G. White'n menetelmän mukaan (Antimicrob. Ag. Chemother, 24, 221-226, 1983) käyttäen ravintoväliaineena MEME'tä ja 2 % vastasyntyneiden vasikoiden veriheraa, sian munuaisista saadun tallennetun solukannan PK-15-soluissa, joka kanta oli saatu Washington'issa olevalta American Type Culture Collection-nimiseltä laitokselta. Niin pian kun viruksen aiheuttamia soluhäiriöitä ilmeni, pakastettiin soluviljelmät ja ravintoväliaine -80°C :ssa, sulatettiin ja sentrifugoitiin alhaista kierrosnopeutta käyttäen. Sakan yläpuolella oleva neste, joka sisälsi 10^8 ZKID₅₀ valevesikauhuvirusta, otettiin erilleen ja pakastettiin -80°C :ssa.

Valevesikauhuvirus väkevöitiin Ben-Porat'in ja muiden menetelmän mukaan (Virology 41, 256-64, 1970) ja puhdistettiin. Tämän jälkeen eristettiin viraalinen "Envelope"-antigeeni (EAG) puhdistetusta viruksesta A.S. Kaplan'in ja T.Ben-Porat'in menetelmän mukaan (Proc. Nat. Acad. Sci., U.S.A. 66, 799-806, 1970).

PK-15-soluista saatua täydellistä valevesikauhuvirusta inaktivoitiin 4 tuntia 60°C :ssa. Täydellistä, inaktivoitua valevesikauhuvirusta tai EAG'tä käytettiin hiirien immunoimiseen valevesikauhuviruksen aiheuttamaa infektiota vastaan.

Hiirien immunoiminen suoritettiin nojautumalla E.N. Kitces'in ja muiden esittämään menetelmään (Infection and Immunity, vol. 16, 955-960, 1970). Täydellisiä, kuumuudessa inaktivoituja viruspartikke-

leita tai EAG:ta (sub-unit-rokote), jotka oli saatu HSV I:sta, tai valevesikauhuvirusta ruiskutettiin lihaksensisäisesti täysikasvuisiin CF-1-hiiriin. Immunisointiaste valittiin sellaiseksi, että osa eläimistä jäi eloon tartuntaviruksella muuten kuolemaan johtavasta taudinaiheuttajalla annetusta tartunnasta huolimatta.

Käsittely mainituilla yhdisteillä voidaan suorittaa intraperitoneaalisesti, subkutaanisesti, intramuskuläärisesti tai intravenöösisti. Tällöin voidaan yhdisteit^ä antaa joko erikseen tai yhdessä rokotteen kanssa.

Taudin tartuttaminen tartuntaviruksella suoritettiin intraperitoneaalisesti, intrakerebraalisesti tai intranasaalisesti 7-13 päivää immunisoinnin jälkeen. Kuolleet eläimet rekisteröitiin päivittäin. Tarkkailu-ajanjakso käsitti 14 päivää, koska kokemuksen mukaan ei tämän aikavälin jälkeen enää yksikään eläin kuollut tartunnan johdosta. Käsiteltyjen ja käsittelemättömien, immunisoitujen eläinten eloonjäämismäärien ja hengissäpysymisaikojen väliset erot merkittiin muistiin. Tulokset on esitetty taulukoissa 3-6.

Keksinnön mukaiset yhdisteet, joilla on kaava I, osoittavat tällöin voimakasta lisävaikutusta käytettäessä virusrokotteiden yhteydessä. Niitä voidaan sen vuoksi käyttää ihmisten ja eläinten virusinfektioissa, joita vastaan on mahdollista aikaansaada ennaltasuojaus. Yhdisteiden käyttö on erityisesti osoitettu sellaisten rokotteiden yhteydessä, jotka ovat vain heikosti immunogeenisiä, esim. geeniteknologisesti tai kemiallisesti valmistettujen sub-unit-rokotteiden yhteydessä.

Keksinnön mukaisia yhdisteit^ä silmälläpitäen voidaan mainita indikaatioina esimerkiksi seuraavat ennaltasuojaukselle alttiit virusinfektiot:

a) ihmislääketieteessä:
influenssa-, sikotauti-, tuhkarokko-, vihurirokko-, maksatulehdus- ja ihorokahtumavirusten aiheuttamat infektiot

b) eläinlääketieteessä:

infektiot, joita ovat aiheuttaneet valevesikauhu-
virus (nauta, sika),
Rhinopneumonitis-virus (hevonen),
5 samoin kuin Marek-virus (kana),
suu- ja sorkkatautivirus (nauta, sika) ja karjan
nuhakuume

Tämä luettelo on tarkoitettu esimerkiksi eikä suin-
kaan keksintöä rajoittavaksi.

10 Taulukko 3

Keksinnön mukaisten aineiden lisävaikutus käytet-
täessä ihorokahtuma-virusrokotetta

immunisointi: intramuskulaarisesti
aineen anto: intramuskulaarisesti yhdessä
15 antigeenin kanssa
taudinaiheuttajan anto: intraperitoneaalisesti

Esimerkki nro	Eloonjäämismäärä %:eissa (n = 10)	Keskimääräinen elossa- pysymisaika (päiviä)
20 M 66 ¹⁾	100	>14 [*]
M 51	90	13,3 [*]
M 74	80	12,8 [*]
M 34	80	12,8 [*]
25 käsittelemättömät vertailueläimet	30	9,3

¹⁾ Annos: 10 mg/kg

* p = 0,05 - 0,01

p-arvot saatiin t-kokeen mukaan.

Taulukko 4

Yhdisteen M 66 lisävaikutus käytettäessä ihorokah-
tuma-virusrokotetta

5	immunisointi:	intramuskulaarisesti	
	yhdisteen anto:	intramuskulaarisesti yhdessä antigeenin kanssa	
	taudinaiheuttajan anto:	intrakerebraalisesti	
10	Annos (mg/kg)	Eloonjäämismäärä %:eissa (n = 10)	Keskimääräinen elossapysy- misaika (päiviä)

	0	0	5,6
--	---	---	-----

	12,5	40	10,1*
--	------	----	-------

15	25	40	9,8*
----	----	----	------

* p = 0,05 - 0,01

p-arvot saatiin t-kokeen mukaan.

Taulukko 5

20 Yhdisteen M 66 lisävaikutus käytettäessä valevesi-
kauhuvirusrokotetta

	immunisointi:	intramuskulaarisesti	
	yhdisteen anto:	intramuskulaarisesti yhdessä antigeenin kanssa	
25	taudinaiheuttajan anto:	intraperitoneaalisesti	

	Annos (mg/kg)	Eloonjäämismäärä %:eissa (n = 10)	Keskimääräinen elossapysy- misaika (päiviä)
--	------------------	--------------------------------------	--

30	0	60	10,5
----	---	----	------

	1,5	90	13,1
--	-----	----	------

	3,0	100	> 14,0*
--	-----	-----	---------

	6,0	100	> 14,0*
--	-----	-----	---------

35	12,0	100	> 14,0*
----	------	-----	---------

* p = 0,05 - 0,025

p-arvot saatiin t-kokeen mukaan.

Taulukko 6

Yhdisteen M 66 lisävaikutus käytettäessä ihorokah-
tuma-subunit-rokotetta

5	immunisointi:	intramuskulaarisesti (80,ug/hiiri)	
	yhdisteen anto:	intramuskulaarisesti yhdessä an- tigeenin kanssa	
	taudinaiheuttajan anto:	intranasaalisesti	
10	Annos	Eloonjäämismäärä	Keskimääräinen elossa-
	mg/kg	#:eissa (n = 10 hiirtä)	pysymisaika (päiviä)

0	50	10,6
6	100	> 14,0*

15

* p = 0,01 - 0,005

p-arvot saatiin t-kokeen mukaan.

20

Uusia yhdisteitä voidaan lisäksi käyttää myös il-
man samanaikaista antigeenin tuontia ihmisillä ja eläimil-
lä jo tiedottomasti tapahtuvien torjuntareaktioiden edis-
tämiseen. Yhdisteet soveltuvat tällöin erityisesti kehon
oman torjuntakyvyn stimuloimiseen, esim. kroonisissa ja
akuuttisissa infektioissa tai selektiivisissä (antigeeni-
spesifisissä) immunologisissa defekteissä samoin kuin
luontaisissa mutta myös hankituissa, yleisissä (s.o.
ei-antispesifisissä) immunologissa puutostiloissa, jol-
laisia esiintyy vanhuudessa, vaikeiden primäärisairauk-
sien aikana ja ennenkaikkea ionisoivilla säteillä tai
immuunisuppressiivisesti vaikuttavilla aineilla annetun
30 terapian jälkeen. Mainittuja aineita voidaan siten an-
taa myös yhdessä anti-infektiivisten antibioottien,
kemoterapeuttien tai muiden parannusmenetelmien kanssa
makro-organismien aiheuttamien vahinkojen torjumiseksi.
Lopuksi soveltuvat selostetut aineet myös infektiosai-
rausten yleiseen ennakolta ehkäisemiseen ihmisillä ja
35 eläimillä.

Keksinnön mukaiset yhdisteet parantavat eloonjäämismäärää eläinmallikokeessa, jossa tutkitaan systeemistä hiiren kandidoosia ja akuuttista bakteeri-infektiota, ja lisäävät kehon omaa torjuntakykyä kroonisesti jatkuvien infektioiden yhteydessä.

Kokeen selostus

Tyyppiä SPF-CFW 1 olevat hiiret infektoitiin suonensisäisesti käyttäen $2-6 \times 10^5$ Candida albicans-lajia olevia, logaritmisesti kasvavia soluja suspendoituna fysiologiseen keittosuolaliuokseen. Kolmannesta päivästä alkaen infektion jälkeen olivat ensimmäiset sairauden oireet havaittavissa ei-käsitellyissä vertailueläimissä. Viidenteen päivään mennessä kuolivat ensimmäiset eläimet munuaisten akuuttiseen toimintakyvyttömyyteen ja neljänteentoista päivään mennessä infektoinnin jälkeen on yleensä yli 80 % ei-käsitellyistä eläimistä kuollut. Tässä kokeessa ovat keksinnön mukaiset yhdisteet tehokkaita sairauden hidastajia. Merkittävä sairautta hidastava vaikutus saavutettiin esimerkkien M 17, M 61 ja M 66 mukaisilla yhdisteillä, kun yhdisteitä annettiin parenteraalisesti (i.p. tai s.c.) 24 tuntia ennen infektiota konsentraatioissa 1-50 mg/kg kehon painoa.

Käsitellyissä eläimissä havaittiin tilastollisesti merkittävä hengissäpysymisajan pidentyminen verrattuna ei-käsiteltyihin vertailueläimiin. Noin 50 % käsitellyistä eläimistä eli 14 päivän pituisen tarkkailuajanjakson ajan, kun taas ei-käsitellyistä vertailueläimistä pystyi tähän noin 20 %.

Keksinnön mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää yksinään ennakolta ehkäisevänä aineena, olemassa olevien infektioiden torjuntaan tai yhdessä antibioottisen terapian kanssa antibioottien ja kemoterapeuttien (esim. penisilliinin, kefalosporiinin, aminoglykosidien jne.) terapettisen vaikutuksen lisäämiseksi infektion saaneilla ihmisillä ja eläimillä.

Todettiin, että patogeenisillä taudinsiemenillä hiirille aiheutetut infektiot, jotka johtavat vertailueläinten kuolemaan 24-48 tunnin kuluessa, voidaan parantaa käsittelemällä ennaltaehkäisevästi - edullisesti intraperitoneaalisesti - käyttämällä 1-80 mg/kg keksinnön mukaisia yhdisteitä. Tämä koskee melkoista joukkoa gram-positiivisia (esim. stafylokokit) ja gram-negatiivisia (esim. E. coli, Klebsiella, Proteus, Pseudomonas) taudinaiheuttajia. Tämä luettelo on tarkoitettu esimerkiksi, mutta ei keksintöä rajoittavaksi. Niinpä esim. hiiristä, jotka oli infektoitu patogeenisella Klebsiella 63-kannalla, jäi eloon sen jälkeen kun niitä oli käsitelty (esim. 18 tuntia ennen infektiota) käyttämällä 10-40 mg/kg esimerkkien M 4, M 5, M 34, M 92 ja M 51 mukaisia keksinnön mukaisia yhdisteitä, 40 - 100 % tästä infektiosta huolimatta, kun taas käsittelemättömistä vertailueläimistä jäi eloon vain 0 - 30 %.

Eräissä toisessa koekeessa voitiin osoittaa, että antibioottien terapeuttista vaikutusta voidaan parantaa keksinnön mukaisten yhdisteiden avulla. Hiiret infektoitiin Pseudomonas w.-kannalla. Tämä infektio johtaa kuolemaan useimpien vertailueläinten osalta 24 tunnin kuluessa. Erästä toista ryhmää käsiteltiin antamalla 30 tuntia infektion jälkeen 4 mg/kg sisomisiinia. Voitiin osoittaa, että vertailuryhmässä, jota oli käsitelty 18 tuntia ennen infektiota keksinnön mukaisilla yhdisteillä (katso edellä olevia esimerkkejä), voitiin sisomysiinin terapeuttista vaikutusta parantaa ratkaisevasti.

