

# ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ

## *ЛЕКЦИЯ 5*

Основные понятия  
фармацевтической химии.

Фармакокинетика.

Фармакодинамика.

Молекулярные мишени.

**Фармакокинетика** (от др.-греч. *φάρμακον* — лекарство и *κίνησις* — движение) — раздел фармакологии, изучающий кинетические закономерности химических и биологических процессов, происходящих с лекарственным средством в организме.

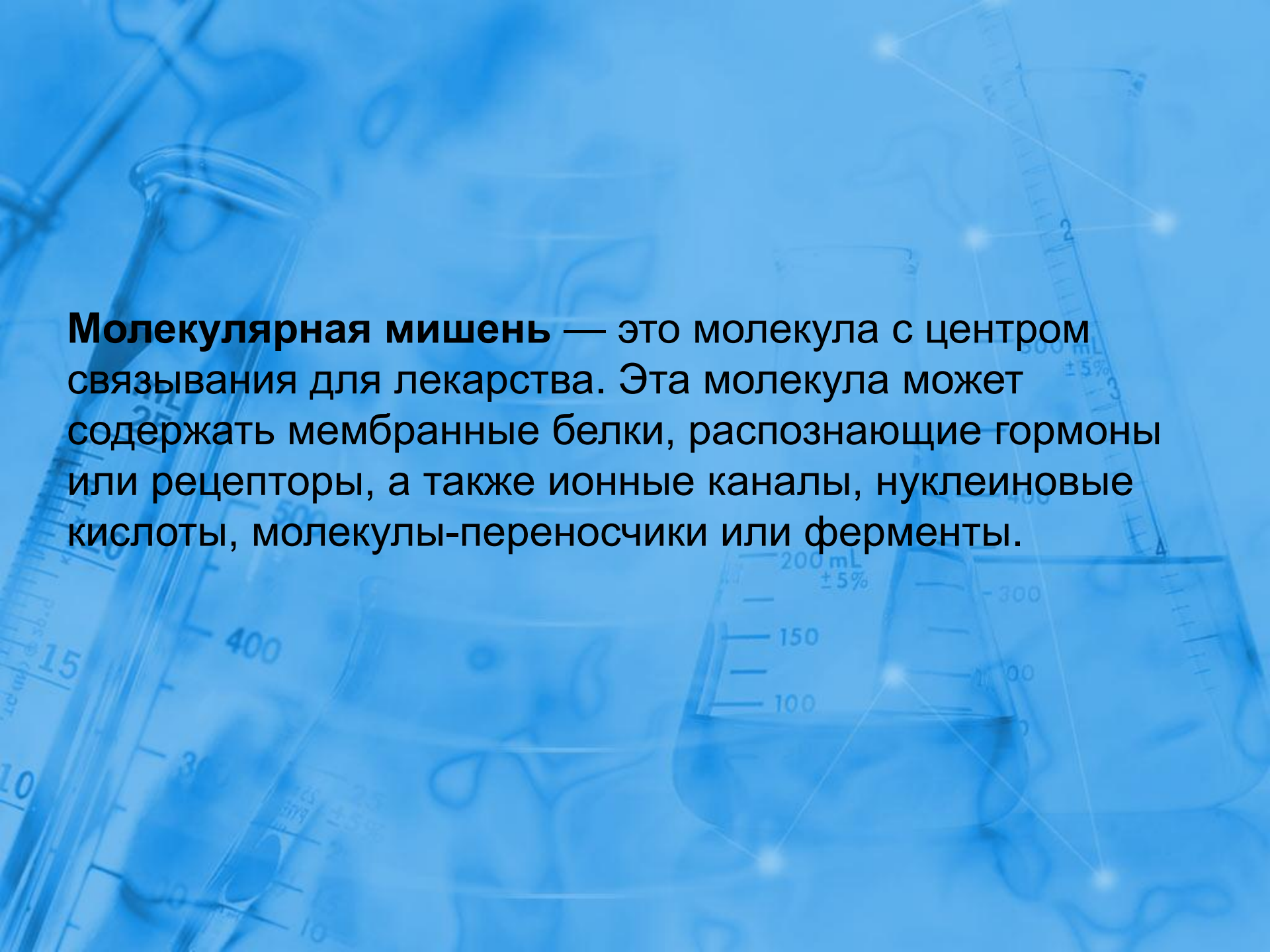
Иначе говоря, фармакокинетика — это судьба отдельно взятой молекулы лекарственного вещества (биохимическая трансформация молекул лекарства в организме).

Основные фармакокинетические процессы: всасывание, экскреция (выведение), распределение и метаболизм.

