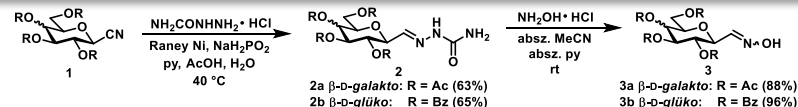


Bevezetés

A szénhidrátok jelentős szerepet játszanak számos biológiai folyamatban, többek között a sejtadhézióban, a sejtsztódásban, az áttétképződésben, az immunválaszban, a gyulladásban, valamint a bakteriális és vírusfertőzésekben.¹ E jelenségek teljes megértéséhez elengedhetetlen a szénhidrátok és származékaik biológiai szerepének részletes megértése molekuláris szinten.¹ A szerkezet – hatás összefüggések felderítéséhez szükség van az ún. glikomimetikumoknak, a természetes szénhidrát molekulák szerkezeti és funkcionális analógjainak előállítására is. Kutatócsoportunkban egyszerű módszert dolgoztak ki anhidro-aldóz oximok anhidro-aldehidonitrilekből történő előállítására: a glikozil-cianid redukciója során képződő imin köztiterméket *in situ* reagáltatták szemikarbaziddal, majd a képződő szemikarbazon transziminálási reakcióját hidroxilamin-hidrokloriddal végezték.² Az anhidro-aldóz oximokból generált nitril-oxidok C-C kettős és hármas kötésekkel végzett reakciójában a megfelelő C-glikozil-izoxazolin és -izoxazol származékokat állítottuk elő, amelyek a *Candida albicans* potenciális antiadhéziós szerelei lehetnek, valamint glikogén-foszforiláz és galektin gátló hatásuk is lehet.

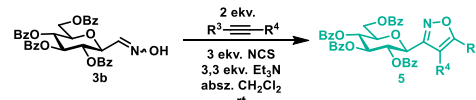
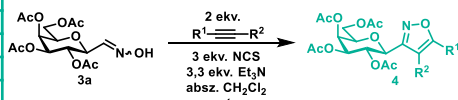
Eredmények

A kiindulási anhidro-aldóz oximok szintézise

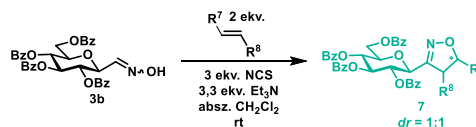
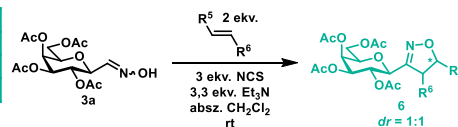


Anhidro-aldóz oximok és különböző dipolarofilek cikloaddíciós reakcióinak vizsgálata

Ssz.	R ¹	R ²	Hozam 4 (%)
1.	Ph	H	68
2.	4-etinil-Ph	H	41
3.	2-Py	H	63
4.	CH ₂ OH	H	47
5.	CH ₂ OAc	H	46
6.		H	Komplex reakcióelegy
7.	COOEt	COOEt	44



Ssz.	R ⁵	R ⁶	Hozam 6 (%)
1.	Ph	H	83
2.	2-Naft	H	71
3.	OAc	H	53

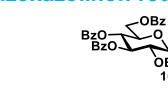
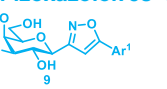
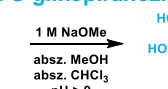
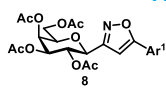


Ssz.	R ³	R ⁴	Hozam 5 (%)
1.	Ph	H	57
2.	4-etinil-Ph	H	24
3.	2-Py	H	39
4.	CH ₂ OH	H	67
5.	CH ₂ OAc	H	47
6.		H	8
7.	COOEt	COOEt	52

Ssz.	R ⁷	R ⁸	Hozam 7 (%)
1.	Ph	H	77
2.	2-Naft	H	93
3.	OAc	H	59

A C-glikopiranozil-izoxazolok és -izoxazolinok védőcsoport eltávolítása

Ssz.	Ar ¹	Hozam 9 (%)
1.	Ph	49
2.	2-Py	63



Ssz.	R ⁹	Hozam 11 (%)
1.	Ph	80
2.	2-Py	67
3.	CH ₂ OH	99

Ssz.	Ar ²	Hozam 13 (%)
1.	Ph	76
2.	2-Naft	64

Ssz.	Ar ³	Hozam 15 (%)
1.	Ph	80
2.	2-Naft	67

Összefoglalás

A C-glikozil-izoxazolin és -izoxazol származékokat közepes és jó hozammal állítottuk elő az anhidro-aldóz oximokból *in situ* generált nitril-oxidok C-C kettős és hármas kötésekkel végzett 1,3-dipoláris cikloaddíciójával. Az így nyert C-glikozil-izoxazolinok és -izoxazolok védőcsoportjait Zemplén-féle módszerrel távolítottuk el. Az előállított vegyületek potenciális biológiai hatásának vizsgálata folyamatban van. A galaktózsármazékok a *Candida albicans* antiadhéziós szerelei és galektin inhibitorok, míg a glükózsármazékok a glikogén-foszforiláz enzim hatékony inhibitorai lehetnek.

Irodalomjegyzék

- Varki, A. *Glycobiol.* 1993, 3, 97-130.
- Tóth, M.; Somsák, L. *Carbohydr. Res.* 2003, 388, 1319-1325.

Köszönetnyilvánítás

A kutatás a Nemzeti Kutatási, Fejlesztési és Innovációs Hivatal PD 142641 számú pályázat támogatásával, és a COST CA18132 számú pályázat támogatásával készült.