Sub-akuuttia infektiota silmälläpitäen suoritettuihin kokeisiin käytettiin koe-eläiminä CFW₁-hiiriä. Ryhmiä käsiteltiin kulloinkin kolmasti i.m. antamalla kussakin tapauksessa 0,1 ml 3 %:iseen etanoliin sekoitettuja aineita, vertailuryhmissä "tyhjä"-valmistetta (ilman kyseistä yhdistettä). Käsittely suoritettiin

24 tuntia ja 1 tunti ennen infektiota ja 24 tuntia infek-
tion jälkeen. Salmonella typhimurium-kannan LT2 i.p.-suo-
ritettu infektio käyttäen noin 5×10^5 taudinsiementä/-
hiiri 0,25 ml:ssa vastasi LD₅₀-arvoa. Vertailuryhmän in-
5 fektion kulku ilmeni infektion 4-päiväisenä alkuvaihee-
na, jolloin eläimet eivät kuolleet. Tämä infektion alka-
misvaihe tarjoaa eläimille mahdollisuuden aktivoida solu-
jen immuunimekanismeja ja stimuloi siten latentin tai
kroonisen infektion epäspesifisen torjuntamekanismin.
10 Neljännestä päivästä 12 päivään mennessä infektion jäl-
keen kuoli noin 50 % vertailueläimistä. 21 päivää kestä-
neen tarkkailuajan jälkeen koe lopetettiin.

Kokeiden tulkinta suoritettiin vertaamalla ver-
tailuryhmiä käsiteltyihin ryhmiin. Tällöin käytettiin
15 aineiden vaikutuksen arvosteluperusteena sekä pienenty-
nyttä kuolleisuuslukua että myöskin kuolemisvaiheen
alkamisen hidastumista.

Yhdisteet M 1, M 92, M 17 ja M 54 osoittavat sekä
eläinten kuoleamisen alkamishetkeen kuluvan ajanjakson
20 pidentymistä että myöskin selvää eloonjäämisluvun suu-
rentumista. Vaikutukset todettiin konsentraatioalueella
1-10 mg/kg kehon painoa.

Lisäkokeet, jotka suoritettiin sukusiitoshiirillä
(CBA/J), joilla on normaali infektiorjuntakyky (Ity^r)
25 Salmonella typhimurium-lajia vastaan, osoittavat 10^4 -
 10^5 kolonioita muodostavaa yksikköä käyttäen suorite-
tun subkutaanisen tai intraperitoneaalisen infektion
jälkeen sairastumisen kroonista kulkua, jolloin esiin-
tyi taudinsiemeniä veressä ja haarapesäkkeiden muodos-
tumista maksassa ja pernassa. Bakteereita on 6-8 vii-
30 kon ajan osoitettavissa elimissä, s.o. infektio tapah-
tuu kroonisesti säilyvästi.

Hiiret jaettiin umpimähkään 5 tai 10 eläimen ryh-
miin ja näitä käsiteltiin esimerkiksi aineiden M 52 ja
35 M 54 erisuuruisilla annoksilla (1 kerta päivittäin).

Liuottimella käsitelty hiiriryhmä toimi vertailukohteenä. Annettaessa ennakolta ehkäisevästi (intraperitoneaalisesti tai subkutaanisesti) ainetta M 52 päivinä -4, -3, -2 ja -1 ennen taudinaiheuttajan antamista, ilmeni 5 21 päivää infektion jälkeen maksassa olevien taudinsiemementen 90 %:n suuruinen pieneneminen verrattuna vertailueläimiin.

Aine M 54 aikaansai esim. infektion aikana päivinä +3, +4, +5 ja +6 intraperitoneaalisesti annettuna 10 7. päivänä infektion jälkeen samoin noin 90 %:n suuruisen maksassa olevien taudinsiemementen lukumäärän pienenemisen.

Käsittelemättömät, Salmonella:lla infektoidut hiiret osoittavat toisesta viikosta alkaen taudinaiheuttajan 15 antamisen jälkeen T-solun välittämän immuniteetin heikkenemistä, mikä on osoitettavissa ³H-tymidiinin pienentyneenä kiinnittymismääränä hiirien pernan lymfosyyttien desoksiribonukleiinihappoon mitogeenisen fytohemagglutiiniinin (PHA) tai konkanavaliini A:n (Con A) vaikutuksen 20 alaisena. Keksinnön mukaisilla aineilla, esim. aineella M 52 suoritettujen eläinten ennakolta ehkäisevän käsittelyn jälkeen oli infektion aiheuttama T-solun välittämän immuniteetin heikkeneminen selvästi vähäisempi kuin vertailueläimillä. Pernal lymfosyyttien stimuloitavuus saavutti arvoja, jollaisia on todettavissa infektoimattomilla 25 eläimillä. Nämä vaikutukset todettiin annosten suuruuden ollessa 5 mg/kg kehon painoa. Ilman infektiota ei aineella M 52 todettu mitään pernan lymfosyyttien uudiskasvun lisääntymistä.

Vaikkakin yhdisteiden vähvistava vaikutus hiiriin ilmenee esimerkiksi jo i.p. tai peroraalisesti 30 annetun 100 mg/kg yksittäisannoksen antamisen jälkeen, ei myrkyllisiä vaikutuksia havaita myöskään annettaessa yhdisteit^ä annoksena 100 mg/kg. Aineiden siedettävyyden 35 on tämän vuoksi hyvä.

Esillä olevan keksinnön mukaiset farmaseuttiset valmisteet ovat edullisesti tabletteja tai gelatiinikap-seleita, jotka sisältävät vaikutusaineita yhdessä laimen-nusaineiden, esim. laktoosin, dekstroosin, sakkaroosin, 5 mannitolin, sorbitolin, selluloosan, ja/tai voiteluaineiden, esim. piimaan, talkin, steariinihapon tai sen suolojen, ku-ten magnesium- tai kalsiumstearaatin, ja/tai polyetyleeni-glykolin kanssa. Tabletit sisältävät myös sideainetta, esim. magnesium-alumiinisilikaattia, tärkkelyksiä, kuten maissi-, 10 vehnä-, riisi- tai nuolijuuritärkkelystä, gelatiinia, traganttia, metyyliiselluloosaa, natriumkarboksimeyyliiselluloosaa ja/tai polyvinyylipyrrolidonia, ja haluttaessa hajottavia aineita, esim. tärkkelyksiä, agaria, algiini-happoa tai sen suolaa, kuten natriumalginaattia, ja/tai 15 poreiluaineseoksia, tai adsorptioaineita, väriaineita, mausteita ja makeutusaineita. Ruiskutettavat valmisteet ovat edullisesti isotonisia vesiliuoksia tai -suspensioi-ta. Suppositoriot, salvat ja kermat ovat ensisijassa rasvaemulsioita tai -suspensioita. Farmaseuttiset valmis- 20 teet voivat olla steriloituja ja/tai ne voivat sisältää apu-aineita, esim. säilömis-, stabiloimis-, kostutus- ja/tai emulgoimisaineita, liukenemistä helpottavia aineita, suo-loja osmoottisen paineen säätämiseksi ja/tai puskuriai-neita. Farmaseuttisia valmisteita, jotka voivat 25 haluttaessa sisältää muita farmakologisesti arvokkaita aineita, valmistetaan sinänsä tunnetulla tavalla, esim. tavanomaisilla sekoitus-, granuloimis- tai rakeistusmene-telmillä ja ne sisältävät noin 0,1 % - noin 75 % edulli- sesti noin 1 % - 50 % aktiivisia aineita.

30 Esillä olevan keksinnön mukaiset, oraalisesti an- nettavat valmisteet voidaan varustaa myös mahanestettä vastaan kestäväällä päällysteellä.

Keksinnön mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää vastus- 35 tuskukykyä parantavina ja immuniteettia vahvistavina ai- neina kroonisten ja akuuttien infektioiden (esim. bak-

teerien, virusten ja loisten aiheuttamien) ja pahanlaatuisten kasvannaisten käsittelyyn. Niitä voidaan käyttää myös apuaineina rokotuksen yhteydessä, syöjäsolu-

5 toiminnan stimuloimiseen ja torjunta- ja immuunijärjestelmän muuttamiseen.

Pitkäaikaiskäsittelyn vaikutus immunologisesti aikaansaatuihin prosesseihin apuaineella aikaansaatua niveltulehdusta koskevassa mallikokeessa.

30 päivää kestäneessä kokeessa tutkittiin esillä

10 olevan yhdisteluokan aineiden vaikutusta apuaineella saatua niveltulehdusta koskevassa mallikokeessa rotilla (Pearson, C.M. ja F.D. Wood, Arthr. Rheu. 2, 440 (1959)), jossa kroonisessa tulehdusmallikokeessa käytetään uusimpien tietojen mukaan oivallisia soluperäisiä (T-lymfosyytti)-komponentteja.

15

Annettaessa esillä olevan keksinnön mukaisia yhdisteitä sisältäviä aineita päivittäin subkutaanisesti 20 päivän ajan parantavat ne selvästi täydellisellä Freund'in apuaineella (CFA) injisoidun footin (primäärivamman) vauriot; esimerkkinä peptidoglykolipidi-analogeista esitet-

20 täköön vaikutusaine M 66.

10 päivän jälkeen suoritettu sairauden systemointi, mitattuna ei-kuormitetun rottafootin (sekundäärivamman) osalta, saattoi M 66:n vaikutuksesta tukahduttaa sairauden huomattavassa määrässä ja vaikutus jatkui myös

25 10 päivän ajan käsitellyn lopettamisen jälkeen.

Yhdisteet osoittavat niin ollen ominaisuuksia, jotka tekevät ne arvokkaiksi immunologisesti riippuvien prosessien käsittelyihin kroonisten tulehdusten (esim. reumaattisen muotopiirin sairausten) ja immunologisten säätelyhäiriöiden (immuunidefektin määrättyjen muotojen)

30 yhteydessä.

EsimerkitA) Yleinen menetelmä N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-alkyyliamiinin (IV) valmistamiseksi

5 Seos, joka sisälsi 10 mmol 2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi-D-glukopyranoosia (II) [E. Chargaff ja M. Borarnick, J. Biol. Chem. 118 (1937) s. 421] ja 20 mmol alkyyliamiinia III, liuotettiin 60 ml:aan metanolia lämmössä ja liuosta sekoitettiin 3 tuntia palautusjäähdyttäjää käyttäen. Huoneen lämpötilaan jäädyt-

10 tämisen jälkeen liuotin poistettiin tyhjössä. Jäljelle jäänyt jäännös liuotettiin 60 ml:aan dimetyyliformamidia ja uutettiin viidesti käyttämällä kullakin kerralla 20 ml n-heksaania. DMF-liuosta käytettiin ilman enempää käsittely-

15 jä N-asylointeihin.

Saman menetelmän mukaan valmistettiin myös N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-alkyyliamiineja (IV).

20 B) Yleinen menetelmä N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksylihappoamidien (VI) (X on CH₂) valmistamiseksi

11 mmol karboksyylihappoa (V, R¹ on -OH) liuotettiin 15 ml:aan abs. tetrahydrofuraania ja, sen jälkeen kun liuokseen oli lisätty 10,5 mmol kloorimuurahaishappoetyyliesteriä ja 10,5 mmol trietyyliamiinia, seosta sekoitettiin tunnin ajan huoneen lämpötilassa. Muodostunut ammoniumsuola erotettiin imusuodattimella ja pestiin sen jälkeen kahdesti käyttämällä kummallakin kerralla 3 ml tetrahydrofuraania. Yhdistetyt suodokset lisättiin menetelmän A mukaan valmistetun glykosyyliamiinin (IV) liuokseen. Yhdistettyjä liuoksia sekoitettiin 4 tuntia huoneen lämpötilassa. Valmistuserä haihdutettiin korkeassa tyhjössä ja saatu jäännös puhdistettiin pylväskromatografian avulla (eluenttina dikloorimetaani/metanoli, 20:1).

25

30

35

Samojen menetelmien mukaan ja lähtemällä N-(2-bentsyylioksidikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-alkyyliamiineista (IV) valmistettiin vastaavia N-(2-bentsyylioksidikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappoamideja (VI) (X on CH₂).

C) Yleinen menetelmä N-(3,4,6-tri-O-asetyyli-2-bentsyylioksidikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappamidien (IX) (X on -CH₂-) valmistamiseksi

Yleisen menetelmän B mukaan valmistetut N-(2-bentsyylioksidikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappamidit (VI) (X on CH₂) liuotettiin ilman edeltävää kromatografista puhdistusta 30 ml:aan pyridiiniä ja, sen jälkeen kun joukkoon oli lisätty 20 ml asetanhidridiä, lämmitettiin 30 minuuttia 50°C:ssa. Huoneen lämpötilaan jäädyttämisen jälkeen valmistuserä haihdutettiin tyhjössä. Jäännös uutettiin useita kertoja tolueeniin ja uutოს haihdutettiin. Jäännös liuotettiin 50 ml dikloorimetaania ja suodatettiin käyttämällä 5 g Kieselgel 60 (MERCK). Suodos haihdutettiin tyhjössä.

Jäännös liuotettiin kuumaan metanoliin ja kiteytettiin huoneen lämpötilassa. Saadut kiteet kiteytettiin uudelleen metanolista.

Analogisella tavalla ja lähtemällä N-(2-bentsyylioksidikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappoamideista (VI) (X on CH₂) valmistettiin saattamalla reagoimaan asetanhidridin ja pyridiinin kanssa N-(3,4,6-tri-O-asetyyli-2-bentsyylioksidikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappoamideja (IX) (X on -CH₂-).

D) Yleinen menetelmä N-(2-bentsyylioksikarbonyyli-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappoamidien (VI) (X on $-\text{CH}_2-$) valmistamiseksi vastaavista tri-O-asetaateista (IX) (X on $-\text{CH}_2$)

5 10 mmol N-(3,4,6-tri-O-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-alkyylikarboksyylihappoamideja (IX) (X on $-\text{CH}_2-$) liuotettiin 50 ml:aan abs. metanolia ja joukkoon lisättiin 0,5 ml 1 N natriummetanolaattia. Seosta lämmitettiin 30 minuuttia 50°C :ssa, sen jälkeen jäädytettiin huoneen lämpötilaan ja neutra-
10 loitiin ioninvaihtohartsilla Lewatit^R SC 108 (H^+ -muoto). Ioninvaihtohartsi erotettiin suodattamalla ja suodos haihdutettiin siirapiksi.