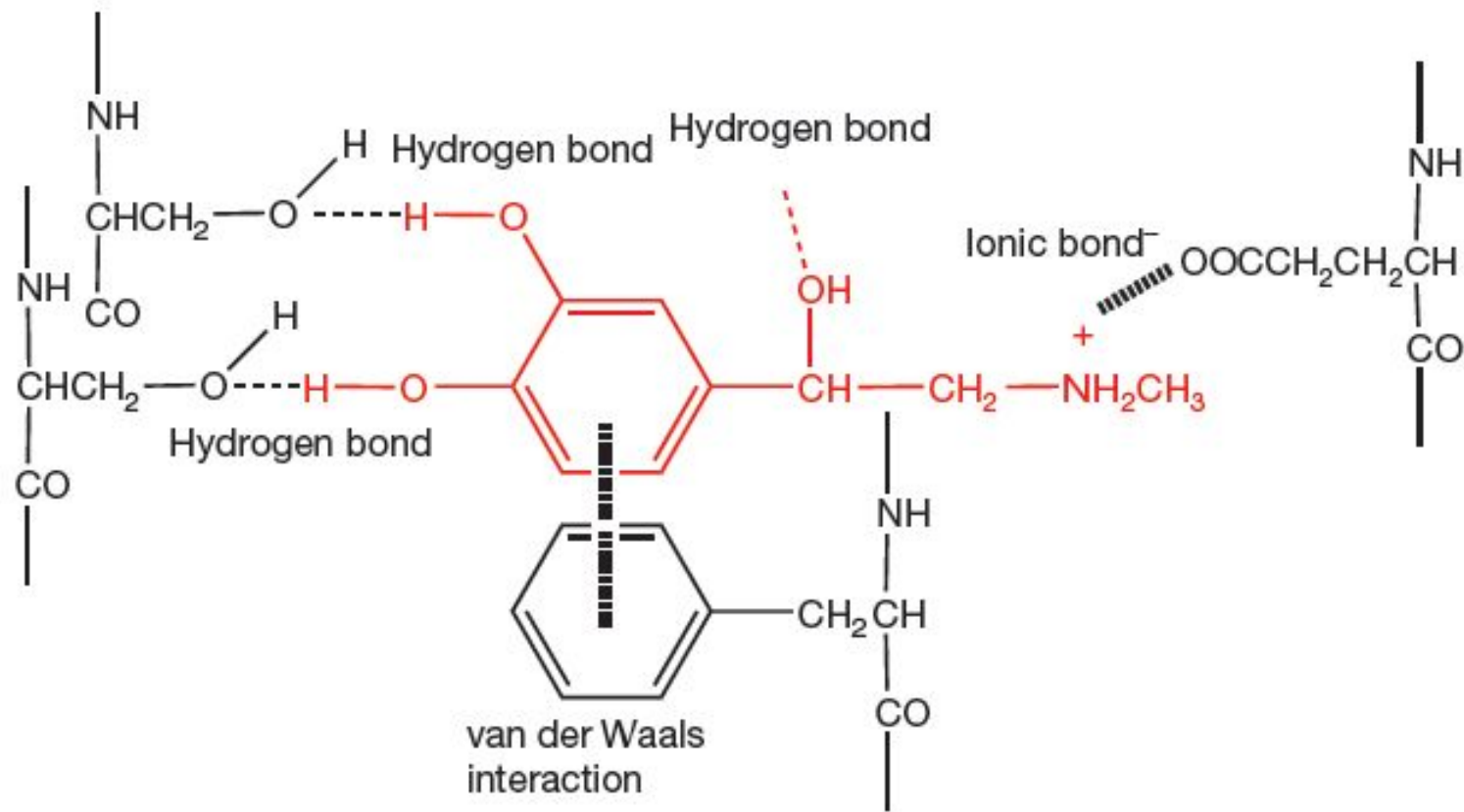
**Фармакодинамика** — раздел фармакологии, изучающий локализацию, механизм действия и фармакологические эффекты лекарственных средств, силу и длительность их действия. Фармакодинамика — это судьба организма после действия этого лекарственного вещества (механизм действия и эффекты)

