

Applications of biaryl cyclization in the synthesis of cyclic enkephalin analogs with a highly restricted flexibility

Autorzy

Maria Różanowska
Gabriela Szczupaj
Michał Nowakowski
Priyadharshni Rajagopal
Piotr F. J. Lipiński
Joanna Matalińska
Aleksandra Misicka
Marek Lisowski
Łukasz Jaremko
Mariusz Jaremko

Rok wydania

2024

Czasopismo

Amino Acids

Numer woluminu

56

Strony

18/1-18/17

DOI

10.1007/s00726-023-03371-5

Kolekcja

Naukowa

Język

Angielski

Streszczenie

A series of 10 cyclic, biaryl analogs of enkephalin, with Tyr or Phe residues at positions 1 and 4, were synthesized according to the Miyaura borylation and Suzuki coupling methodology. Biaryl bridges formed by side chains of the two aromatic amino acid residues are of the *meta-meta*, *meta-para*, *para-meta*, and *para-para* configuration. Conformational properties of the peptides were studied by CD and NMR. CD studies allowed only to compare conformations of individual peptides while NMR investigations followed by XPLOR calculations provided detailed information on their conformation. Reliability of the XPLOR calculations was confirmed by quantum chemical ones performed for one of the analogs. No intramolecular hydrogen bonds were found in all the peptides. They are folded and adopt the type IV β -turn conformation. Due to a large steric strain, the aromatic carbon atoms forming the biaryl bond are distinctly pyramidalized. Seven of the peptides were tested in vitro for their affinity for the μ -opioid receptor.

Słowa kluczowe

Cyclization, Biaryl bridges in peptides, Suzuki-Miyaura reaction, NMR, CD, Molecular docking

Licencja otwartego dostępu

CC-BY

Licencja na prawach której można swobodnie kopiować, rozprowadzać, zmieniać i remiksować objęty prawem autorskim utwór (Utwór-przedmiot prawa autorskiego) pod warunkiem podania imienia i nazwiska autora utworu pierwotnego oraz źródła pochodzenia utworu.

Pełny tekst licencji:

<https://creativecommons.org/licenses/by/3.0/pl/legalcode>

Typ publikacji

Artykuł

Adres publiczny

<http://dx.doi.org/10.1007/s00726-023-03371-5>

Strona internetowa wydawcy

<http://link.springer.com>

Plik został wygenerowany dnia 2026-10-07 05:53:21

Adres w repozytorium <https://old.chem.uni.wroc.pl/pl/repozytorium/r3Un9Rm>.