Analogisella tavalla ja lähtemällä N-(3,4,6-tri-O-
15 asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappoamideista (IX) (X on $-\text{CH}_2$) valmistettiin vaihtoesteröinnin avulla vastaavia N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
D-galaktopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappoamideja
20 (VI) (X on $-\text{CH}_2-$).

E) Yleinen menetelmä N-(2-bentsyylioksikarbonyyli-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-alkyyli-O-alkyylikarbamaattien (VI) (X on $-\text{O}-$) valmistamiseksi

10 mmol menetelmän A mukaan valmistettua N-(2-
25 bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-alkyyliamiinia (IV) liuotettiin 20 ml:aan tetrahydrofuraania ja liuokseen lisättiin 10 mmol kaliumkarbonaattia.

Samalla kun seosta sekoitettiin, siihen lisättiin tipottain 10 mmol kloorimuurahaishappoalkyyliesteriä (VII)
30 liuotettuna 10 ml:aan abs. tetrahydrofuraania. Valmistuserää sekoitettiin sen jälkeen tunnin ajan ja sen jälkeen suodatettiin ja suodos haihdutettiin tyhjössä. Jäännös puhdistettiin pylväskromatografisesti (eluenttina dikloorimetaani/metanoli, 10:1).

Analogisella tavalla ja lähtemällä N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-alkyyliamineista IV valmistettiin vastaavia N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-alkyyli-O-alkyylikarbamaatteja (VI) (X on -O-).

F) Yleinen menetelmä N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-alkyyli-N'-alkyylikarbamidien (VI) (X on -NH-) valmistamiseksi

10 mmol menetelmän A) mukaan valmistettua N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-alkyyliamiinia IV liuotettiin seokseen, jossa oli 20 ml abs. tetrahydrofuraania ja 5 ml metanolia. Joukkoon lisättiin tipottain samalla sekoittaen liuos, joka sisälsi 10 mmol alkyyli-isosyanaattia VIII 10 ml:ssa tetrahydrofuraania. Valmistuserää sekoitettiin 2 tuntia huoneen lämpötilassa ja sen jälkeen haihdutettiin tyhjöissä. Saatu siirappi puhdistettiin kromatografisesti piihappogeeliä käyttäen, (eluenttina dikloorimetaani/metanoli, 15:1).

Analogisella tavalla ja lähtemällä N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-alkyyliamiineista IV valmistettiin vastaavia N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-alkyyli-N'-alkyylikarbamideja (VI) (X on -NH-).

G) Yleinen menetelmä N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappoamidien (X) (X on -CH₂-) valmistamiseksi.

10 mmol N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-alkyylikarboksyylihappoamideja (VI) (X on -CH₂-) liuotettiin seokseen, jossa oli 20 ml tetrahydrofuraania, 20 ml metanolia ja 4 ml jäätikkää, ja hydrattiin normaalipaineessa, samalla kun läsnä oli 500 mg 10 %:ista palladium/hiili-katalysaattori. Vedyn sitoutumisen päätyttyä erotettiin katalysaattori suodattamalla ja liuos haihdutettiin tyhjöissä. Muodostunut tuote saatiin etikkahapposuolana.

Analogisella tavalla ja lähtemällä N-(2-bentsyyli-
 oksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
 alkyyli-karboksyylihappoamideista (VI) (X on -CH₂-) saatiin
 hydraamalla vastaavia N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galakto-
 5 pyranosyyli)-N-alkyylikarboksyylihappoamideja X (X on -CH₂-).

H) Yleinen menetelmä N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glu-
 kopyranosyyli)-N-alkyyli-O-alkyyli-karbamaattien (X) (X on -O-)
 valmistamiseksi

Kohdassa G) kuvatulla tavalla hydrattiin 10 mmol
 10 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyra-
 nosyyli)-N-alkyyli-O-alkyylikarbamaattia (VI) (X on O).

Analogisella tavalla ja lähtemällä N-(2-bentsyyli-
 oksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
 alkyyli-O-alkyylikarbamaateista VI (X on O) valmistettiin
 15 hydraamalla vastaavia N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyra-
 nosyyli)-N-alkyyli-O-alkyyli-karbamaatteja (X) (X on -O-).

I) Yleinen menetelmä N-(2-amino-2-desoksi- β -D-
 glukopyranosyyli)-N-alkyyli-N'-alkyylikarbamidien (X)
 (X on -NH-) valmistamiseksi

Kohdassa H) kuvatulla tavalla hydrattiin 10 mmol
 20 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopy-
 ranosyyli)-N-alkyyli-N'-alkyylikarbamidia (VII) (X on -NH-).

Analogisella tavalla ja lähtemällä N-(2-bentsyyli-
 oksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
 25 alkyyli-N'-alkyyli-karbamideista VI (X = -NH-) valmistet-
 tiin vastaavia N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
 N-alkyyli-N'-alkyylikarbamideja X (X = -NH-).

J) Yleinen menetelmä N-(2-(2-bentsyylioksikarbonyy-
 liamino-asyyliamido)-2-desoksi- β -D-heksapyranosyyli)-N-
 30 alkyyli-karboksyylihappamidien XII (X on -CH₂-), -O-alkyyli-
 karbamaattien XII (X on -O-) ja N'-alkyylikarbamidien (XII,
 (X on -NH-) valmistamiseksi

10,0 mmol N-bentsyylioksikarbonyyliaminohappoa
 liuotettiin 30 ml:aan abs. tetrahydrofuraania, liuokseen
 35 lisättiin 12,5 mmol N-hydroksisukkinimidiä ja seos jääh-
 dytettiin 0°C:seen. Sen jälkeen kun joukkoon oli lisätty

10,0 mmol disykloheksyylikarbodi-imidiä, valmistuserää sekoitettiin 3 tuntia 0°C:ssa ja sen jälkeen 1 tunti huoneen lämpötilassa. Saostunut karbamidi erotettiin imusuodattimella ja suodos lisättiin 0°C:ssa liuokseen, joka sisälsi
 5 9,5 mmol aminoyhdistettä (X) seoksessa, jossa oli 50 ml abs. tetrahydrofuraania ja 9,5 mmol trietyyliamiinia.

Seos lämmitettiin hitaasti huoneen lämpötilaan ja sekoitettiin 2 tuntia huoneen lämpötilassa. Valmistuserä haihdutettiin tyhjöissä, siirappimainen jäännös
 10 liuotettiin seokseen, jossa oli 200 ml dikloorimetaania ja 40 ml 2-propanolia, ja uutettiin useita kertoja käyttämällä kullakin kerralla 60 ml 5 %:ista keittosuolan vesiliuosta.

Orgaaninen faasi kuivattiin magnesiumsulfaattilla ja haihdutettiin tyhjöissä siirapiksi. Siirappi erotettiin pylväskromatograafisesti käyttämällä Kieselgel 60 (eluenttina dikloorimetaani/metanoli/ammoniakkivesi, 20:1/5:1).

20 K) Yleinen menetelmä N-(3,4,6-tri-O-asetyyli-2-(2-bentsyylioksikarbonyyliaminoasyyliamido)-2-desoksi-β-D-heksopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksyylihappoamidien (XV) (X on CH₂), -O-alkyylikarbamaattien (XV) (X on O) ja -N'-alkyylikarbamidien (XV) (X on -NH-) valmistamiseksi

Menetelmän J) mukaan valmistetut glykopyranosyyliamidit, -karbamaatit tai -karbamidit (XII)
 25 liuotettiin ennen siinä kuvattua kromatograafista puhdistusvaihetta seokseen, jossa oli 50 ml pyridiiniä ja 30 ml asetanhydridiä, ja liuosta lämmitettiin tunnin ajan 40°C:ssa. Valmistuserään lisättiin 100 ml jäävettä. Orgaaninen aine uutettiin 150 ml:lla dikloorimetaania,
 30 sen jälkeen uutettiin dikloorimetaanifaasi tyhjentävästi 1 N suolahapolla, sen jälkeen natriumvetykarbonaatin kyllästetyllä vesiliuoksella ja lopuksi vedellä ja kuivattiin magnesiumsulfaatilla. Dikloorimetaanifaasi
 35 haihdutettiin ja jäljelle jäänyt siirappi liuotettiin kuumaan metanoliin.

Tri-O-asetaatit XV kiteytyivät jäädytettäessä hitaasti huoneen lämpötilaan tai 10°C:seen.

L) Yleinen menetelmä yhdisteiden (XII) valmistamiseksi poistamalla O-asetyyli tri-O-asetateista (XV)

5 10 mmol tri-O-asetyyli-glykopyranosyyliamideja (XV) (X = -CH₂-), -karbamaatteja XV (X = -O-) tai -karbamideja (XV) (X on -CH₂-), liuotettiin seokseen, jossa oli 20 ml abs. tetrahydrofuraania ja 30 ml abs. metanolia, ja, sen jälkeen kun liuokseen oli lisätty 0,2 ml 1 N natriummetanolaattiliuosta, seosta lämmitettiin 50°C:ssa 10 tunnin ajan. Reaktiopanoksen jatkokäsittely suoritettiin menetelmässä D kuvatulla tavalla.

M) Yleinen menetelmä N-(2-(2-aminoasyyliamido)-2-desoksi-β-D-heksopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksylihappoamidien I (X on -CH₂-, R³ = R⁴ = R⁵ on -H), -O-alkyyli-karbamaattien I (X = -O-, R³ = R⁴ = R⁵ on -H) ja -N'-alkyylikarbamidien I (X on -NH-; R³ = R⁴ = R⁵ on -H) valmistamiseksi

20 10 mmol N-(2-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino)asyyliamido-2-desoksi-β-D-heksopyranosyyli)-N-alkyyli-karboksylihappoamideja (XII) (X on -CH₂-), -O-alkyylikarbamaatteja (XII) (X on -O-) tai -N'-alkyylikarbamideja (XII) (X on -NH-) liuotettiin seokseen, jossa oli 50 ml tetrahydrofuraania, 50 ml metanolia ja 10 ml jäätikkää, ja hydrattiin normaalipaineessa samalla kun läsnä oli 25 1,0 g 10 %:ista palladium/hiili-katalysaattoria. Valmistuserien jatkokäsittely suoritettiin menetelmän G) mukaisesti.

Kohdassa A esitetyn menetelmän mukaan valmistettiin seuraavia yleisen rakenteen IV mukaisia yhdisteitä:

- 5 A.1 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-oktyyliamiini
- A.2 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-desyyliamiini
- 10 A.3 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-dodesyyliamiini
- A.4 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-tetradesyyliamiini
- A.5 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-heksadesyyliamiini
- 15 A.6 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-oktadesyyliamiini
- A.7 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-eikosyyliamiini
- 20 A.8 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-desyyliamiini
- A.9 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galakto-
pyranosyyli)-dodesyyliamiini
- 25 A.10 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galakto-
pyranosyyli)-tetradesyyliamiini
- A.11 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galakto-
pyranosyyli)-heksadesyyliamiini
- A.12 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galakto-
pyranosyyli)-oktadesyyliamiini
- 30

Kohdassa B esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen VI ($X = -CH_2-$) mukaisia yhdisteitä.

- 5 B.1 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktyyli-tetradekaanihappoamidi
- B.2 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktyyli-oktadekaanihappoamidi
- 10 B.3 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-desyyli-dodekaanihappoamidi
- B.4 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-desyyli-tetradekaanihappoamidi
- B.5 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-desyyli-oktadekaanihappoamidi
- 15 B.6 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- B.7 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-tetradekaanihappoamidi
- B.8 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-heksadekaanihappoamidi
- 20 B.9 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- B.10 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-dodekaanihappoamidi
- 25 B.11 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-tetradekaanihappoamidi
- B.12 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-heksadekaanihappoamidi

- B.13 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- B.14 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-eikosaanihappoamidi
- 5 B.15 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-heksadesyyli-dekaanihappoamidi
- B.16 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-heksadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 10 B.17 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-heksadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- B.18 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-heksadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- B.19 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-heksadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 15 B.20 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- B.21 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 20 B.22 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- B.23 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- B.24 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-eikosaanihappoamidi
- 25 B.25 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- 30 B.26 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-tetradekaanihappoamidi

- B.27 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- B.28 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-dodekaanihappoamidi
- 5 B.29 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-tetradekaanihappoamidi
- B.30 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-oktadekaanihappoamidi
- B.31 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
10 -N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- B.32 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- B.32 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi

15

Kohdassa C esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen IX ($X = CH_2$) mukaisia yhdisteitä.

- 20 C.1 N-(3,4,6-tri-O-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- C.2 N-(3,4,6-tri-O-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-tetradekaanihappoamidi
- C.3 N-(3,4,6-tri-O-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi

- C.4 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-dodekaanihappoamidi
- C.5 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-tetradekaanihappoamidi
- 5 C.6 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-oktadekaanihappoamidi
- C.7 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- C.8 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
10 -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- C.9 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- C.10 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
15 -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- C.11 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- C.12 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 20 C.13 N-(3,4,6-tri-0-asetyyli-2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi

Kohdassa E esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen VI ($X = -O-$) mukaisia yhdisteitä.

- E.1 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- 5 E.2 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- E.3 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 10 E.4 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- E.5 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- E.6 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- 15 E.7 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- E.8 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 20 E.9 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- E.10 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- 25 E.11 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- E.12 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- E.13 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesyli-0-tetradesyli-karbamaatti

- E.14 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesylyli-0-heksadesyyli-karbamaatti
- E.15 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesylyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 5 E.16 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- E.17 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-0-tetradesylyli-karbamaatti
- E.18 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
10 -N-oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti

Kohdassa F esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen VI (X = NH-) mukaisia yhdisteitä.