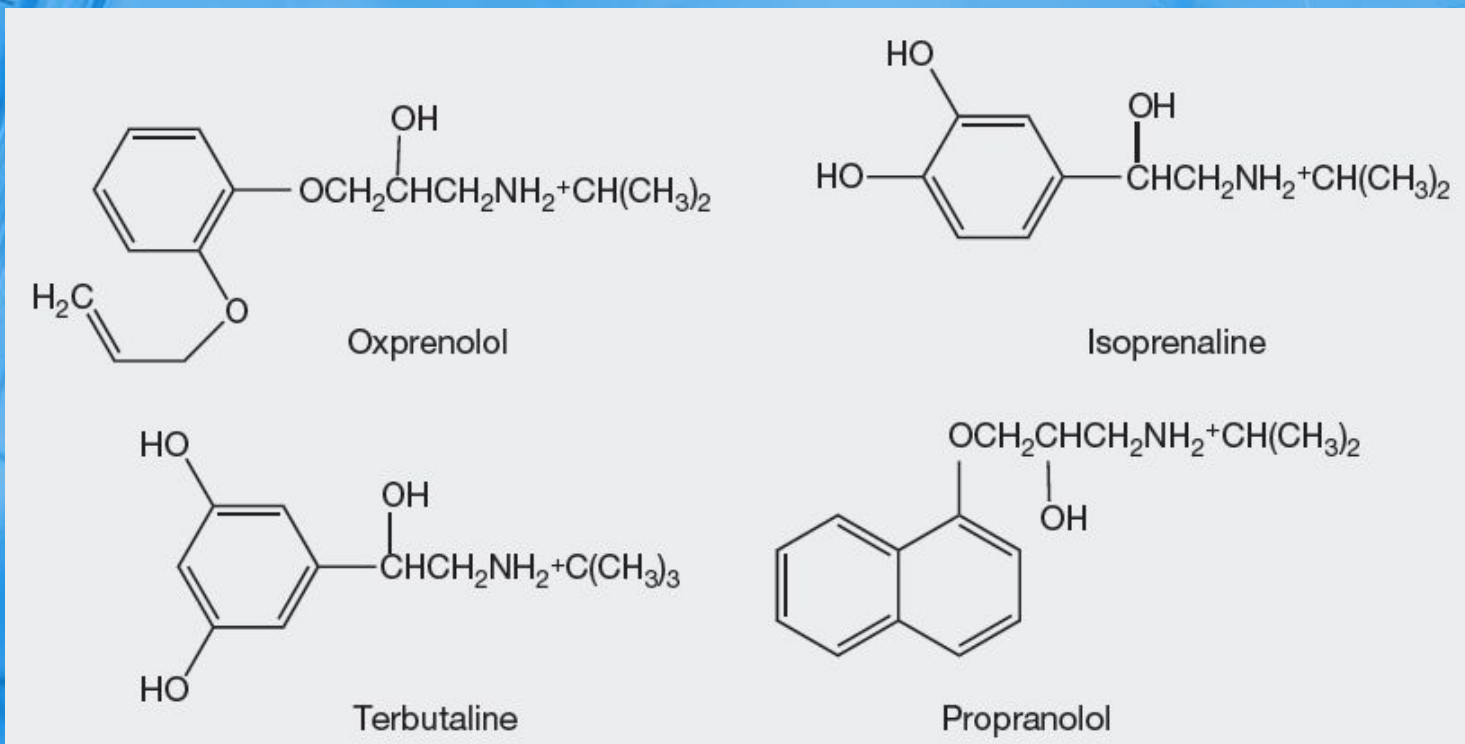
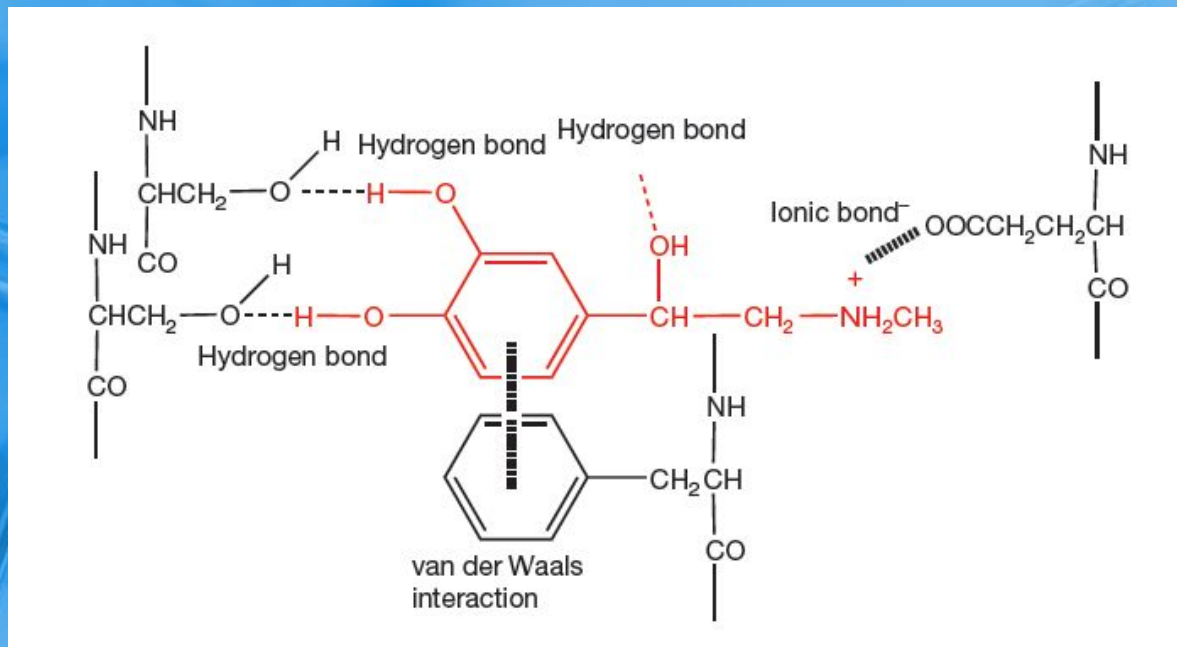
Отмечают 5 главных эффектов, оказываемых лекарственными средствами:

- подавляющее,
- стимулирующее,
- разрушающее клетки (цитотоксическое),
- раздражающее,
- замещающее недостающие вещества.

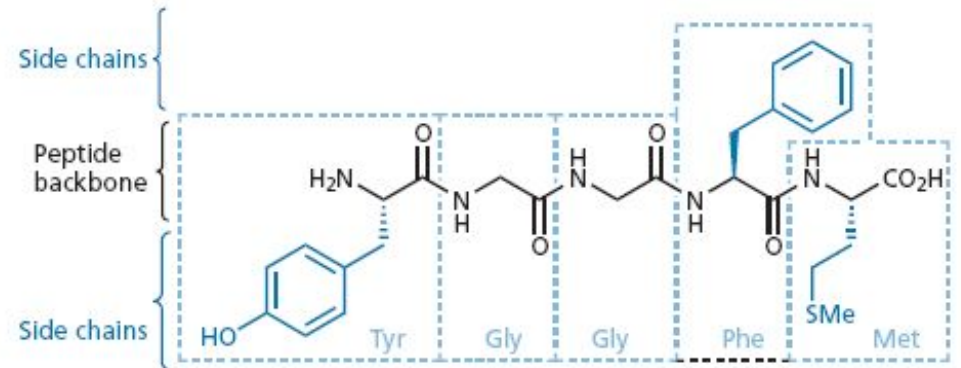
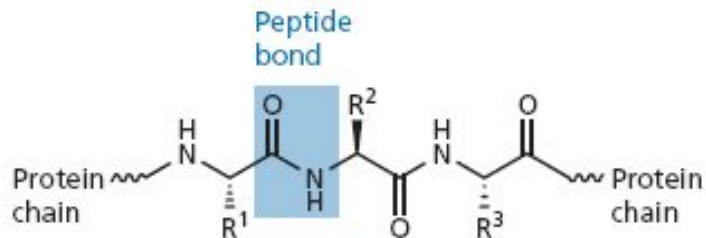


**Молекулярная мишень** — это молекула с центром связывания для лекарства. Эта молекула может содержать мембранные белки, распознающие гормоны или рецепторы, а также ионные каналы, нуклеиновые кислоты, молекулы-переносчики или ферменты.





