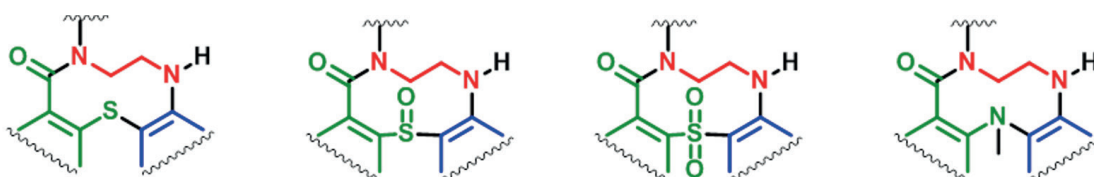


НОВЫЕ ПРИВИЛЕГИРОВАННЫЕ СКАФФОЛДЫ ДЛЯ ДИЗАЙНА ЛЕКАРСТВ: ИЗУЧЕНИЕ СИНТЕТИЧЕСКИХ И БИОЛОГИЧЕСКИХ МЕТОДОВ

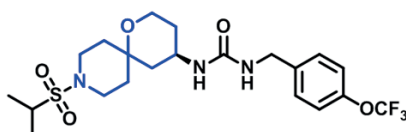
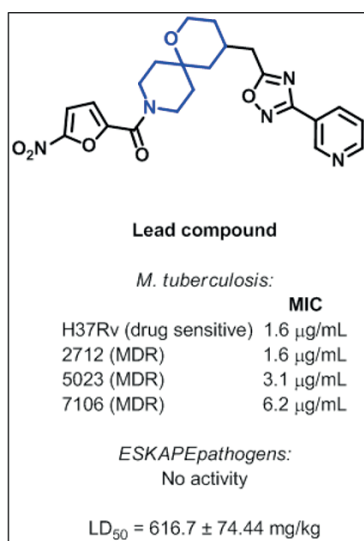
Красавин М.Ю.

Санкт-Петербургский государственный университет, Санкт-Петербург
m.krasavin@hotmail.com

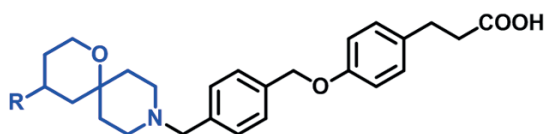
Циклические скаффолды среднего размера (9-14-членные) сложны для синтеза через традиционные подходы, основанные на циклизации ациклических прекурсоров. При этом такие циклы представляют собой крайне привлекательную платформу для дизайна лекарств, поскольку они обладают оптимальным балансом между конформационной жесткостью и подвижностью. Это делает более эффективным поиск лигандов для трехмерных белковых молекул без серьезных потерь для важных физико-химических свойств, определяющих абсорбционные свойства таких соединений. В докладе будут представлены последние результаты в области синтеза таких среднеразмерных циклических структур.



Спироциклы также представляют привилегированную платформу для дизайна лекарств, но по другой причине. Если биологически активное вещество является спироциклическим, т.е. обладает ярко-выраженной «трехмерностью», то наблюдаемая биологическая активность имеет большие шансы быть свободной от нецелевых, т.е. побочных эффектов. Трехмерные структуры более комплементарны ко своим биомишеням. Будут представлены подходы, используемые для синтеза и позиционирования спироциклических соединений в поле биомишеней и различных видов фенотипической биоактивности.



Orally bioavailable inhibitor
of soluble epoxide hydrolase (sEH):
IC₅₀ = 5 nM



Agonist for free fatty acid receptor 1
(FFA1/GPR40) to treat type II diabetes