

## Биоорганическая химия и биотехнологии

### Пептидомиметики, их роль в фармакологии и в современной биомедицине

Бабушкина А.А.<sup>1</sup>, Видякина А.А.<sup>1</sup>, Соколова Э.В.<sup>2</sup>

<sup>1</sup> Кафедра органической химии

<sup>2</sup> Кафедра физической органической химии

Пептиды играют важную роль во многих физиологических процессах, например, контролируют иммунную систему человека, а также большинство жизненных функций организма, включая метаболизм, репродуктивные функции, дыхание и чувствительность к боли. Эффективность применения пептидов и разработанные удобные методы оптимизации структуры таковых позволяют рассматривать их в качестве потенциальных лекарственных средств [1]. Однако препараты, в основу которых входят пептиды, обладают рядом недостатков, среди которых принято выделять:

- Ограниченную стабильность относительно протеолиза;
- Низкую абсорбцию и транспортные возможности;
- Низкую селективность и нежелательные побочные эффекты.

Вследствие указанных ограничений были разработаны пептидомиметики – вещества небелковой природы, имеющие в составе такие же структурные фрагменты, как и исходный пептид (Рисунок 1). В отличие от пептидов пептидомиметики обладают большей метаболической стабильностью, хорошей биодоступностью и селективностью действия. Возможность регулирования свойств пептидомиметиков достигается с помощью функциональных модификаций структуры [2]. Возникшие еще в восьмидесятые годы, пептидомиметики до сих пор широко применяются в медицине и производстве лекарственных препаратов [3-5]. Большое распространение в клинической практике получили следующие пептидомиметики: индинавир, лифитеграст, симепревир и другие [2].

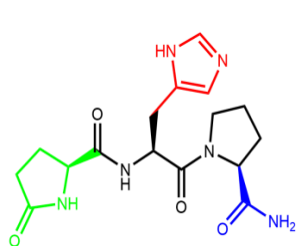


Рис. 1. Исходный пептид и пептидомиметик

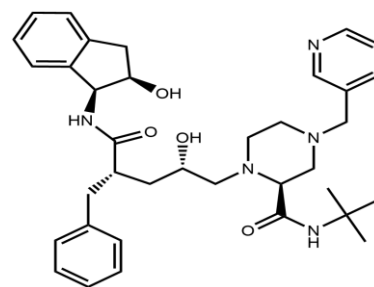
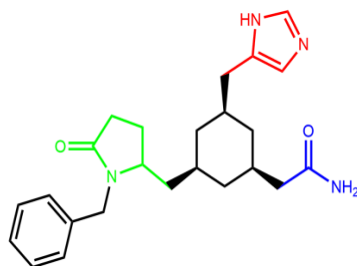


Рис. 2. Пептидомиметик Индавирин

В докладе рассматриваются пептидомиметики, их отличие от белковых пептидов, способы их классификации и дизайна, а также примеры применения данных соединений в области медицинской химии и фармакологии.

1. Qvit, N., et al. Drug Discovery Today, 22(2) (2017) 454; IF 7.321
2. Elena Lenci and Andrea Trabocchi, Chem. Soc. Rev., 49 (2020), 3262; IF 42.846
3. Mabonga, L., Kappo, A.P., Int J Pept Res Ther 26 (2020), 225; IF 1.500
4. Ravindranathan, P., et al. Nat. Commun 4(1) (2013), 1923; IF 12.121
5. Barlow N., et al. RSC Med. Chem., 11 (2020), 234; IF 2.394