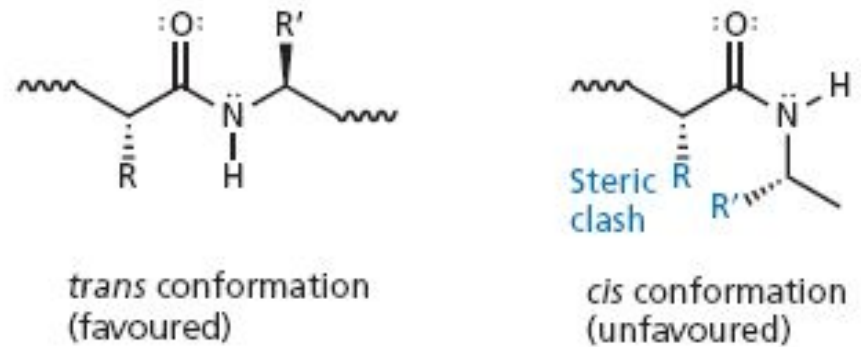
# БЕЛКИ. ПЕРВИЧНАЯ СТРУКТУРА



H-Tyr-Gly-Gly-Phe-Met-OH or YGGFM.



**FIGURE 2.3** The planar peptide bond (bond rotation allowed for coloured bonds only).

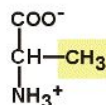


**FIGURE 2.4** *Trans* and *cis* conformations of the peptide bond.

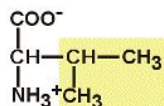
## Неполярные

### Алифатические

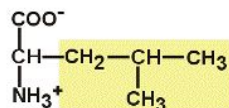
Аланин  
Ала, А



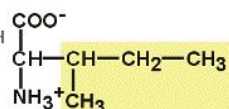
Валин  
Вал, V



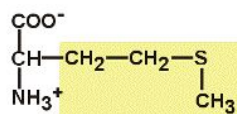
Лейцин  
Лей, L



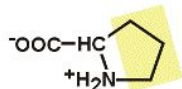
Изолейцин  
Иле, J



Метионин  
Мет, M



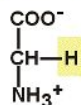
Пролин  
Про, P



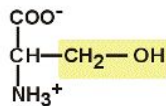
## Полярные

### Незаряженные

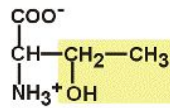
Глицин  
Гли, G



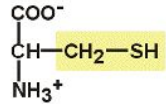
Серин  
Сер, S



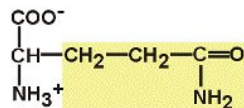
Треонин  
Тре, T



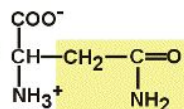
Цистеин  
Цис, C



Глутамин  
Глн, Q

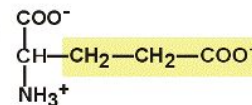


Аспарагин  
Асн, N

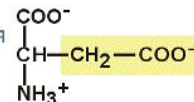


### Отрицательно заряженные

Глутаминовая  
кислота  
Глу, E

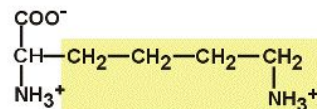


Аспарагиновая  
кислота  
Асп, D

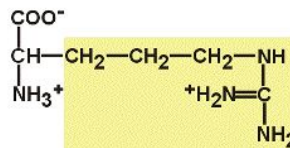


### Положительно заряженные

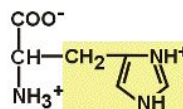
Лизин  
Лиз, K



Аргинин  
Арг, R

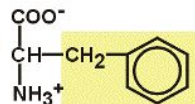


Гистидин  
Гис, H

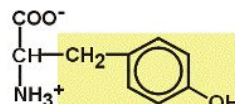


### Ароматические

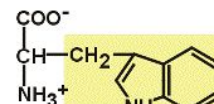
Фенилаланин  
Фен, F



Тирозин  
Тир, Y



Триптофан  
Три, W

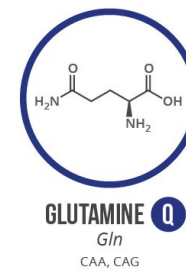