- 15 F.1 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- F.2 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-N'-tetradesylyli-karbamidi
- F.3 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-20 -N-dodesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- F.4 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesylyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- F.5 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesylyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- 25 F.6 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- F.7 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-N'-tetradesylyli-karbamidi

- F.8 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- 5 F.9 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- F.10 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi
- F.11 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- 10 F.12 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- F.13 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi
- 15 F.14 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- F.15 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- F.16 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi
- 20 F.17 N-(2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

Kohdassa G esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen X (X = -CH₂-) mukaisia yhdisteitä.

- 25 G.1 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-dodekaanihappoamidi
- G.2 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-tetradekaanihappoamidi

- G.3 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-heksadekaanihappoamidi
- G.4 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-oktadekaanihappoamidi
- 5 G.5 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-dodekaanihappoamidi
- G.6 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-tetradekaanihappoamidi
- G.7 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-
10 -heksadekaanihappoamidi
- G.8 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-oktadekaanihappoamidi
- G.9 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-
-dodekaanihappoamidi
- 15 G.10 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-
-tetradekaanihappoamidi
- G.11 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-
-heksadekaanihappoamidi
- G.12 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-
20 -oktadekaanihappoamidi
- G.13 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-dodekaanihappoamidi
- G.14 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-tetradekaanihappoamidi
- 25 G.15 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-heksadekaanihappoamidi
- G.16 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-oktadekaanihappoamidi
- G.17 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-
30 -dodekaanihappoamidi

- G.18 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-tetradekaanihappoamidi
- G.19 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-oktadekaanihappoamidi
- 5 G.20 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-dodekaanihappoamidi
- G.21 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-oktadekaanihappoamidi
- G.22 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
10 -dodekaanihappoamidi
- G.23 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-tetradekaanihappoamidi
- G.24 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-oktadekaanihappoamidi

15

Kohdassa H esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen X (X = -O-) mukaisia yhdisteitä niiden etikkahapposuolojen muodossa.

- H.1 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-
20 -dodesyyli-karbamaatti
- H.2 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-
-tetradesyli-karbamaatti
- H.3 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-
-oktadesyyli-karbamaatti
- H.4 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-
25 -0-dodesyyli-karbamaatti
- H.5 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-0-oktadesyyli-karbamaatti
- H.6 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
30 -0-dodesyyli-karbamaatti

- H.7 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-0-tetradesyli-karbamaatti
- H.8 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 5
- H.9 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-0-dodesyyli-karbamaatti
- H.10 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-0-tetradesyli-karbamaatti
- 10 H.11 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-0-oktadesyyli-karbamaatti
- H.12 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradodesyyli-
-0-dodesyyli-karbamaatti
- H.13 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradodesyyli-
-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 15
- H.14 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-0-dodesyyli-karbamaatti
- H.15 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-0-tetradesyli-karbamaatti
- 20 H.16 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-0-oktadesyyli-karbamaatti

Kohdassa I esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen X (X = -NH-) mukaisia yhdisteitä niiden etikkahapposuolojen muodossa.

- 25
- I.1 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-
-dodesyyli-karbamidi
- I.2 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-
-tetradesyli-karbamidi

- I.3 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-
-oktadesyyli-karbamidi
- I.4 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-N'-dodesyyli-karbamidi
- 5 I.5 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-N'-oktadesyyli-karbamidi
- I.6 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-N'-dodesyyli-karbamidi
- I.7 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
10 -N'-tetradesyli-karbamidi
- I.8 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-N'-oktadesyyli-karbamidi
- I.9 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-
15 -N'-dodesyyli-karbamidi
- I.10 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-N'-tetradesyli-karbamidi
- I.11 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-
-N'-oktadesyyli-karbamidi
- 20 I.12 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-N'-dodesyyli-karbamidi
- I.13 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyli-
-N'-oktadesyyli-karbamidi
- I.14 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
25 -N'-dodesyyli-karbamidi
- I.15 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-N'-tetradesyli-karbamidi
- I.16 N-(2-amino-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-
-N'-oktadesyyli-karbamidi

Kohdassa J esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen XII ($X = -CH_2-$) mukaisia yhdisteitä.

- 5 J.1 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.2 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.3 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-heksadekaanihappoamidi
- 10 J.4 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.5 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-tetradesylyli-dodekaanihappoamidi
- J.6 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-tetradesylyli-tetradekaanihappoamidi
- 15 J.7 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-tetradesylyli-heksadekaanihappoamidi
- J.8 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-tetradesylyli-oktadekaanihappoamidi
- 20 J.9 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.10 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.11 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- 25 J.12 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.13 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-
-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi

- J.14 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.15 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- 5 J.16 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.17 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- 10 J.18 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.19 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-heksadekaanihappoamidi
- J.20 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 15 J.21 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.22 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 20 J.23 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-heksadekaanihappoamidi
- J.24 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.25 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 25 J.26 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.27 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- 30 J.28 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-oktadekaanihappoamidi

- J.29 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.30 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 5 J.31 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- J.32 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 10 J.33 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-D-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.34 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-D-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.35 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-D-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-dodekaanihappoamidi
- 15 J.36 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-D-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-oktadekaanihappoamidi
- J.37 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-D-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 20 J.38 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-D-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.39 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-D-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 25 J.40 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-fenyylialaniiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.41 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-fenyylialaniiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.42 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-fenyylialaniiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-dodekaanihappoamidi
- 30

- J.43 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-fenyylialaniiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-oktadekaanihappoamidi
- J.44 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-fenyylialaniiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 5 J.45 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-fenyylialaniiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.46 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-fenyylialaniiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 10 J.47 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-valiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.48 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-valiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.49 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-valiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-dodekaanihappoamidi
- 15 J.50 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-valiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-oktadekaanihappoamidi
- J.51 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-valiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 20 J.52 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-valiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.53 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-valiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 25 J.54 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.55 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-tetradekaanihappoamidi

- J.56 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-heksadekaanihappoamidi
- J.57 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 5 J.58 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-dodekaanihappoamidi
- J.59 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-tetradekaanihappoamidi
- J.60 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
10 - β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-heksadekaanihappoamidi
- J.61 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-oktadekaanihappoamidi
- J.62 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 15 J.63 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.64 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- J.65 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
20 - β -D-glukopyranosyyli)-N-heksadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.66 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.67 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 25 J.68 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- J.69 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi

- J.70 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-sarkosiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.71 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-sarkosiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 5 J.72 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-sarkosiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.73 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-sarkosiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.74 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-sarkosiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 10 J.75 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-sarkosiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.76 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-sarkosiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 15 J.77 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-0-bentsyyli-L-seriiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.78 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-0-bentsyyli-L-seriiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 20 J.79 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-0-bentsyyli-L-seriiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.80 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-0-bentsyyli-L-seriiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.81 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-0-bentsyyli-L-seriiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 25 J.82 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-0-bentsyyli-L-seriiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi

- J.83 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-0-bentsyyli-L-seriiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.84 N-(2-(2,5-di-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-lysiiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- 5 J.85 N-(2-(2,5-di-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-lysiiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.86 N-(2-(2,5-di-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-lysiiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-dodekaanihappoamidi
- J.87 N-(2-(2,5-di-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-lysiiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-oktadekaanihappoamidi
- 10 J.88 N-(2-(2,5-di-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-lysiiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.89 N-(2-(2,5-di-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-lysiiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaani-
happoamidi
- 15 J.90 N-(2-(2,5-di-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-lysiiniamido)-2-
-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.91 N-(2-(bentsyyli-2-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-aspartoyyliamido)-
-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- 20 J.92 N-(2-(bentsyyli-2-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-aspartoyyliamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.93 N-(2-(bentsyyli-2-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-aspartoyyliamido)-
-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-dodekaanihappo-
amidi
- 25

- J.94 N-(2-(bentsyyli-2-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-aspartoyyliamido)-
-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-n-tetradesyli-oktadekaanihappo-
amidi
- 5 J.95 N-(2-(bentsyyli-2-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-aspartoyyliamido)-
-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappo-
amidi
- J.96 N-(2-(bentsyyli-2-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-aspartoyyliamido)-
-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappo-
amidi
- 10 J.97 N-(2-(bentsyyli-2-N-bentsyylioksikarbonyyli-L-aspartoyyliamido)-
-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappo-
amidi
- J.98 N-(2-(2-N-bentsyylioksikarbonyyli-5-0-bentsyyli-L-glutamiiniamido)-
15 -2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.99 N-(2-(2-N-bentsyylioksikarbonyyli-5-0-bentsyyli-L-gluta^{my}iniiniamido)-
-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.100 N-(2-(2-N-bentsyylioksikarbonyyli-5-0-bentsyyli-L-glutamiiniamido)-
20 -2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-dodekaanihappo-
amidi
- J.101 N-(2-(2-N-bentsyylioksikarbonyyli-5-0-bentsyyli-L-glutamiiniamido)-
-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-oktadekaanihappo-
amidi
- J.102 N-(2-(2-N-bentsyylioksikarbonyyli-5-0-bentsyyli-L-glutamiiniamido)-
25 -2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.103 N-(2-(2-N-bentsyylioksikarbonyyli-5-0-bentsyyli-L-glutamiiniamido)-
-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappo-
amidi
- J.104 N-(2-(2-N-bentsyylioksikarbonyyli-5-0-bentsyyli-L-glutamiiniamido)-
30 -2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi

- J.105 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.106 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 5 J.107 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.108 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.109 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 10 J.110 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.111 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 15 J.112 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.113 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 20 J.114 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.115 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.116 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 25 J.117 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi

- J.118 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.119 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- 5 J.120 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- J.121 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.122 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 10 J.123 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- J.124 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli)-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- J.125 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi

Kohdassa J esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen XII (X = 0) mukaisia yhdisteitä.

- 20 J.126 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.127 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-tetradesyyli-karbamaatti
- 25 J.128 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti

- J.129 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.130 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 5 J.131 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.132 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- J.133 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
10 -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- J.134 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.135 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -
15 -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- J.136 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- J.137 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- 20 J.138 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- J.139 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.140 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -
25 -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- J.141 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti

- J.142 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.143 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- 5 J.144 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- J.145 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.146 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 10 J.147 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.148 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- 15 J.149 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- J.150 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- 20 J.151 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-tetradesyli-karbamaatti
- J.152 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 25 J.153 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.154 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyli-0-oktadesyyli-karbamaatti

- J.155 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- J.156 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- 5 J.157 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti

Kohdassa J esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen XII (X = -NH-) mukaisia yhdisteitä.

10

- J.158 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.159 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-tetradesyli-karbamidi
- 15 J.160 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- J.161 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.162 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- 20 J.163 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.164 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-tetradesyli-karbamidi

- J.165 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- 5 J.166 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.167 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi
- J.168 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- 10 J.169 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.170 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- J.171 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
15 - β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.172 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi
- J.173 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-alaniiniamido)-2-desoksi- β -
20 -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- J.174 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli)-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
 β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.175 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
 β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi

- J.176 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- J.177 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- 5 J.178 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-tetradesyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- J.179 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.180 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
10 - β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-tetradesyli-karbamidi
- J.181 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-L-leusiiniamido)-2-desoksi-
- β -D-glukopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- J.182 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
15 -D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.183 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli)-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-tetradesyli-karbamidi
- J.184 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-dodesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- 20 J.185 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.186 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-tetradesyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

- J.187 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- J.188 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi
- 5 J.189 N-(2-(N-bentsyylioksikarbonyyli-glysiiniamido)-2-desoksi- β -
-D-galaktopyranosyyli)-N-oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

Kohdassa M esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen
rakenteen I ($X = -CH_2-$) mukaisia yhdisteitä niiden etikkahap-
po-suolojen muodossa.

10

- M.1 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.2 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 15 M.3 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-heksadekaanihappoamidi
- M.4 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.5 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- 20 M.6 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.7 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-heksadekaanihappoamidi
- 25 M.8 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi

- M.9 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-heksadesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.10 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N
-heksadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 5 M.11 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-heksadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- M.12 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-heksadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.13 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
10 -oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.14 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.15 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- 15 M.16 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.17 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- 20 M.18 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.19 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-heksadekaanihappoamidi
- M.20 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
25 -N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.21 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.22 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 30 M.23 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-heksadekaanihappoamidi

- M.24 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.25 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-heksadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 5 M.26 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-heksadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.27 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-heksadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- M.28 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
10 -N-heksadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.29 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.30 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 15 M.31 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- M.32 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.33 N-(2-D-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
20 -N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.34 N-(2-D-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.35 N-(2-D-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- 25 M.36 N-(2-D-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.37 N-(2-D-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.38 N-(2-D-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
30 -N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi

- M.39 N-(2-D-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 5 M.40 N-(2-L-fenyylialaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.41 N-(2-L-fenyylialaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.42 N-(2-L-fenyylialaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- 10 M.43 N-(2-L-fenyylialaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.44 N-(2-L-fenyylialaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.45 N-(2-L-fenyylialaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 15 M.46 N-(2-L-fenyylialaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.47 N-(2-L-valiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- 20 M.48 N-(2-L-valiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.49 N-(2-L-valiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- 25 M.50 N-(2-L-valiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.51 N-(2-L-valiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.52 N-(2-L-valiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- 30

- M.53 N-(2-L-valiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 5 M.54 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.55 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.56 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-heksadekaanihappoamidi
- 10 M.57 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.58 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.59 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
15 -tetradesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.60 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-heksadekaanihappoamidi
- M.61 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 20 M.62 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-heksadesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.63 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-heksadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.64 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
25 -heksadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- M.65 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-heksadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.66 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 30 M.67 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi

- M.68 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-heksadekaanihappoamidi
- M.69 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 5
- M.70 N-(2-sarkosiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.71 N-(2-sarkosiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 10
- M.72 N-(2-sarkosiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.73 N-(2-sarkosiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.74 N-(2-sarkosiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 15
- M.75 N-(2-sarkosiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.76 N-(2-sarkosiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 20
- M.77 N-(2-L-seriiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.78 N-(2-L-seriiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 25
- M.79 N-(2-L-seriiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.80 N-(2-L-seriiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.81 N-(2-L-seriiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 30

