

ПОИСК БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ ВЕЩЕСТВ В РЯДУ ПРОИЗВОДНЫХ ГАММА-АМИНОМАСЛЯНОЙ, ГЛУТАМИНОВОЙ КИСЛОТ И АЛЬФА-ПИРРОЛИДОНА

Остроглядов Е.В., Васильева О.С., Берестовицкая В.М.

Федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение
высшего профессионального образования
«Российский государственный педагогический университет им. А.И. Герцена»

Санкт-Петербург, Российская Федерация

Одной из главных стратегий при поиске новых биологически активных субстанций является модификация структуры известных лекарственных препаратов или природных соединений. В этом отношении большой интерес представляют структурные аналоги нормальных метаболитов мозга животных и человека – γ -аминомасляной (ГАМК), глутаминовой (Глу) кислот и альфа-пирролидона. Так, благодаря реализации вышеуказанной стратегии в проблемной лаборатории нитросоединений РГПУ им. А.И. Герцена были впервые получены широко используемые в настоящее время в медицинской практике транквилизатор *фенибут* и антиишемическое средство с ноотропным действием карфедон (*фенотропил*).

Углублённое изучение фармакологической активности ряда солей β -фенил- γ -аминомасляной кислоты (пат. РФ № 2393855 от 29.12.2008) и композиций карфедона (Евразийский пат. № 002379 от 26.02.2001), созданных совместно с Волгоградским медицинским университетом, показало, что два их представителя – *цитракард* и *сукцикард* – обладают более широким спектром действия, чем *фенибут* и *фенотропил*.

В последние годы нами разработаны способы получения новых аналогов ГАМК, Глу и α -пирролидона: синтезированы модифицированные формы карфедона с различными карбо- и гетероароматическими заместителями, проявившими себя в качестве фармакофорных групп в составе ряда широко используемых в клинической практике лекарственных препаратов. Два представителя таких субстанций – *1-карбамоилметил-4-(4-метоксифенил)-2-пирролидон* и *фенилгидразид (4-фенил-2-пирролидон-1-ил)уксусной кислоты* – запатентованы нами как оригинальные соединения, обладающие антидепрессантным, анксиолитическим и ноотропным действием (пат. РФ № 2437659 от 12.11.2010; пат. РФ № 2440981 от 12.11.2010). Биоскрининг синтезированных арил(гетарил)производных Глу позволил выявить в их ряду ценное вещество – *гидрохлорид 3-фенилглутаминовой кислоты* – проявляющее свойства нейропротектора, анксиолитика и антидепрессанта (пат. РФ № 2429834 от 27.09.2011).

Разрабатываемые в лаборатории нашей научной школы методы получения малоизученных арил(гетарил)замещённых аналогов ГАМК, Глу и альфа-пирролидона, как правило, высокоэффективны, не многостадийны и просты в аппаратурном оформлении. Выявленные субстанции перспективны для создания новых лекарственных средств сердечно-сосудистого и психотропного действия; проводимые исследования результативны, исключительно важны для медицинской химии и вполне оправданы с точки зрения финансовых вложений в организацию производства новых средств медицинского назначения.