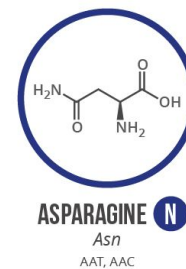
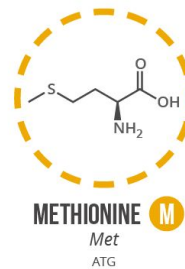
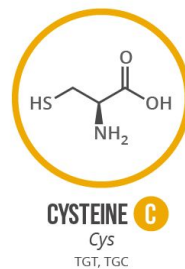
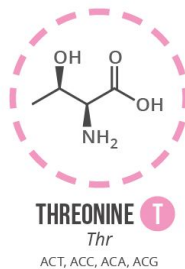
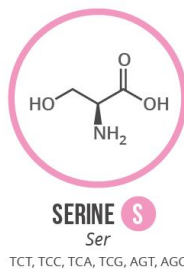
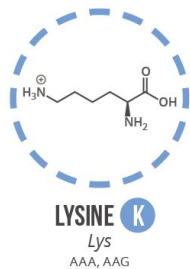
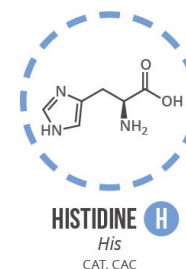
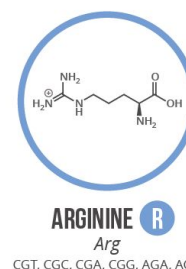
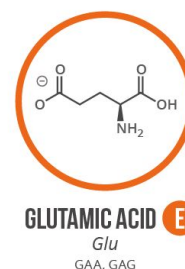
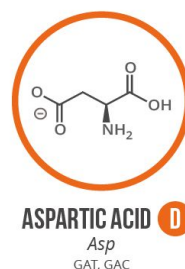
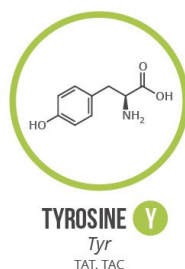
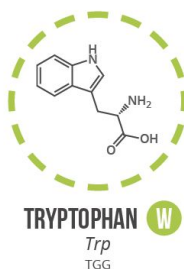
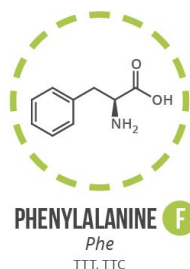
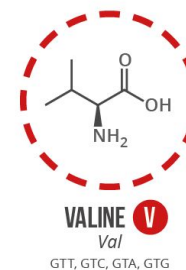
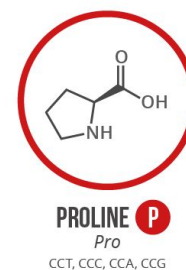
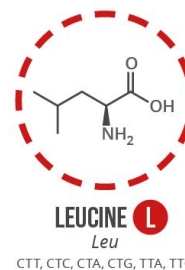
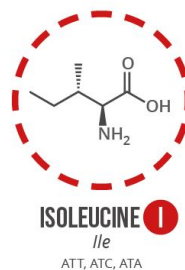
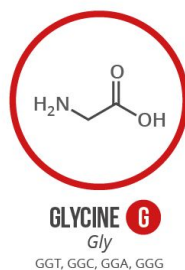
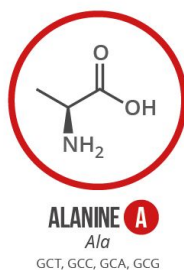
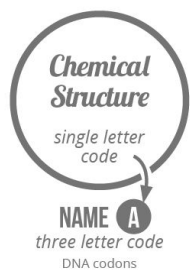




# A GUIDE TO THE TWENTY COMMON AMINO ACIDS

AMINO ACIDS ARE THE BUILDING BLOCKS OF PROTEINS IN LIVING ORGANISMS. THERE ARE OVER 500 AMINO ACIDS FOUND IN NATURE - HOWEVER, THE HUMAN GENETIC CODE ONLY DIRECTLY ENCODES 20. 'ESSENTIAL' AMINO ACIDS MUST BE OBTAINED FROM THE DIET, WHILST NON-ESSENTIAL AMINO ACIDS CAN BE SYNTHESISED IN THE BODY.

**Chart Key:** ● ALIPHATIC ● AROMATIC ● ACIDIC ● BASIC ● HYDROXYLIC ● ● SULFUR-CONTAINING ● AMIDIC ○ NON-ESSENTIAL ○ ESSENTIAL

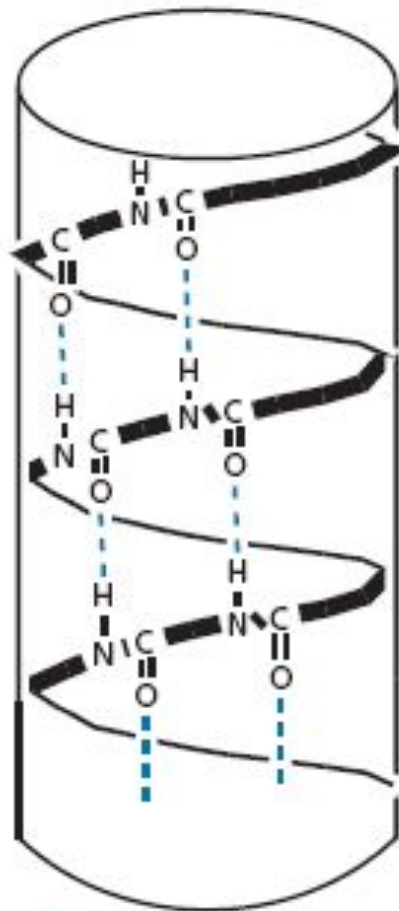


**Note:** This chart only shows those amino acids for which the human genetic code directly codes for. Selenocysteine is often referred to as the 21st amino acid, but is encoded in a special manner. In some cases, distinguishing between asparagine/aspartic acid and glutamine/glutamic acid is difficult. In these cases, the codes asx (B) and glx (Z) are respectively used.