- M.82 N-(2-L-seriiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.83 N-(2-L-seriiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 5
- M.84 N-(2-L-lysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.85 N-(2-L-lysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 10
- M.86 N-(2-L-lysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.87 N-(2-L-lysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.88 N-(2-L-lysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 15
- M.89 N-(2-L-lysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.90 N-(2-L-lysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 20
- M.91 N-(2-L-asparagiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.92 N-(2-L-asparagiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 25
- M.93 N-(2-L-asparagiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.94 N-(2-L-asparagiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi
- M.95 N-(2-L-asparagiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 30

M.96 N-(2-L-asparagiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi

M.97 N-(2-L-asparagiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi

5

M.98 N-(2-L-glutamiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi

M.99 N-(2-L-glutamiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi

10

M.100 N-(2-L-glutamiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi

M.101 N-(2-L-glutamiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi

M.102 N-(2-L-glutamiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi

15

M.103 N-(2-L-glutamiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi

M.104 N-(2-L-glutamiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi

20

M.105 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-dodekaanihappoamidi

M.106 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi

25

M.107 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-dodekaanihappoamidi

M.108 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-oktadekaanihappoamidi

M.109 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi

30

- M.110 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.111 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 5
- M.112 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.113 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 10
- M.114 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesylyi-dodekaanihappoamidi
- M.115 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesylyi-oktadekaanihappoamidi
- M.116 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 15
- M.117 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.118 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 20
- M.119 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-dodekaanihappoamidi
- M.120 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-dodesyyli-oktadekaanihappoamidi
- 25
- M.121 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesylyi-dodekaanihappoamidi
- M.122 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-tetradesylyi-oktadekaanihappoamidi
- M.123 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-dodekaanihappoamidi
- 30

- M.124 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-tetradekaanihappoamidi
- M.125 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-
-N-oktadesyyli-oktadekaanihappoamidi

5

Kohdassa M esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen rakenteen I ($X = 0$) mukaisia yhdisteitä.

- M.126 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
10 -dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.127 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- M.128 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 15 M.129 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.130 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 20 M.131 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.132 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti
- M.133 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
25 -oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- M.134 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.135 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
30 -dodesyyli-0-tetradesyli-karbamaatti

- M.136 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- M.137 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- 5 M.138 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- M.139 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.140 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
10 -oktadesyyli-0-tetradesyyli-karbamaatti
- M.141 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- M.142 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
15 -dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.143 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-0-tetradesyyli-karbamaatti
- M.144 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 20 M.145 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.146 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- 25 M.147 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.148 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-0-tetradesyyli-karbamaatti
- M.149 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
30 -oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti

- M.150 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.151 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-0-tetradesylyli-karbamaatti
- 5 M.152 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- M.153 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-tetradesylyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.154 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
10 -tetradesylyli-0-oktadesyyli-karbamaatti
- M.155 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-0-dodesyyli-karbamaatti
- M.156 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-0-tetradesylyli-karbamaatti
- 15 M.157 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-0-oktadesyyli-karbamaatti

Kohdassa M esitetyn menetelmän mukaan saatiin seuraavia yleisen
rakenteen I (X = -NH-) mukaisia yhdisteitä.

20

- M.158 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- M.159 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-tetradesylyli-karbamidi
- 25 M.160 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- M.161 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesylyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- M.162 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
30 -tetradesylyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

M.163 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi

M.164 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi

5 M.165 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

M.166 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi

10 M.167 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi

M.168 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

15 M.169 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi

M.170 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

20 M.171 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi

M.172 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi

M.173 N-(2-L-alaniiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

25

M.174 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi

M.175 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi

30

M.176 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

- M.177 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- M.178 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- 5 M.179 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- M.180 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi
- M.181 N-(2-L-leusiiniamido-2-desoksi- β -D-glukopyranosyyli)-N-
10 -oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- M.182 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- M.183 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
15 -dodesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi
- M.184 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-dodesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- M.185 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
20 -tetradesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- M.186 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-tetradesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi
- M.187 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-dodesyyli-karbamidi
- M.188 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
25 -oktadesyyli-N'-tetradesyyli-karbamidi
- M.189 N-(2-glysiiniamido-2-desoksi- β -D-galaktopyranosyyli)-N-
-oktadesyyli-N'-oktadesyyli-karbamidi

Fysikaalisia tietoja

Kaikkia kemiallisia reaktioita seurattiin ohutkerroskromatografisesti. Ilmoitetut R_f -arvot saatiin Kieselgel 60-ohutkerroslevyillä (E. Merck, Darmstadt). Eluenttiseosten koostumus on ilmoitettu tilavuusosissa.

Optisen kiertokyvyn arvot määritettiin toiminimen Perkin-Elmer tyyppiä 241 olevalla polarimetrillä yhden dm:n kulhoissa arvossa 589 nm (Na-D-viiva). Aineen konsentraatio C liuoksessa on ilmoitettu %:eina (paino/kg). Alkuaineanalyysit ilmoitetuissa tapauksissa antoivat tyydyttäviä arvoja alkuaineille C, H ja N virherajojen ollessa seuraavat

C + 0,38 %

H + 0,31 %

N + 0,52 %

Tietoja menetelmän A mukaan valmistetuista glykosyyliamiineista, joilla on yleinen kaava IV

R_f -arvot dikloorimetaani/metanoli (5:1)-seoksessa

2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi-D-glukopyranoosi

$R_f = 0,31$

2-bentsyylioksikarbonyyliamino-2-desoksi-D-galaktopyranoosi

$R_f = 0,29$

Valmistetut kaavan IV mukaiset glykosyyliamiinit osoittavat edellämainitussa eluentissa hyvin samantapaisia R_f -arvoja, jotka olivat välillä 0,46 - 0,49. Tällöin oli sellaisilla glykosyyliamiineilla, joissa oli lyhyemmät alkyyliketjut, pienemmät R_f -arvot kuin sellaisilla glykosyyliamiineilla, joissa oli pitemmät alkyyliketjut.

Esimerkit:	Yhdiste	R_f
	A 2	0,47
	A 3	0,47
	A 4	0,47
	A 6	0,49
	A 9	0,46
	A 12	0,48

Tietoja menetelmän B mukaan valmistetuista yhdisteistä,
joilla on yleinen rakenne VI (X = -CH₂-)

R_f-arvot dikloorimetaani/metanoli(10:1)-seoksessa

5	Yhdiste	R _f	Alkuaineanalyysi
	B 3	0,37	
	B 6	0,38	C ₃₈ H ₆₆ N ₂ O ₇
	B 8	0,38	
10	B 9	0,39	C ₄₄ H ₇₈ N ₂ O ₇
	B 10	0,38	C ₄₀ H ₇₀ N ₂ O ₇
	B 12	0,38	C ₄₄ H ₇₈ N ₂ O ₇
	B 13	0,38	C ₄₆ H ₈₂ N ₂ O ₇
	B 16	0,38	C ₄₂ H ₇₄ N ₂ O ₇
	B 20	0,38	C ₄₄ H ₇₈ N ₂ O ₇
15	B 21	0,38	C ₄₆ H ₈₂ N ₂ O ₇
	B 23	0,38	C ₅₀ H ₉₀ N ₂ O ₇
	B 25	0,34	C ₃₈ H ₆₆ N ₂ O ₇
	B 26	0,35	C ₄₀ H ₇₀ N ₂ O ₇
	B 27	0,36	C ₄₄ H ₇₈ N ₂ O ₇
20	B 30	0,36	C ₄₆ H ₈₂ N ₂ O ₇
	B 31	0,36	
	B 33	0,37	C ₅₀ H ₉₀ N ₂ O ₇

Tietoja menetelmän C mukaan valmistetuista yhdisteistä,
joilla on yleinen rakenne IX (X = -CH₂-)

R_f-arvo tolueeni/etanoli (20:1)-seoksessa

5	Yhdiste	R _f	Alkuaine- analyysi	Sulamis- piste (°C)	[α] _D
	C 1	0,36	C ₄₄ H ₇₂ N ₂ O ₁₀		+ 15,6° (c=1,0; THF)
10	C 2	0,36	C ₄₆ H ₇₆ N ₂ O ₁₀	73	+ 14,1° (c=1,0; THF)
	C 6	0,36	C ₅₂ H ₈₈ N ₂ O ₁₀		
	C 7	0,36	C ₅₀ H ₈₄ N ₂ O ₁₀	65	+13,5° (c=1,0; CH ₂ Cl ₂)
15	C 9	0,36			
	C 10	0,33	C ₅₀ H ₈₄ N ₂ O ₁₀		
	C 12	0,33	C ₅₂ H ₈₈ N ₂ O ₁₀		

20 Tietoja menetelmän E mukaan valmistetuista yhdisteistä, joilla on yleinen rakenne VI (X = -O-)

R_f-arvot dikloorimetaani/metanoli (10:1)-seoksessa

25	Yhdiste	R _f	Alkuaine- analyysi
	E 1	0,36	C ₃₉ H ₆₈ N ₂ O ₈
	E 3	0,36	C ₄₅ H ₈₀ N ₂ O ₈
	E 4	0,36	
	E 6	0,36	C ₄₄ H ₈₀ N ₂ O ₈
	E 8	0,36	C ₅₀ H ₉₂ N ₂ O ₈
30	E 9	0,33	C ₃₉ H ₆₈ N ₂ O ₈
	E 11	0,33	C ₄₅ H ₈₀ N ₂ O ₈
	E 15	0,34	C ₄₇ H ₈₄ N ₂ O ₈
	E 17	0,34	C ₄₇ H ₈₄ N ₂ O ₈

Tietoja menetelmän F mukaan valmistetuista yhdisteistä,
joilla on yleinen rakenne VI (X = -NH-)

R_f-arvot dikloorimetaani/metanoli (10:1)-seoksessa

	Yhdiste	R _f	Alkuaine- analyysi
5	F 1	0,30	C ₃₉ H ₆₉ N ₃ O ₇
	F 3	0,30	C ₄₅ H ₈₁ N ₃ O ₇
	F 5	0,30	C ₄₇ H ₈₅ N ₃ O ₇
	F 6	0,30	C ₄₅ H ₈₁ N ₃ O ₇
10	F 8	0,31	C ₅₁ H ₉₃ N ₃ O ₇
	F 9	0,28	
	F 14	0,28	C ₄₇ H ₈₅ N ₃ O ₇
	F 16	0,28	C ₄₇ H ₈₅ N ₃ O ₇

15 Tietoja yleisen menetelmän G mukaan valmistetuista yhdis-
teistä, joilla on yleinen rakenne (X = -CH₂-)

R_f-arvot dikloorimetaani/metanoli/25 %:inen ammoniakkin
vesiliuos (10:1,5:0,1)-seoksessa

	Yhdiste	R _f	Alkuaineanalyysi	[α] _D
20	G 1	0,31	C ₃₀ H ₆₀ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 12,0°; C=1,0; THF
	G 2	0,31	C ₃₂ H ₆₄ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	
	G 3	0,32		
25	G 4	0,33	C ₃₆ H ₇₂ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	
	G 5	0,31	C ₃₂ H ₆₄ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 11,3°; C=1,0; THF
	G 8	0,32	C ₃₈ H ₇₆ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 8,5°; C=1,0; THF
	G 10	0,33	C ₃₆ H ₇₂ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	
	G 13	0,32	C ₃₆ H ₇₂ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 9,7°; C=1,0; THF
30	G 14	0,33	C ₃₈ H ₇₆ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	
	G 15	0,34	C ₄₀ H ₈₀ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	
	G 16	0,34	C ₄₂ H ₈₄ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 7,0°; C=1,0; THF
	G 17	0,29	C ₃₀ H ₆₀ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 24,0°; C=1,0; THF
	G 19	0,29	C ₃₆ H ₇₂ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 21,8°; C=1,0; THF
35	G 22	0,29	C ₃₆ H ₇₂ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	
	G 24	0,31	C ₄₂ H ₈₄ N ₂ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 17,3°; C=1,0; THF

Tietoja yleisen menetelmän H mukaan valmistetuista yhdis-
teistä, joilla on yleinen rakenne X (X = -O-)

R_f-arvot dikloorimetaani/metanoli/25 %:inen ammoniakin
vesiliuos (10:1,5:0,1)-seoksessa

5	Yhdis- te	R _f	Alkuaineanalyysi	[α] _D
	H 2	0,30	C ₃₃ H ₆₆ N ₂ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 8,4°; C=1,0, THF
	H 6	0,30		
	H 8	0,32	C ₄₃ H ₈₆ N ₂ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
10	H 11	0,26		

Tietoja yleisen menetelmän I mukaan valmistetuista yhdis-
teistä, joilla on yleinen rakenne X (X = -NH-)

R_f-arvot dikloorimetaani/metanoli/25 %:inen ammoniakin
vesiliuos (10:1,5:0,1)-seoksessa

15	Yhdis- te	R _f	Alkuaineanalyysi
	I 1	0,26	C ₃₁ H ₆₃ N ₃ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂
	I 3	0,28	
20	I 5	0,28	C ₃₉ H ₇₉ N ₃ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂
	I 11	0,24	C ₃₇ H ₇₅ N ₃ O ₅ x C ₂ H ₄ O ₂
	I 13	0,24	

Tietoja yleisen menetelmän J mukaan valmistetuista yhdisteistä, joilla on yleinen kaava XII (X = -CH₂-)

R_f-arvot dikloorimetaani/metanoli/25 %:inen ammoniakkin vesiliuos (10:1,5:0,1)-seoksessa

