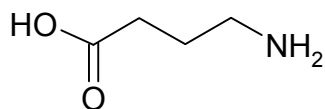
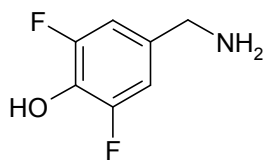


Задача 7. (автор Ткаченко С.Е.)

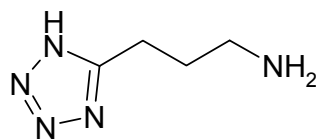


1. Гамма-аминомасляная кислота (ГАМК):

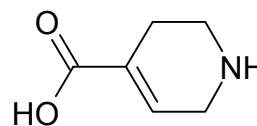
2. Биоизостерными по отношению к гамма-аминомасляной кислоте являются структуры А, С и F:



A



C

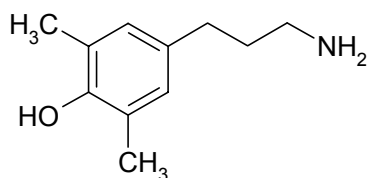


F

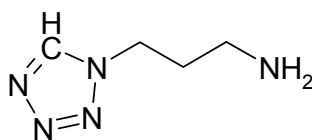
Структура А представляет собой биоизостерный аналог ГАМК, поскольку амино-группа и фенольный гидроксил находятся на расстоянии, подобном расстоянию между амино-группой и карбоксилем в ГАМК. Кроме того, 2,6-дифторфенол обладает свойствами сильной кислоты, подобной карбоновым кислотам.

Структура С - биоизостер ГАМК. Такой тетразол - довольно сильная кислота.

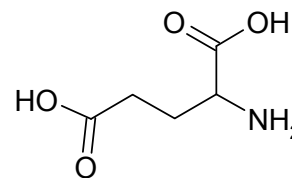
Структура F - изогувацин - биоизостер ГАМК. Является сильным агонистом ГАМК-рецепторов. Расстояние между функциональными группами и их кислотно-основные свойства в ГАМК и изогувацине практически одинаковые. Изогувацин представляет собой так называемый «конформационно закрепленный» аналог ГАМК.



B



D



E

3. Структура В - не биоизостер ГАМК. Различаются расстояния между функциональными группами. Кроме того, 2,6-диметилфенол значительно уступает по кислотности карбоновым кислотам.

Структура D - не биоизостер ГАМК. Такой тетразол совершенно лишен кислотных свойств.

Структура E - глутаминовая кислота - не биоизостер ГАМК. Очень сильно различаются основности амино-групп в этих аминокислотах. Более того, глутаминовая кислота играет в организме роль, противоположную ГАМК. ГАМК - основной эндогенный центральный тормозной медиатор. Глутаминовая кислота является возбуждающим нейромедиатором.

4. Атомы фтора обладают отрицательным индуктивным эффектом, а метильные группы положительным, следовательно в соединении **В** кислотность фенольной группы будет понижена

(более слабая кислота), по сравнению с фенолом, а в соединении **A** повышена (более сильная кислота).