

Tio-digalaktózid 3,3'-helyzeteiben történő módosításai

Modifications to the 3,3'-positions of thio-digalactoside

HÖGYE Fanni¹, FARKAS László Bence², TIMÁRI István³,
ILLYÉS Tünde Zita⁴, SZILÁGYI László⁵, BAJZA István⁶

Debreceni Egyetem, Természettudományi és Technológiai Kar,
Szerves Kémiai Tanszék¹⁻⁵, GlycOptim Biotechnológiai Kft.⁶
4032, Debrecen Egyetem tér 1., tel.: (06-52) 512-900/22470,
fax: (06-52) 512-744, e-mail: lszilagyi@unideb.hu

honlap: <https://kemia.unideb.hu/hu/bemutakozas-szerves-kemiai-tanszek>

ABSTRACT

In the living organism, proteins play an important role in carrying out biological processes. These processes are usually based on protein-glycan interactions. Changes in galectin expression can be observed in tumors, cardiovascular disorders and other pathological processes. Abnormal regulation of galectin-3 can cause this type of disease. It is known that derivatives containing aromatic substituents at the C-3,3' position of thiodigalactoside (TDG) showed strong binding in binding studies with Gal-3. The aim of our research is to synthesize new TDG derivatives that can be potential inhibitors of the Gal-3 lectin. Knowing these, our synthetic objective includes the formation of aralkyl substituents in the C-3,3' positions of TDG via oxygen or/and sulfur atoms. In our research group, we have developed a new method for the synthesis of the starting thiodigalactoside. The binding studies of the 3,3'-di-*O*-aralkyl TDG derivatives were confirmed by ¹H STD NMR measurements. A synthesis strategy was developed for the preparation of 3,3'-di-*S*-aralkyl TDG derivatives.

Keywords: thiodigalactoside, 3,3'-di-*O*-aralkyl TDG derivatives, 3,3'-dideoxy-*S*-aralkil TDG synthesis strategy, ¹H STD NMR spectroscopy, galectin-3

ÖSSZEFOGLALÓ

Az élő szervezetben, a biológiai folyamatok elvégzésében a fehérjék fontos szerepet játszanak. Tumorokban, kardiovaszkuláris rendellenességekben és más patológias folyamatokban a galektin-expresszió változásai figyelhetők meg. A galektin-3 rendellenes szabályozása okozhat ilyen típusú megbetegedéseket. Ismert, hogy a tio-digalaktózid (TDG) C-3,3' helyzeteiben, aromás szubsztituenseket tartalmazó származékok erős kötődést mutattak Gal-3 lektinhez. Kutatásunk célja, olyan további szénhidrát-származékok szintetizálása, melyek potenciális inhibitorai a Gal-3 lektinnek. Ezen új TDG származékban az aralkil szubsztituensek oxigén és/vagy kén atomokon keresztül kapcsolódnak C-3,3' helyzetekben. Kutatócsoportunkban új módszert dolgoztunk ki thiodiglikozidok előállítására, melynek számtalan előnye van. A 3,3'-di-*O*-aralkil TDG származékok kötődési vizsgálatait ¹H STD NMR mérésekkel igazoltuk; a 3,3'-di-*S*-aralkil TDG származékok előállítására szintézis stratégiát dolgoztunk ki.

Kulcsszavak: tio-diglikozid, 3,3'-dideoxi-*S*-aralkil TDG szintézis stratégia, ¹H STD NMR spektroszkópia, galektin-3