5

Yhdiste R_f Alkuaineanalyysi

	J 1	0,33	C ₄₀ H ₆₉ N ₃ O ₈
	J 3	0,35	C ₄₄ H ₇₇ N ₃ O ₈
10	J 4	0,35	C ₄₆ H ₈₁ N ₃ O ₈
	J 5	0,35	C ₄₂ H ₇₃ N ₃ O ₈
	J 7	0,35	C ₄₆ H ₈₁ N ₃ O ₈
	J 8	0,36	C ₄₈ H ₈₅ N ₃ O ₈
	J 10	0,36	C ₄₆ H ₈₁ N ₃ O ₈
15	J 12	0,37	C ₅₀ H ₈₉ N ₃ O ₈
	J 13	0,36	C ₄₆ H ₈₁ N ₃ O ₈
	J 16	0,38	C ₅₂ H ₉₃ N ₃ O ₈
	J 17	0,34	C ₄₁ H ₇₁ N ₃ O ₈
	J 18	0,34	C ₄₃ H ₇₅ N ₃ O ₈
20	J 20	0,35	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₈
	J 21	0,34	C ₄₃ H ₇₅ N ₃ O ₈
	J 23	0,35	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₈
	J 25	0,36	C ₄₅ H ₇₉ N ₃ O ₈
	J 29	0,37	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₈
25	J 31	0,38	C ₅₁ H ₉₁ N ₃ O ₈
	J 34	0,43	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₈
	J 36	0,44	C ₄₉ H ₇₆ N ₃ O ₈
	J 37	0,45	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₈
	J 38	0,45	C ₄₉ H ₈₇ N ₃ O ₈
30	J 41	0,55	C ₅₃ H ₈₇ N ₃ O ₈
	J 43	0,56	C ₅₅ H ₉₁ N ₃ O ₈
	J 45	0,55	C ₅₅ H ₉₁ N ₃ O ₈

Yhdiste R_f Alkuaineanalyysi

	J 47	0,48	C ₄₃ H ₇₅ N ₃ O ₈
	J 50	0,51	C ₅₁ H ₉₁ N ₃ O ₈
5	J 51	0,51	C ₄₉ H ₈₇ N ₃ O ₈
	J 54	0,54	C ₄₄ H ₇₇ N ₃ O ₈
	J 55	0,56	C ₄₆ H ₈₁ N ₃ O ₈
	J 57	0,57	C ₅₀ H ₈₉ N ₃ O ₈
	J 58	0,54	C ₄₆ H ₈₁ N ₃ O ₈
10	J 60	0,57	C ₅₀ H ₈₉ N ₃ O ₈
	J 61	0,58	C ₅₂ H ₉₃ N ₃ O ₈
	J 63	0,57	C ₅₀ H ₈₉ N ₃ O ₈
	J 66	0,58	C ₅₀ H ₈₉ N ₃ O ₈
	J 69	0,59	C ₅₆ H ₁₀₁ N ₃ O ₈
15	J 71	0,42	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₈
	J 74	0,42	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₈
	J 75	0,42	C ₄₉ H ₈₇ N ₃ O ₈
	J 77	0,35	C ₄₈ H ₇₇ N ₃ O ₉
	J 79	0,35	C ₅₀ H ₈₁ N ₃ O ₉
20	J 80	0,37	C ₅₆ H ₉₃ N ₃ O ₉
	J 84	0,54	C ₅₂ H ₈₈ N ₄ O ₁₀
	J 86	0,55	C ₅₄ H ₈₈ N ₄ O ₁₀
	J 88	0,55	C ₅₈ H ₉₆ N ₄ O ₁₀
	J 90	0,57	C ₆₄ H ₁₀₈ N ₄ O ₁₀
25	J 91	0,58	C ₄₉ H ₇₇ N ₃ O ₁₀
	J 92	0,58	C ₅₅ H ₈₉ N ₃ O ₁₀
	J 96	0,60	C ₅₇ H ₉₃ N ₃ O ₁₀
	J 98	0,48	C ₅₀ H ₇₉ N ₃ O ₁₀
	J 99	0,50	C ₅₆ H ₉₁ N ₃ O ₁₀
30	J 102	0,51	C ₅₆ H ₉₁ N ₃ O ₁₀
	J 103	0,51	C ₅₈ H ₉₅ N ₃ O

Yhdiste R_f Alkuaineanalyysi

5	J 105	0,28	C ₄₀ H ₆₉ N ₃ O ₈
	J 109	0,30	C ₄₆ H ₈₁ N ₃ O ₈
	J 116	0,32	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₈
	J 122	0,54	C ₅₂ H ₉₃ N ₃ O ₈
	J 123	0,54	C ₅₀ H ₈₉ N ₃ O ₈
	J 124	0,54	C ₅₂ H ₉₃ N ₃ O ₈

10 Yhdisteet, joilla on yleinen kaava XII (X = -O-)

Yhdiste R_f Alkuaineanalyysi

15	J 127	0,31	C ₄₃ H ₇₅ N ₃ O ₉
	J 131	0,34	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₉
	J 133	0,35	C ₅₃ H ₉₅ N ₃ O ₉
	J 135	0,32	C ₄₄ H ₇₇ N ₃ O ₉
	J 139	0,34	C ₄₈ H ₈₅ N ₃ O ₉
	J 143	0,53	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₉
20	J 147	0,55	C ₅₁ H ₉₁ N ₃ O ₉
	J 149	0,58	C ₅₇ H ₁₀₃ N ₃ O ₉
	J 151	0,27	C ₄₃ H ₇₅ N ₃ O ₉
	J 152	0,28	C ₄₇ H ₈₃ N ₃ O ₉

25 Yhdisteet, joilla on yleinen kaava XII (X = -NH-)

Yhdiste R_f Alkuaineanalyysi

30	J 158	0,29	C ₄₁ H ₇₂ N ₄ O ₈
	J 160	0,32	C ₄₇ H ₈₄ N ₄ O ₈
	J 162	0,32	C ₄₉ H ₈₈ N ₄ O ₈
	J 170	0,32	C ₅₀ H ₉₀ N ₄ O ₈
	J 174	0,50	C ₄₅ H ₈₀ N ₄ O ₈
	J 176	0,53	C ₅₁ H ₉₂ N ₄ O ₈
	J 178	0,53	C ₅₃ H ₉₆ N ₄ O ₈
35	J 184	0,26	C ₄₇ H ₈₄ N ₄ O ₈
	J 186	0,26	C ₄₉ H ₈₈ N ₄ O ₈

Tietoja yleisen menetelmän M mukaan valmistetuista yhdis-
teistä, joilla on yleinen kaava I (X = -CH₂-)

R_f-arvot dikloorimetaani/metanoli/25 %:inen ammoniakkin
vesiliuos (10:3:0,4)-seoksessa

5	Yhdis-	R _f	Alkuaineanalyysi	[α] _D
	M 1	0,23	C ₃₂ H ₆₃ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 19,9°; C=1,0, THF
	M 3		C ₃₆ H ₇₁ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
10	M 4		C ₃₈ H ₇₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 12,4°; C=1,0, THF
	M 5	0,21	C ₃₄ H ₆₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 7		C ₃₈ H ₇₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 8	0,26	C ₄₉ H ₇₉ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 12,5°; C=1,0, HOAc
	M 10		C ₃₈ H ₇₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
15	M 12		C ₄₂ H ₈₃ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 13	0,22	C ₃₈ H ₇₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+17,3°; C=1,0; THF
	M 16	0,23	C ₄₄ H ₈₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+12,5°; C=1,0; THF
	M 17	0,19	C ₃₃ H ₆₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 18		C ₃₅ H ₆₉ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
20	M 20	0,21	C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+20,0°; C=1,0; THF
	M 21		C ₃₅ H ₆₉ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 23		C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 25	0,21	C ₃₇ H ₇₃ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 29		C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+19,7°; C=1,0; THF
25	M 31	0,23	C ₄₃ H ₈₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+12,6°; C=1,0; THF
	M 34		C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 36		C ₄₁ H ₈₁ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 37	0,17	C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+18,3°; C=1,0; THF
	M 38		C ₄₁ H ₈₁ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
30	M 41	0,63	C ₄₅ H ₈₁ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 9,5°; C=1,0; THF
	M 43		C ₄₇ H ₈₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 45	0,63	C ₄₇ H ₈₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+10,1°; C=1,0; THF
	M 47	0,51	C ₃₅ H ₆₉ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 50		C ₄₃ H ₈₉ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
35	M 51	0,49	C ₄₁ H ₈₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+17,3°; C=1,0; DMF
	M 54	0,47	C ₃₆ H ₇₁ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+17,6°; C=1,0; THF

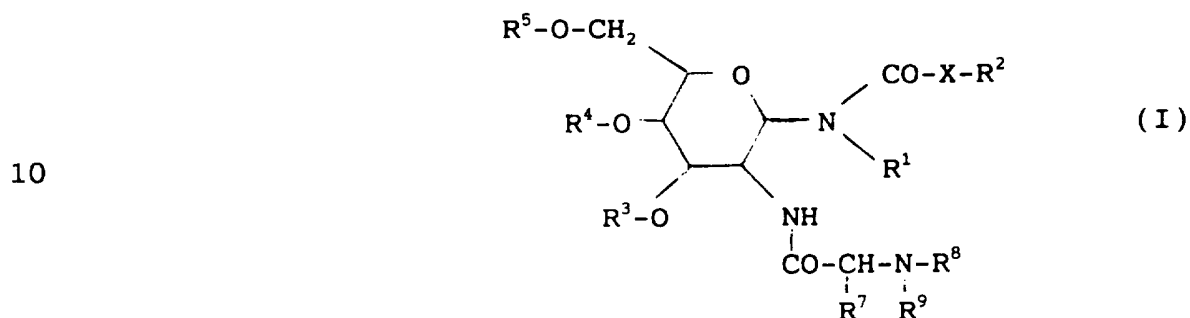
Yhdiste	R _f	Alkuaineanalyysi	[α] _D
M 55	0,47	C ₃₈ H ₇₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 57		C ₄₂ H ₈₃ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 58	0,49	C ₃₈ H ₇₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+16,2°; C=1,0; THF
M 60		C ₄₂ H ₈₃ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 61	0,52	C ₄₄ H ₈₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+16,4°; C=1,0; THF
M 63		C ₄₂ H ₈₃ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 66	0,51	C ₄₂ H ₈₃ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+13,5°; C=1,0; THF
M 69		C ₄₈ H ₉₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 71		C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 74	0,27	C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 9,6°; C=1,0; THF
M 75		C ₄₁ H ₈₁ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 77	0,19	C ₃₃ H ₆₅ N ₃ H ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	+ 3,8°; C=1,0; THF
M 79		C ₃₅ H ₆₉ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 80	0,22	C ₄₁ H ₈₁ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 84	0,01	C ₃₆ H ₇₂ N ₄ O ₆ x 2(C ₂ H ₄ O ₂)	+15,7°; C=1,0; THF
M 86		C ₃₈ H ₇₆ N ₄ O ₆ x 2(C ₂ H ₄ O ₂)	
M 88	0,01	C ₄₃ H ₈₄ N ₄ O ₆ x 2(C ₂ H ₄ O ₂)	+15,5°; C=1,0; FHF
M 90		C ₄₈ H ₉₆ N ₄ O ₆ x 2(C ₂ H ₄ O ₂)	
M 91		C ₃₄ H ₆₅ N ₃ O ₈	
M 92	0,05	C ₄₉ H ₇₇ N ₃ O ₈	+20,1°; C=1,0; HOAc
M 96	0,04	C ₄₂ H ₈₁ N ₃ O ₈	
M 98	0,02	C ₃₅ H ₆₇ N ₃ O ₈	+15,9°; C=1,0; HOAc
M 99		C ₄₁ H ₇₉ N ₃ O ₈	
M 102	0,02	C ₄₁ H ₇₉ N ₃ O ₈	+15,4°; C=1,0; HOAc
M 103		C ₃₂ H ₈₃ N ₃ O ₈	
M 105	0,20	C ₃₂ H ₆₃ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+28,6°; C=1,0; THF
M 109	0,21	C ₃₈ H ₇₅ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 166	0,21	C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+30,4°; C=1,0; THF
M 122	0,45	C ₄₄ H ₈₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
M 123	0,45	C ₃₂ H ₈₃ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+24,1°; C=1,0; THF
M 124	0,45	C ₄₄ H ₈₇ N ₃ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	

Yhdisteet, joilla on yleinen kaava I (X = -O-)

	Yhdiste	R _f	Alkuaineanalyysi	[α] _D
5	M 127	0,20	C ₃₅ H ₆₉ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	+18,1°; C=1,0; THF
	M 131	0,22	C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 133	0,22	C ₄₅ H ₈₉ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 135	0,17	C ₃₆ H ₇₁ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	+17,4°; C=1,0; THF
10	M 139	0,19	C ₄₀ H ₇₉ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 143	0,44	C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	+16,4°; C=1,0; THF
	M 147	0,45	C ₄₃ H ₈₅ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 149	0,45	C ₃₈ H ₉₇ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 151	0,20	C ₃₅ H ₆₉ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	+25,3°; C=1,0; THF
	M 152	0,20	C ₃₉ H ₇₇ N ₃ O ₇ x C ₂ H ₄ O ₂	
15	M 158	0,19	C ₃₃ H ₆₆ N ₄ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	+14,2°; C=1,0; THF
	M 160	0,20	C ₃₉ H ₇₈ N ₄ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 162	0,20	C ₄₁ H ₈₂ N ₄ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 170	0,20	C ₄₂ H ₈₄ N ₄ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 174	0,39	C ₃₇ H ₇₄ N ₄ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
20	M 176	0,43	C ₄₃ H ₈₅ N ₄ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 178	0,43	C ₄₅ H ₉₀ N ₄ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 184	0,16	C ₃₉ H ₇₈ N ₄ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	
	M 186	0,16	C ₄₁ H ₈₂ N ₄ O ₆ x C ₂ H ₄ O ₂	

