



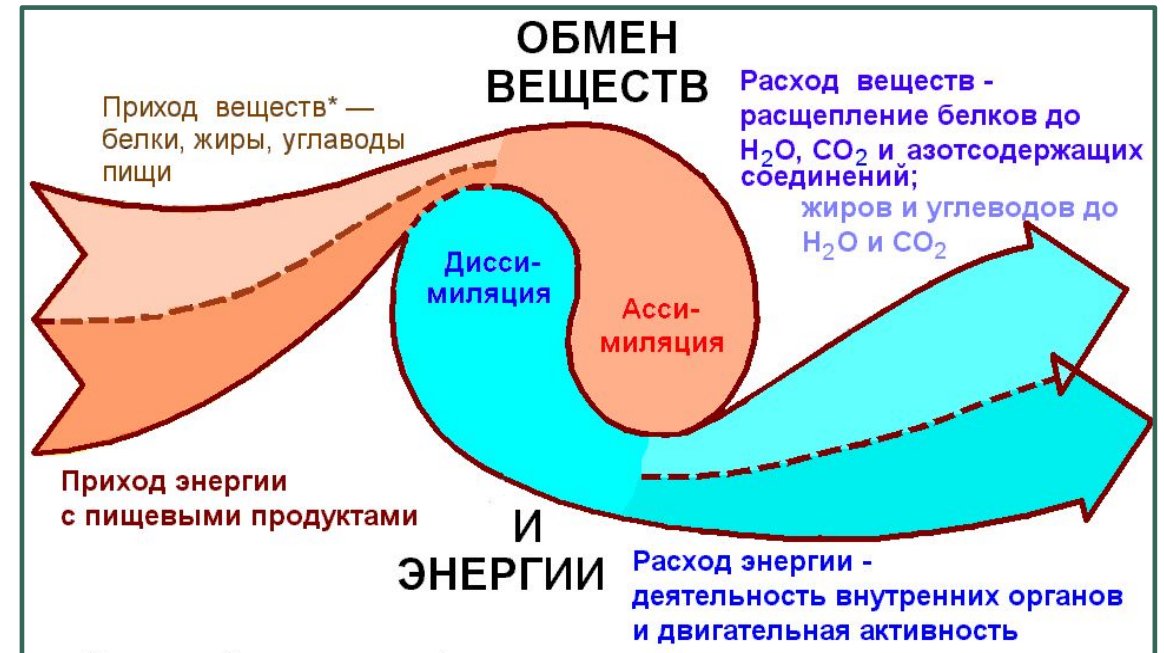
ИНГИБИТОРЫ ФЕРМЕНТОВ КАК ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА

«Вся тайна животной жизни, - писал Д. И. Менделеев, - заключается в непрерывных химических превращениях веществ, входящих в состав животных тканей».

Обмен веществ в организме можно определить как совокупность всех химических превращений, которым подвергаются соединения, поступающие извне.

Виды химических реакций:

- межмолекулярный перенос функциональных групп;
- гидролитическое и негидролитическое расщепление химических связей
- внутримолекулярная перестройка;
- новообразование химических связей;
- окислительно - восстановительные реакции.



Ферменты — обычно достаточно сложные молекулы белка, рибозимы или их комплексы, ускоряющие химические реакции в живых системах.



Модель фермента
нуклеозидфосфорилазы

Механизм действия ферментов:

Ускорение реакции происходит за счет снижения энергии активации — того энергетического барьера, который отделяет одно состояние системы (исходное химическое соединение) от другого (продукт реакции).

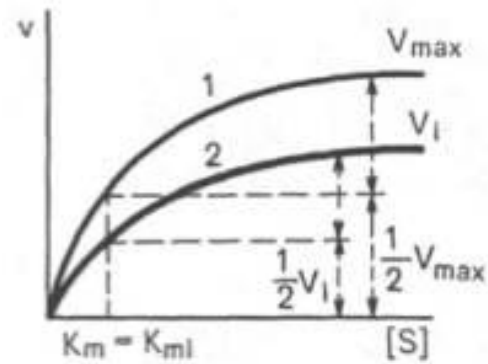
Методы их регуляции ферментов

Активирование

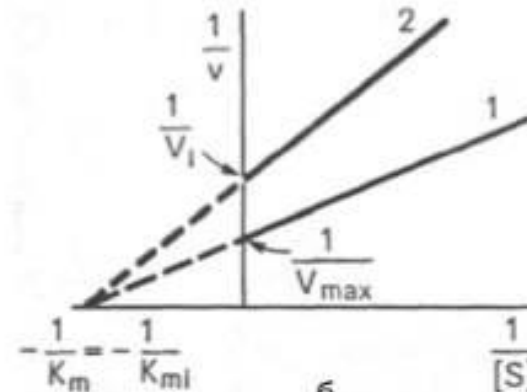
повышение скорости ферментативных реакций

Ингибирование

уменьшение активности ферментов и замедление химических реакции.