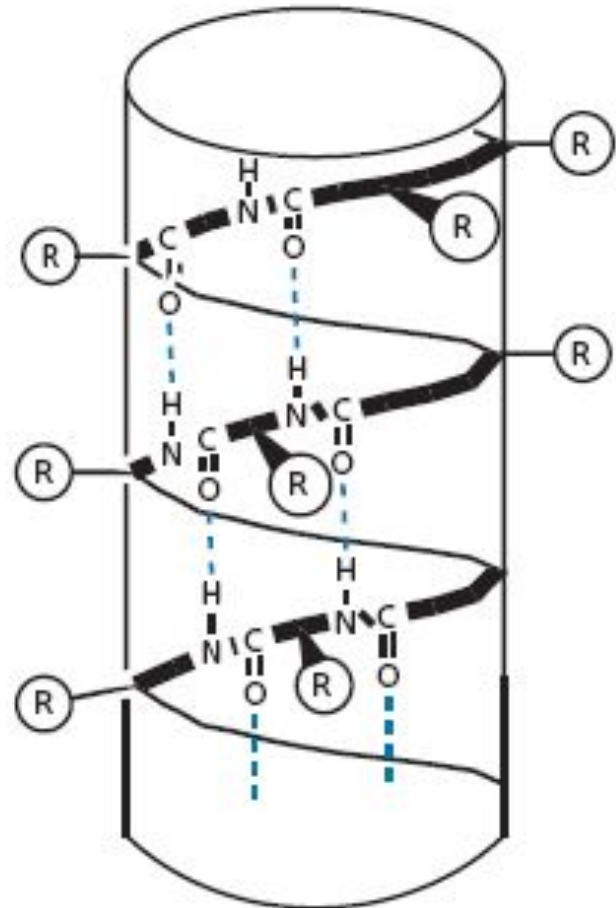
# БЕЛКИ. ВТОРИЧНАЯ СТРУКТУРА



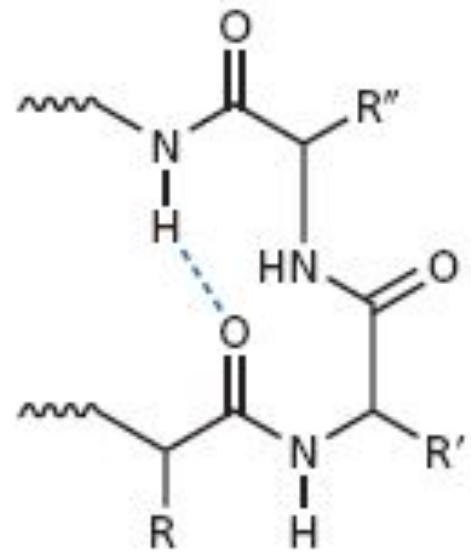
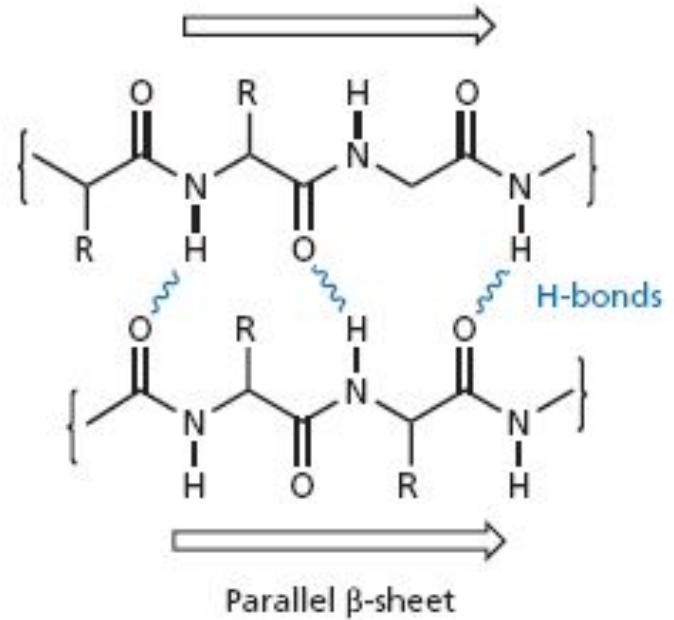
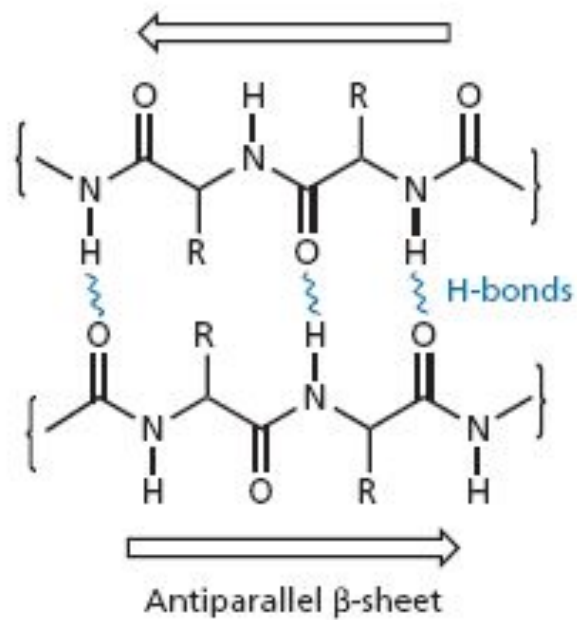
$\alpha$ -Helical backbone