Patenttivaatimukset

1. Menetelmä uusien terapeuttisesti käyttökelpois-
 ten kaavan I mukaisten N-glykosyyliamidien, N-glykosyyli-
 5 karbamidien ja N-glykosyylikarbamaattien valmistamiseksi



15 jossa

R¹ tarkoittaa tyydytettyä tai yksinkertaisesti tai monin-
 kertaisesti tyydyttämätöntä alkyylitähdettä, jossa on 10 -
 20 hiiliatomia;

X on -CH₂-, -O- tai -NH-;

20 R² tarkoittaa vetyä tai tyydytettyä tai yksinkertaisesti
 tai moninkertaisesti tyydyttämätöntä alkyylitähdettä, jos-
 sa on 10 - 20 hiiliatomia;

R³, R⁴ ja R⁵ tarkoittavat toisistaan riippumattomasti vetyä
 tai asyyliä -CO-R⁶, jolloin R⁶ tarkoittaa alkyylitähdettä,
 25 jossa on enintään 10 hiiliatomia;

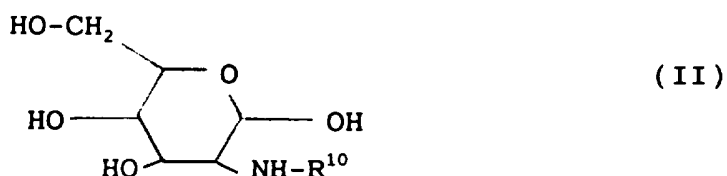
R⁷ tarkoittaa vetyä, C₁-C₇-alkyyliä, hydroksimetyyliä, 1-
 hydroksietyyliä, merkaptometyyliä, 2-(metyylitio)etyyliä,
 3-aminopropyliä, 3-ureidopropyliä, 3-guanidyyliä, 3-propyyliä,
 4-aminobutyliä, karboksietyyliä, karbamoyylimetyy-
 30 liä, 2-karboksietyyliä, 2-karbamoylietyyliä, bentsyyliä,
 4-hydroksibentsyyliä, 3-indolyylimetyyliä tai 4-imidatsol-
 yylimetyyliä;

R⁸ tarkoittaa vetyä tai metyyliä ja

R⁹ tarkoittaa vetyä, metyyliä, asetyyliä, bentsoyyliä, tri-
 35 klooriasetyyliä, trifluoriasetyyliä, metoksykarbonyyliä,
 t-butylioksykarbonyyliä tai bentsyylioksykarbonyyliä, ja

R⁸ ja R⁹ voivat yhdessä tarkoittaa tähdettä -CH₂-CH₂-CH₂-,
 myös L- tai R-muodossa tai mahdollisesti sisäisen,
 farmaseuttisesti käyttökelpoisen suolansa muodossa,
 t u n n e t t u siitä, että 2-amino-2-desoksi-glykopyra-
 noosijohdannainen, jolla on kaava II

5



10

jossa

R¹⁰ tarkoittaa aminoryhmien suojaksi tarkoitettua, pepti-
 dien synteesistä tunnettua ja mahdollisesti selektiivises-
 ti lohkaistavissa olevaa suojaryhmää,

15

saatetaan reagoimaan ensimmäisessä reaktiovaiheessa
 amiinien kanssa, joilla on kaava III



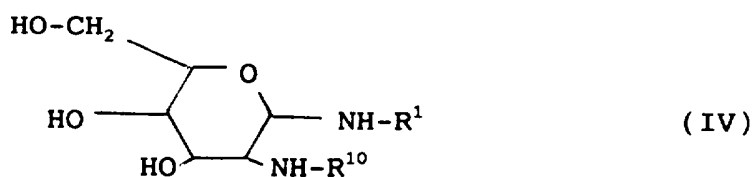
20

jossa

R¹ tarkoittaa tyydytettyä tai yksinkertaisesti tai monin-
 kertaisesti tyydyttämätöntä alkyyli-tähdettä, jossa on 10 -
 20 hiiliatomia,

glykosyyliamiineiksi, joilla on kaava IV

25



30

ja sen jälkeen glykosyyliamiinit, joilla on kaava IV, saa-
 tetaan reagoimaan

a) sopivien karboksyylihappojohdannaisten kanssa,
 joilla on kaava V

35

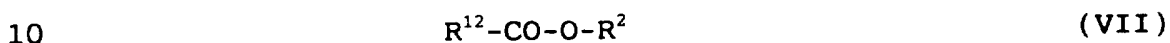


jossa

R^2 tarkoittaa vetyä tai tyydytettyä tai yksinkertaista tai moninkertaista tyydyttämätöntä alkyylitähdettä, jossa on 10 - 20 hiiliatomia, ja

5 R^{11} tarkoittaa halogeenia tai tähdettä $-O-CO-R^2$ tai $-O-CO-O-(C_1-C_5)$ -alkyyliä, tai

b) halogeenimuurahaishappoesterin VII kanssa



jossa

R^{12} tarkoittaa halogeenia, ja

R^2 tarkoittaa samaa kuin edellä,

tai

15 c) isosyanaatin VIII kanssa

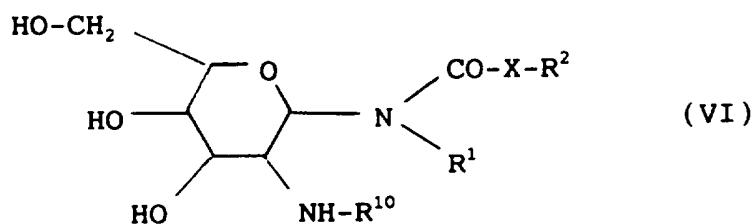


jossa

R^2 tarkoittaa samaa kuin edellä;

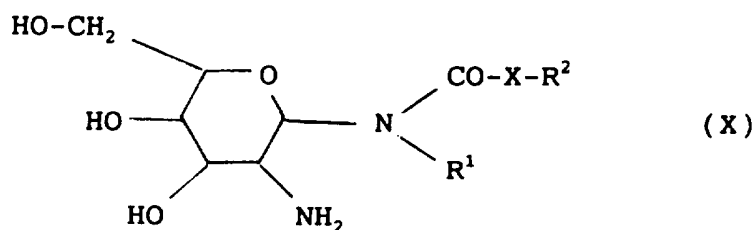
20 saadut glykosyyliamidit VI ($X = -CH_2-$), glykosyyli-karbamaatit VI ($X = -O-$) tai glykosyylikarbamidit VI ($X = -NH-$) joko puhdistetaan kromatografisesti tai esteröidään sokeritähteiden hydroksyyli ryhmien osalta, kiteytetään ja sen jälkeen saippuoitetaan;

25 saaduista yhdisteistä, joilla on kaava VI



35 jossa symboleilla R^1 , R^2 , X ja R^{10} on edellä esitetyt merkitykset lohkaistaan suojaryhmä $-R^{10}$ pois yhdisteiden saamiseksi, joilla on kaava X

5



yhdisteet, joilla on kaava X, saatetaan reagoimaan aminohappojohdannaisien kanssa, joilla on kaava XI

10



jossa

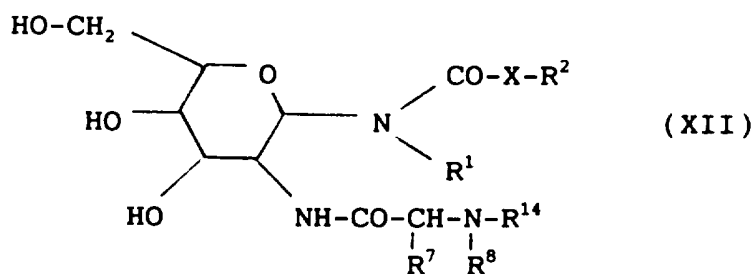
R^7 tarkoittaa samaa kuin edellä;

R^8 tarkoittaa vetyä tai alkyyliryhmää ja

R^{14} tarkoittaa peptidisynteesissä tavallisesti käytettyä, selektiivisesti uudelleen lohkaistavissa olevaa suojaryhmää, jolloin saadaan peptidiyhdiste;

yhdisteiksi, joilla on kaava XII

20



25

saatu kaavan XII mukainen yhdiste puhdistetaan kromatografisesti ja sen jälkeen saatetaan reagoimaan lohkaistavalla ryhmällä $-\text{R}^{14}$ pois, jolloin saadaan amidi-, uretaani- tai karbamidifunktio, kaavan I mukaisiksi yhdisteiksi,

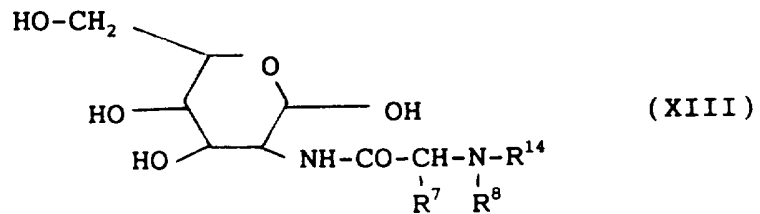
30

tai ensiksi esteröidään sokerihydroksyyli-ryhmien osalta, kiteytetään, saippuoitetaan ja sen jälkeen lohkaistaan tähde $-\text{R}^{14}$ pois, jolloin saadaan amidi-, uretaani- tai karbamidifunktio, kaavan I mukaisten yhdisteiden valmistamiseksi.

35

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen menetelmä kaavan I mukaisten yhdisteiden valmistamiseksi, tunnettu siitä, että yhdiste, jolla on kaava XIII

5



10

jossa symboleilla R^7 , R^8 ja R^{14} on patenttivaatimuksessa 1 esitetyt merkitykset,

saatetaan reagoimaan yhdisteiden kanssa, joilla on kaava III

15



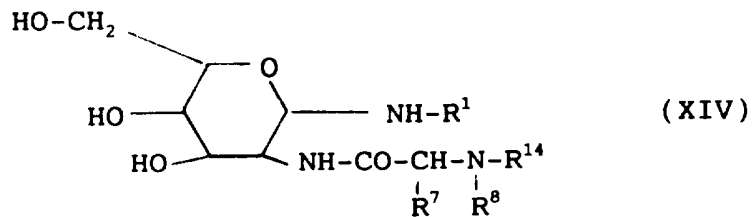
jossa

R^1 tarkoittaa tyydytettyä tai yksinkertaisesti tai moninkertaisesti tyydyttämätöntä alkyylitähdettä, jossa on 10 - 20 hiiliatomia,

20

yhdisteiksi, joilla on kaava XIV

25



30

jossa symboleilla R^1 , R^7 , R^8 ja R^{14} on edellä tai patenttivaatimuksessa 1 esitetyt merkitykset,

yhdisteet, joilla on kaava XIV, saatetaan reagoimaan

a) sopivien karboksyylihapojohdannaisten kanssa, joilla on kaava V

35



jossa

R^2 tarkoittaa vetyä tai tyydytettyä tai yksinkertaista tai moninkertaista tyydyttämätöntä alkyylitähdettä, jossa on 10 - 20 hiiliatomia, ja

5 R^{11} tarkoittaa halogeenia tai tähdettä $-O-CO-R^2$ tai $-O-CO-O-(C_1-C_5)$ -alkyyliä, tai

b) halogeenimuurahaishappoesterin VII kanssa

10 $R^{12}-CO-O-R^2$ (VII)

jossa

R^{12} tarkoittaa halogeenia, ja

R^2 tarkoittaa samaa kuin edellä, tai

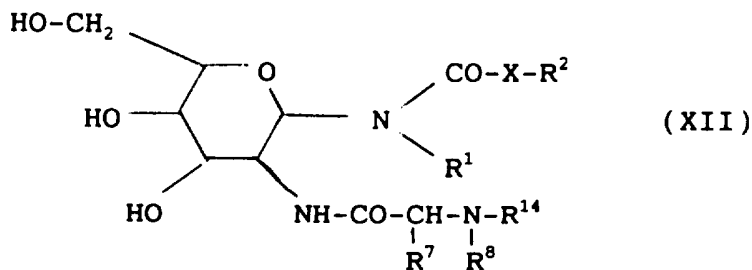
15 c) isosyanaatin VIII kanssa

R^2-NCO (VIII)

jossa

R^2 tarkoittaa samaa kuin edellä,

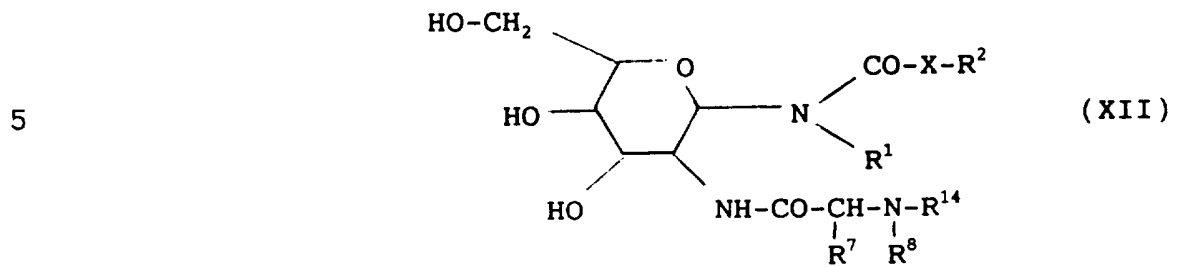
20 ja näin saadut yhdisteet, joilla on kaava XII



30 jossa symboleilla R^1 , R^2 , X , R^7 , R^8 ja R^{14} on edellä tai patenttivaatimuksessa 1 esitetyt merkitykset,

saatetaan reagoimaan patenttivaatimuksessa 1 esitetyllä tavalla kaavan I mukaisiksi yhdisteiksi.

