**Разработка подходов к синтезу производных тиено[2,3-*d*]пиримидина – лигандов трансмембранного аллостерического сайта рецепторов гликопротеиновых гормонов**

***Диденко Е.А., Белышева М.Н.,* *Сорокоумов В.Н.***

*Студент, 1 курс магистратуры*

*Санкт-Петербургский государственный университет, Институт химии,*

*Санкт-Петербург, Российская Федерация*

*E-mail: didenkoegor58@mail.ru*

Гликопротеиновые гормоны играют важную роль в активации репродуктивной системы и в регуляции метаболических процессов. К таким гормонам, в частности, относятся фолликулостимулирующий гормон (ФСГ), тиреотропный гормон (ТТГ) и лютеинизирующий гормон (ЛГ). Рецепторы гликопротеиновых гормонов относятся к семейству рецепторов, связанных с G-белком. Гликопротеиновые гормоны, связываясь с большим внеклеточным доменом рецептора, вызывают в нем конформационные изменения, что приводит к активации внутриклеточных сигнальных путей. В свою очередь, некоторые низкомолекулярные вещества способны связываться с аллостерическим сайтом рецептора и тем самым оказывать активирующее или ингибирующее влияние.

Перспективными лигандами аллостерического сайта рецепторов гликопротеиновых гормонов являются соединения на основе тиено[2,3-*d*]пиримидина, в которых тиенопиримидиновый фрагмент отвечает за распознавание и связывание с аллостерическим сайтом рецептора, а заместитель в бензольном кольце определяет активность определенного гормона и характер влияния на рецептор [1].

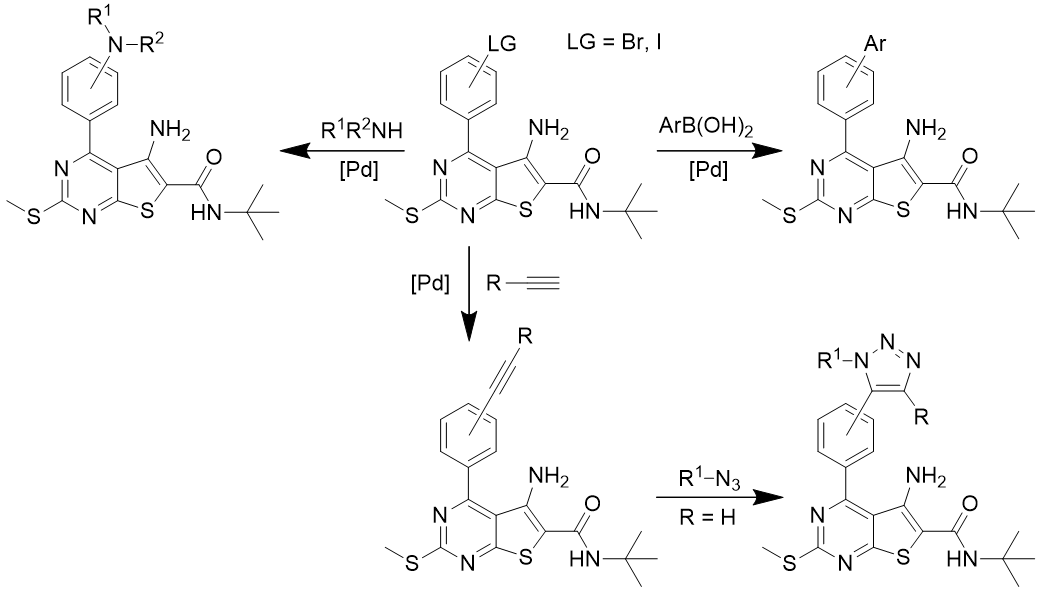


Схема 1. Пути модификации галогензамещенного тиенопиримидина

В докладе будет представлен синтез 4-бром- и 4-иодзамещенных тиенопиримидинов, а также будут рассмотрены пути их модификации с помощью реакций Pd‑катализируемого кросс-сочетания и представлены данные о биологической активности.

*Работа выполнена при финансовой поддержке РНФ (проект № 19-75-20122*).

**Литература**

1. Derkach K. V. et al. New Thieno-[2, 3-d] pyrimidine-based functional antagonist for the receptor of thyroid stimulating hormone // Doklady Biochemistry and Biophysics. – Pleiades Publishing. 2020. – Т. 491. – С. 77-80.