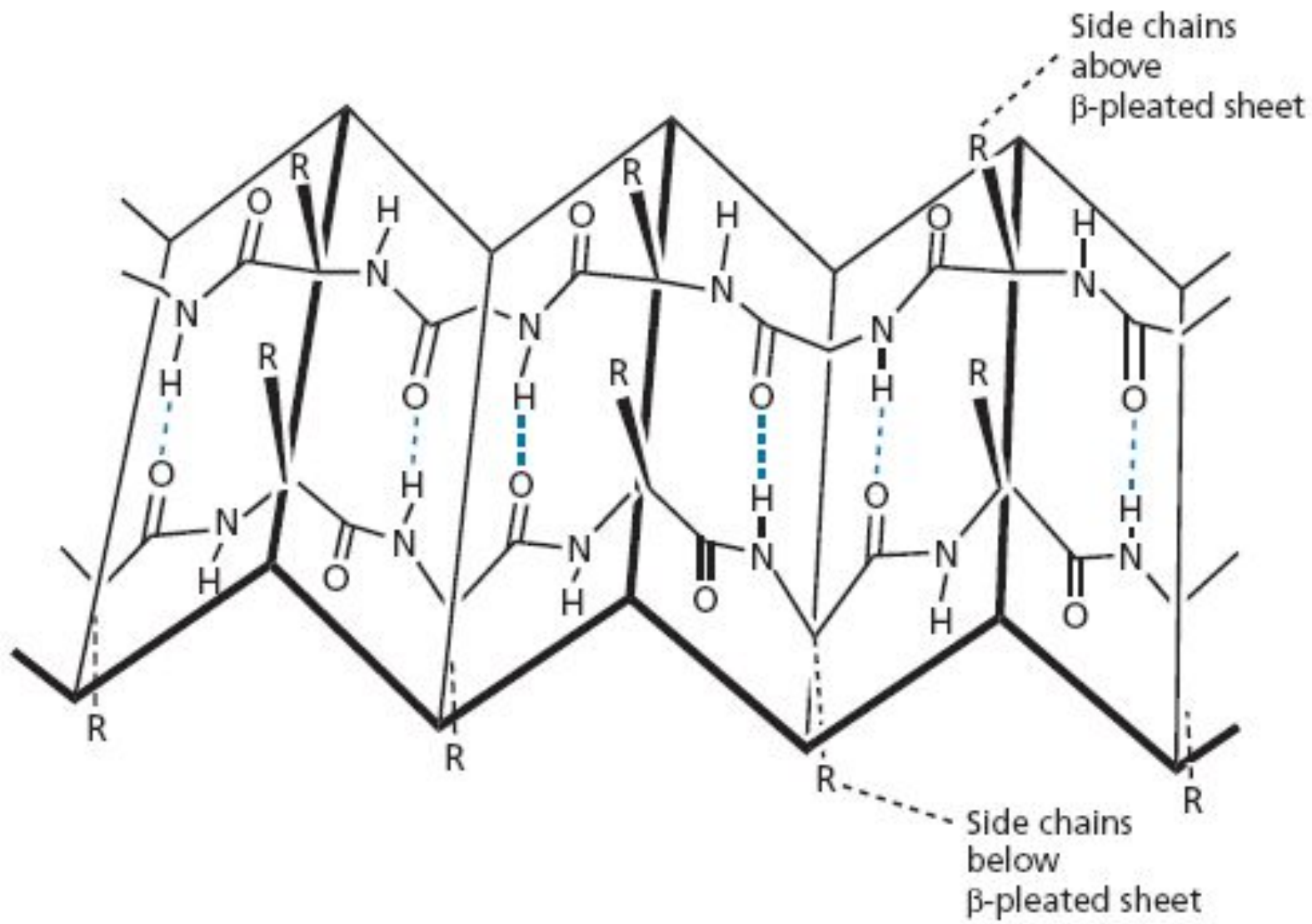


Hydrogen bonding  
between peptide bonds

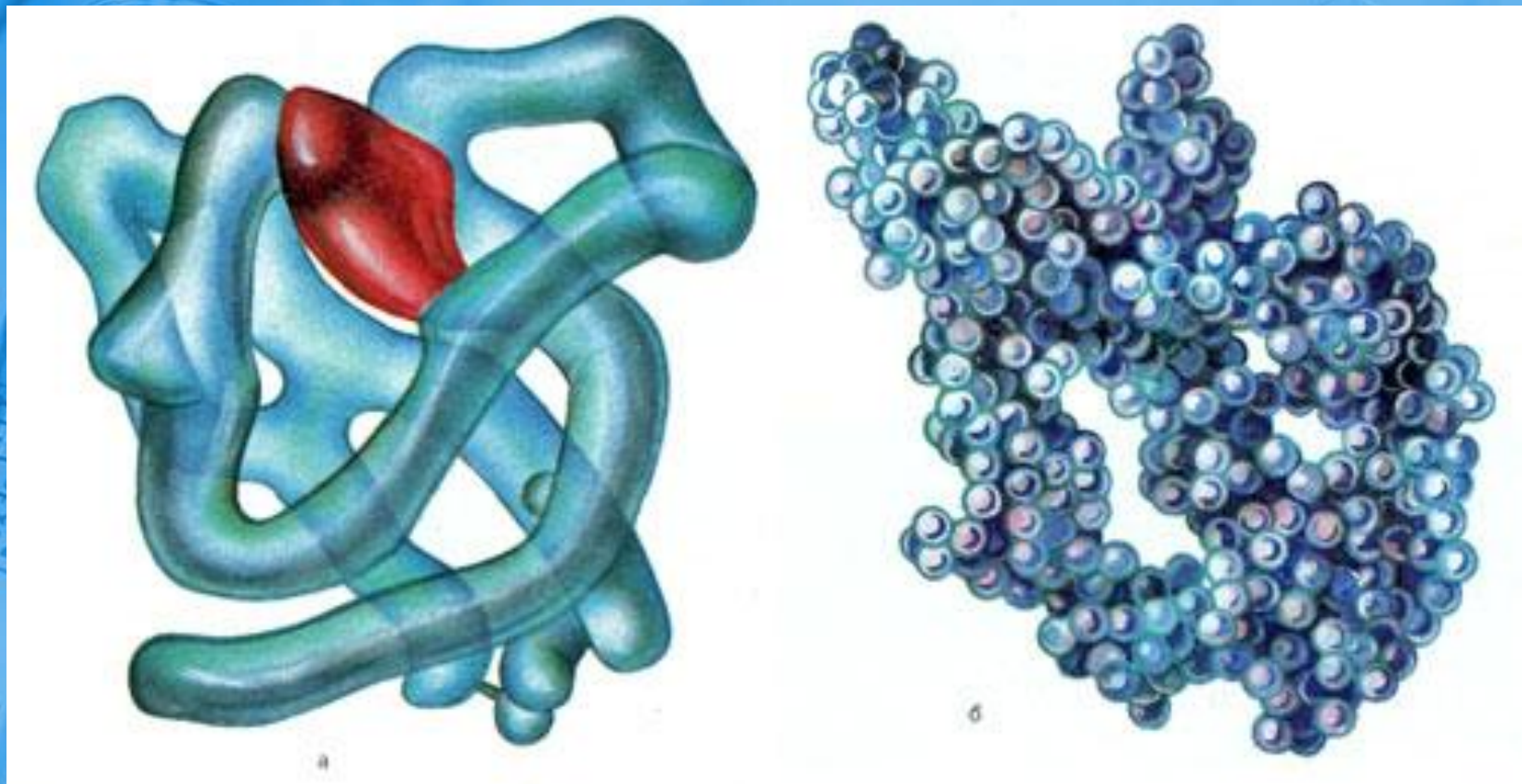


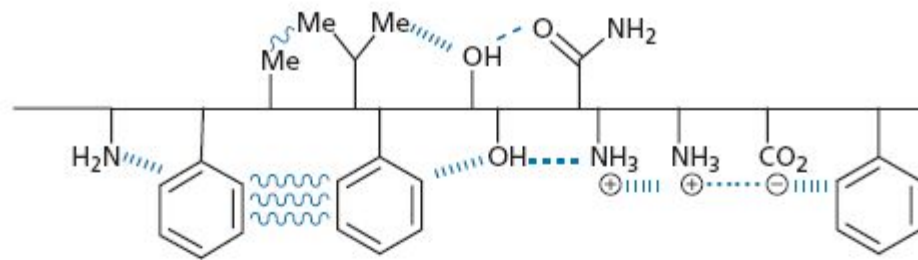