а



б

Активаторы – вещества, которые повышают скорость ферментативных реакций, увеличивая активность ферментов. Они бывают органической и неорганической природы.

К активаторам органической природы относятся:

- желчные кислоты (активируют поджелудочную липазу);
- энтерокиназа (активирует трипсиноген);
- витамин С (повышает скорость оксидоредуктаз).

К активаторам неорганической природы относятся:

- HCL (активирует пепсиноген);
- ионы металлов активируют очень многие реакции.

ИНГИБИТОРЫ – ВЕЩЕСТВА, КОТОРЫЕ УМЕНЬШАЮТ АКТИВНОСТЬ ФЕРМЕНТОВ И ЗАМЕДЛЯЮТ ХИМИЧЕСКИЕ РЕАКЦИИ.

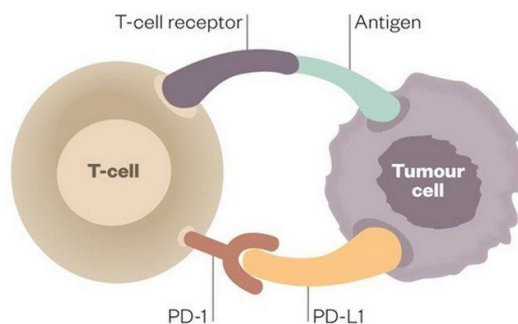
✓ Обратимое ингибирование;

Такой ингибитор легко удаляется и активность фермента восстанавливается.

✓ Необратимое ингибирование.

Ингибитор с молекулой фермента связывается прочными ковалентными связями, вследствие этого происходит необратимое ингибирование фермента.