3. Yhdiste, jonka kaava on

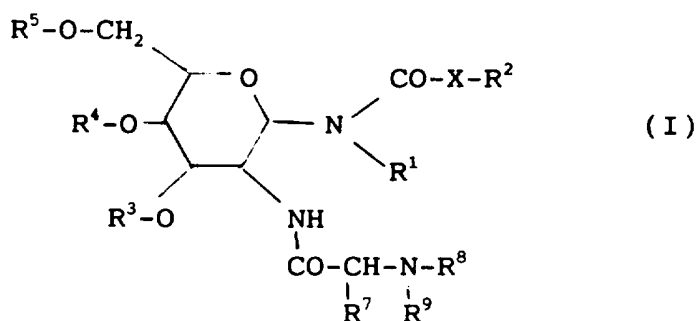


10 jossa
 symboleilla R^1 , R^2 , R^7 ja X on patenttivaatimuksessa 1 esi-
 tetyt merkitykset,
 R^8 tarkoittaa vetyä tai metyyliä, ja
 R^{14} tarkoittaa peptidisynteessissä tavallisesti käytettyä
 15 selektiivisesti uudelleen lohkaistavissa olevaa suojaryh-
 mää,

jolloin saadaan peptidiyhdiste.

Patentkrav

1. Förfarande för framställning av nya terapeutiskt användbara N-glykosylamider, N-glykosylkarbamider och N-glykosylkarbamater med formeln I



15 vari

R¹ betecknar en mättad eller enkelt eller mångdubbelt omättad alkylrest med 10 - 20 kolatomer;

X är -CH₂-, -O- eller -NH-;

20 R² betecknar väte eller en mättad eller enkelt eller mångdubbelt omättad alkylrest med 10 - 20 kolatomer;

R³, R⁴ och R⁵ betecknar oberoende av varandra väte eller acyl -CO-R⁶, varvid R⁶ betecknar en alkylrest med högst 10 kolatomer;

25 R⁷ betecknar väte, C₁-C₇-alkyl, hydroximetyl, 1-hydroxietyl, merkaptometyl, 2-(metyltio)etyl, 3-aminopropyl, 3-ureidopropyl, 3-guanidylpropyl, 4-aminobutyl, karboximetyl, karbamoylmetyl, 2-karboxietyl, 2-karbamoyletyl, bensyl, 4-hydroxibensyl, 3-indolylmetyl eller 4-imidazyilmetyl;

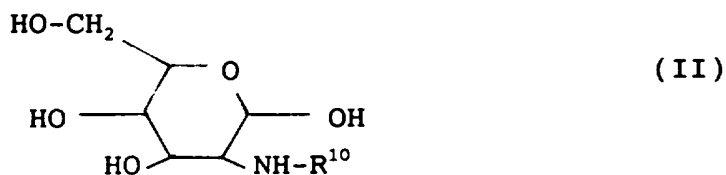
R⁸ betecknar väte eller metyl och

30 R⁹ betecknar väte, metyl, acetyl, bensoyl, trikloracetyl, trifluoracetyl, metoxikarbonyl, t-butyloxikarbonyl eller bensyloxikarbonyl, och R⁸ och R⁹ kan tillsammans beteckna resten -CH₂-CH₂-CH₂-;

35 även i L- eller R-form eller eventuellt i form av ett inre farmaceutiskt godtagbart salt, k ä n n e -

t e c k n a t därav, att ett 2-amino-2-desoxiglykopyrano-
siddervat med formeln II

5



vari R^{10} betecknar en aminoskyddsgrupp känd från peptider-
nas syntetik och eventuellt selektivt avspjälkbar,
i ett första reaktionssteg bringas att reagera med
aminer med formeln III

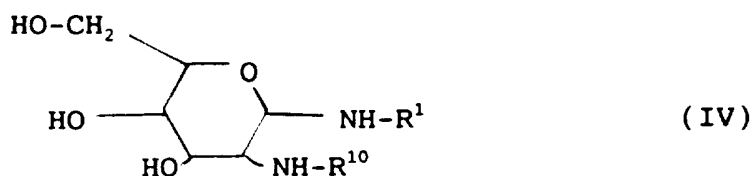
15



vari

R^1 betecknar en mättad eller enkelt eller mångdubbelt omät-
tad alkylrest med 10 - 20 kolatomer,
till glykosaminer med formeln IV

20



25

och därefter bringas glykosaminerna med formeln IV att
reagera med

a) lämpliga karboxylsyrederivat med formeln V

30



vari

R^2 betecknar väte eller en mättad eller enkelt eller mång-
dubbelt omättad alkylrest med 10 - 20 kolatomer, och
35 R^{11} betecknar halogen eller en rest $-O-CO-R^2$ eller
 $-O-CO-O-(C_1-C_5)$ -alkyl;

eller

b) en halogenmyrsyreester med formeln VII



5

vari

R^{12} betecknar halogen, och

R^2 betecknar samma som ovan;

eller

10

c) ett isocyanat med formeln VIII



vari

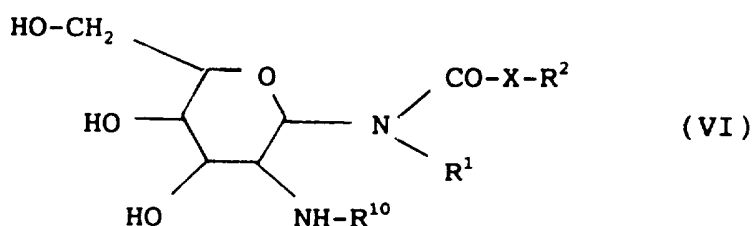
15

R^2 betecknar samma som ovan;

de erhållna glykosamiderna VI ($X = -CH_2-$), glykosylkarbamaterna VI ($X = -O-$) eller glykosylkarbamiderna VI ($X = -NH-$) renas antingen kromatografiskt eller förestras vid sockerresternas hydroxylgrupper, kristalliseras och därefter förtvålas;

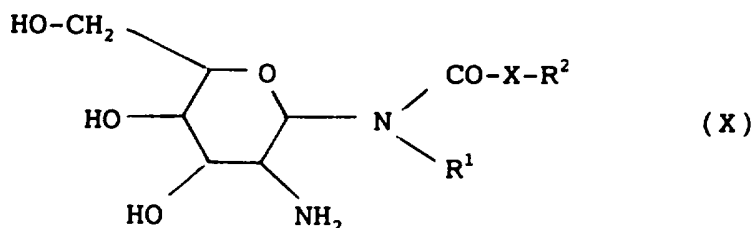
20

från de erhållna föreningarna med formeln VI

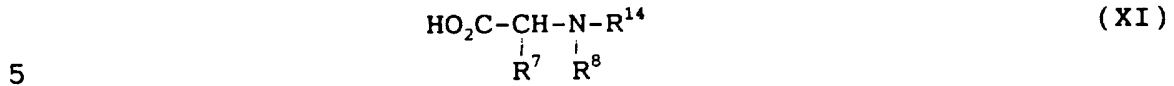


vari symbolerna R^1 , R^2 , X och R^{10} betecknar samma som ovan, avspjälkes skyddsgruppen $-R^{10}$ för att erhålla föreningarna med formeln X

30



föreningarna med formeln X bringas att reagera med aminosyrederivat med formeln XI



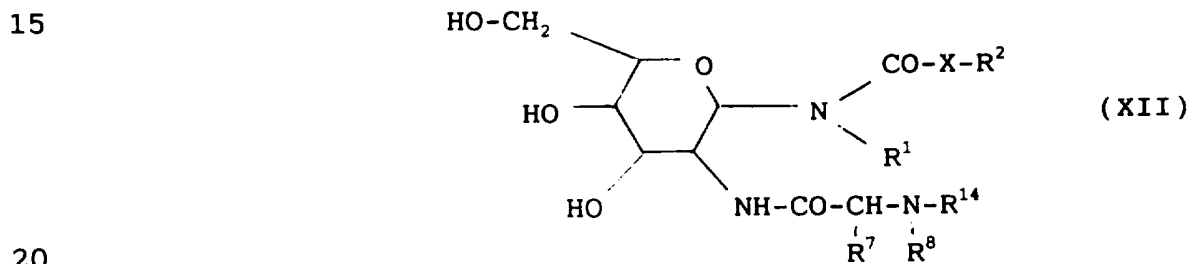
vari

R⁷ betecknar samma som ovan;

R⁸ betecknar väte eller alkyl och

10 R¹⁴ betecknar en i samband med peptidsynteser vanligen använd skyddsgrupp som kan avspjälkas selektivt, varvid en peptidförening erhålls;

till föreningar med formeln XII

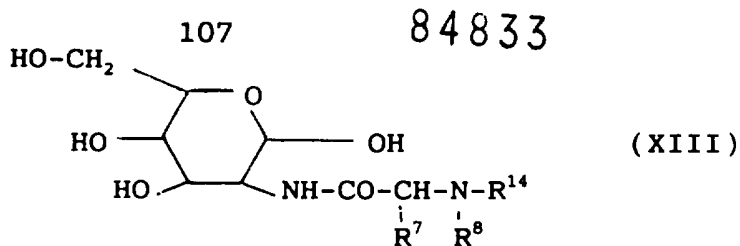


den erhållna föreningen med formeln VII renas kromatografiskt och bringas därefter att reagera genom avspjälkning av gruppen -R¹⁴, varvid amid-, uretan- eller

25 karbamidfunktionen erhålls, till föreningen med formeln I,

eller först förestras sockerhydroxylgrupperna, kristalliseras, förtvålas och därefter avspjälkas resten -R¹⁴, varvid amid-, uretan- eller karbamidfunktionen erhålls, för framställning av föreningar med formeln I.

30 2. Förfarande enligt patentkravet 1 för framställning av föreningar med formeln I, k ä n n e t e c k - n a t därav, att en förening med formeln XIII



5

vari symbolerna R^7 , R^8 och R^9 betecknar samma som i patentkravet 1,

bringas att reagera med föreningen med formeln III

10

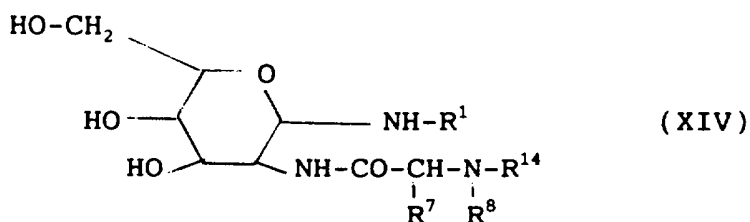


vari

R^1 betecknar en mättad eller enkelt eller mångdubbelt omättad alkylrest med 10 - 20 kolatomer,

15

till en förening med formeln XIV



20

vari symbolerna R^1 , R^7 , R^8 och R^{14} betecknar samma som ovan eller i patentkravet 1,

25

föreningarna med formeln XIV bringas att reagera
a) med lämpliga karboxylsyrederivat med formeln V



30

vari

R^2 betecknar väte eller en mättad eller enkelt eller mångdubbelt omättad alkylrest med 10 - 20 kolatomer och R^{11} betecknar halogen eller en rest $-O-CO-R^2$ eller $-O-CO-O-(C_1-C_5)$ -alkyl;

35

eller

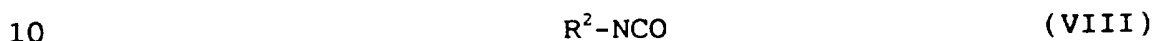
b) med en halogenmyrsyreester med formeln VII



vari

5 R^{12} betecknar halogen, och
 R^2 betecknar samma som ovan,
 eller

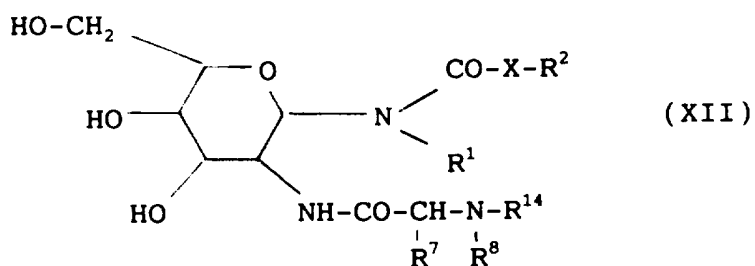
c) med ett isocyanat med formeln VIII



vari

R^2 betecknar samma som ovan,
 och de sålunda erhållna föreningarna med formeln

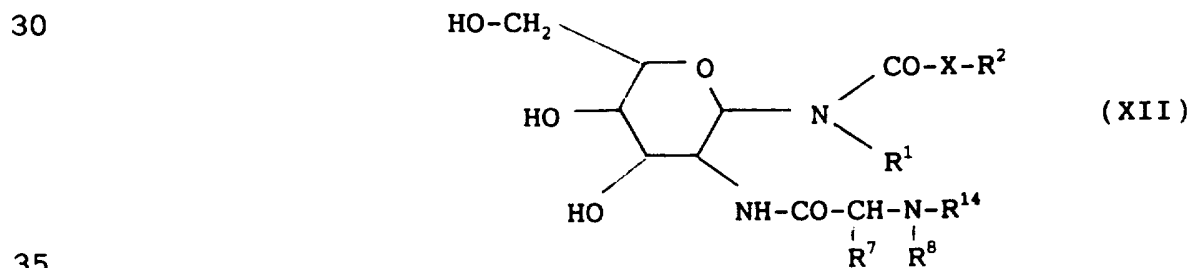
15 XII



25 vari symbolerna R^1 , R^2 , X , R^7 , R^8 och R^{14} betecknar samma som
 ovan,

bringas att reagera på så sätt som beskrivet i pa-
 tentkravet 1 till föreningar med formeln I.

3. Förening med formeln



35

vari

symbolerna R^1 , R^2 , R^7 och X betecknar samma som i patentkravet 1,

R^8 betecknar väte eller metyl, och

5 R^{14} betecknar en i samband med peptidsynteser vanligen använd skyddsgrupp som kan avspjälkas selektivt,
varvid en peptidförening erhålls.