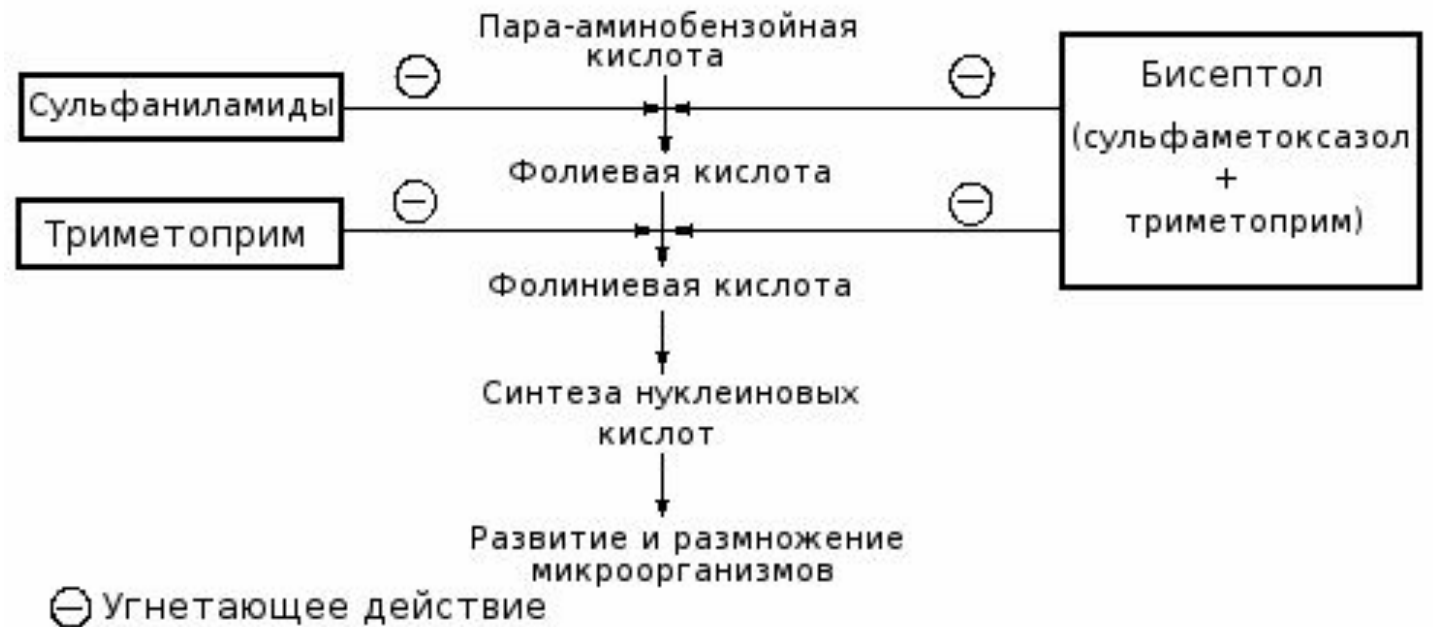
Ингибиторы PD-1



Сульфаниламиды как лечение методом конкурентного обратимого ингибирования

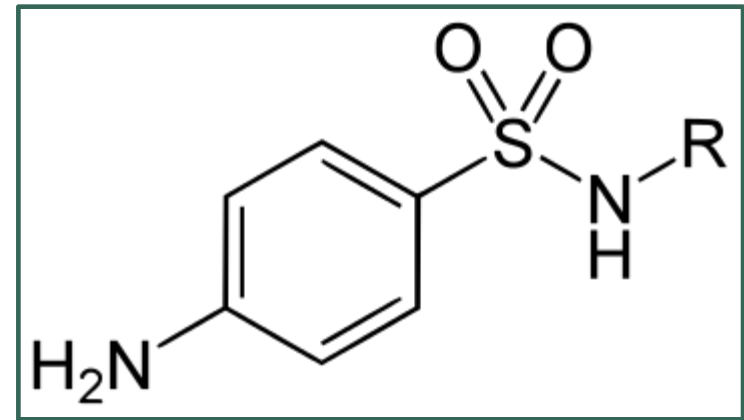
Механизм действия:

они являются структурными аналогами парааминобензойной кислоты, из которой микроорганизмы синтезируют необходимый им для размножения витамин В₉ (фолиевую кислоту), как следствие **невозможность их размножения, угнетение культуры микроорганизмов.**



Возможные осложнения:

- ✓ аллергические реакции,
- ✓ поражения паренхиматозных органов (почек, печени),
- ✓ нервной системы, крови и кроветворных органов.
- ✓ кристаллурия (кристаллизация сульфаниламидов и их ацетилированных метаболитов в почках, мочеточниках, мочевом пузыре)

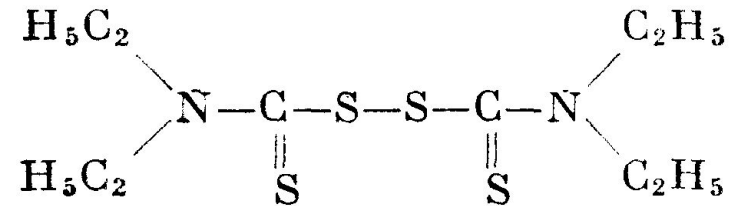


сульфаниламид

Неконкурентные обратимым ингибиторы

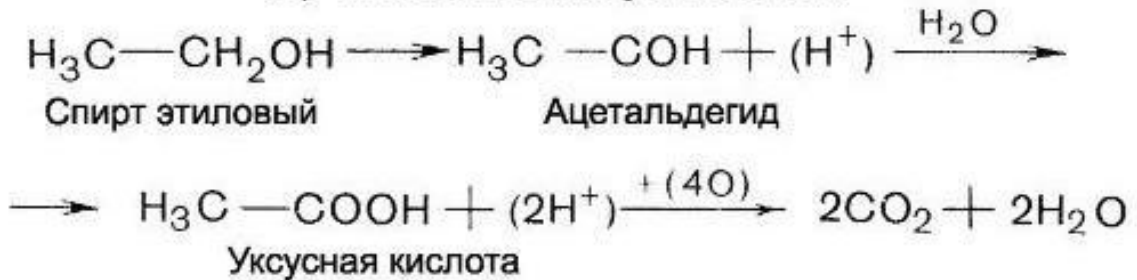
Не имеют структурного сходства к субстрату и присоединяются не к активному центру, а к другим участкам, в том числе и к аллостерическому центру.
Ингибирование происходит вследствие разрушения или необратимой химической модификации функциональных групп ферментов

Тетурам является ингибитором ацетальдегидрогеназы

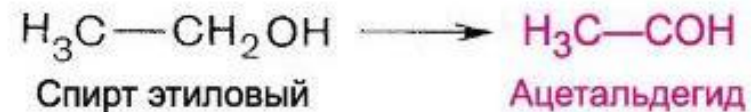


Механизм действия тетурама:

а) В обычных условиях



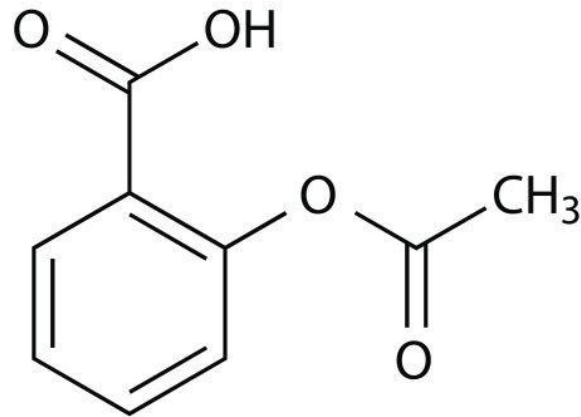
б) На фоне действия тетурама



Это приводит к условно-рефлекторному отвращению к вкусу и запаху спиртных напитков.

Необратимые ингибиторы

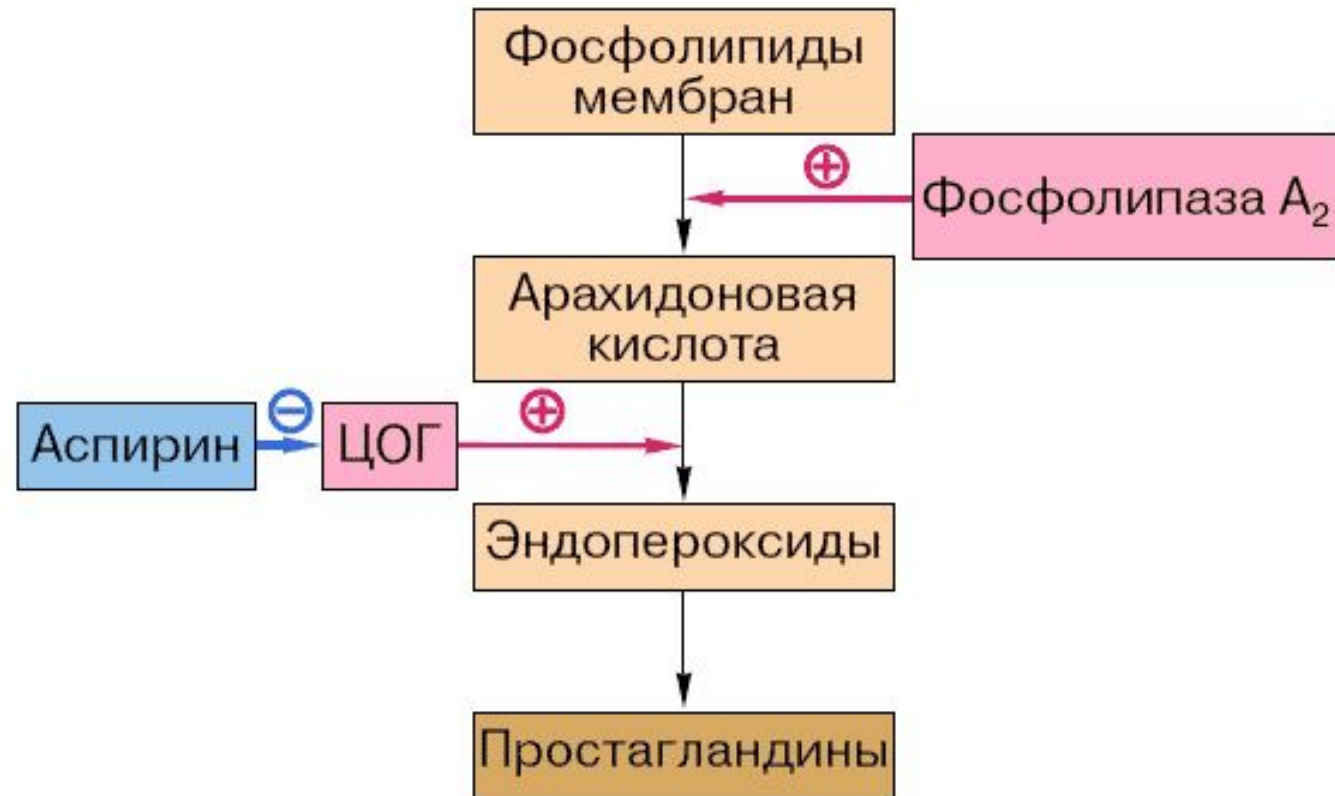
характеризуются тем, что ингибитор с молекулой фермента связывается прочными ковалентными связями, вследствие этого происходит необратимое ингибирование фермента.



аспирин



Механизм действия





СПАСИБО ЗА ВНИМАНИЕ!