Position of side chains



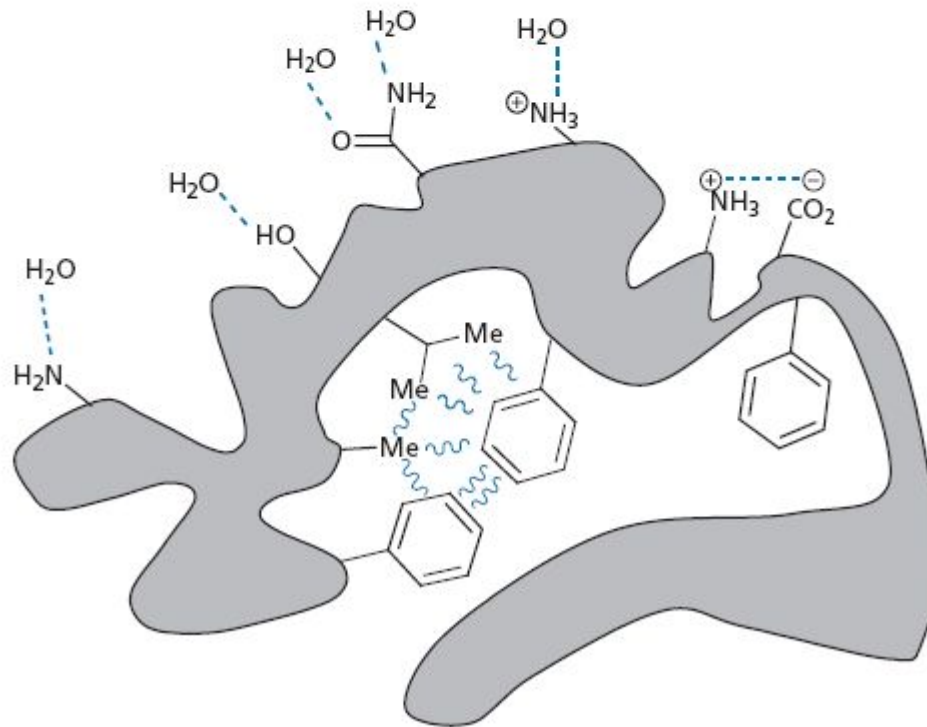


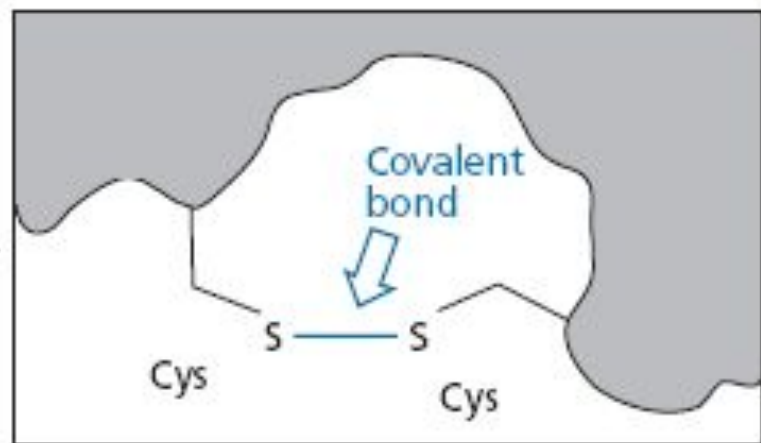
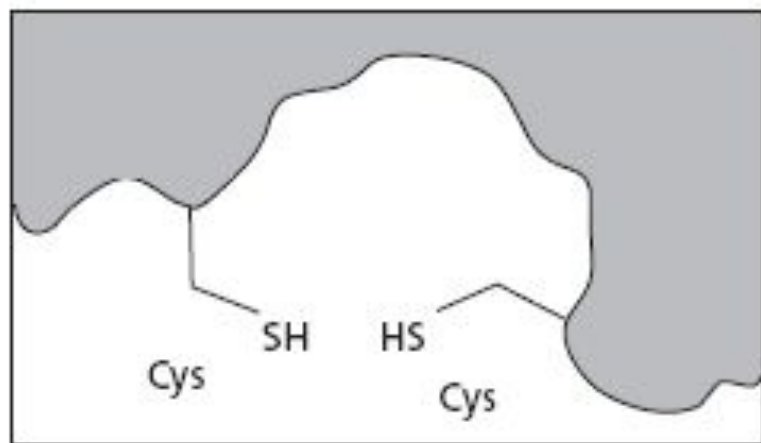
# БЕЛКИ. ТРЕТИЧНАЯ СТРУКТУРА

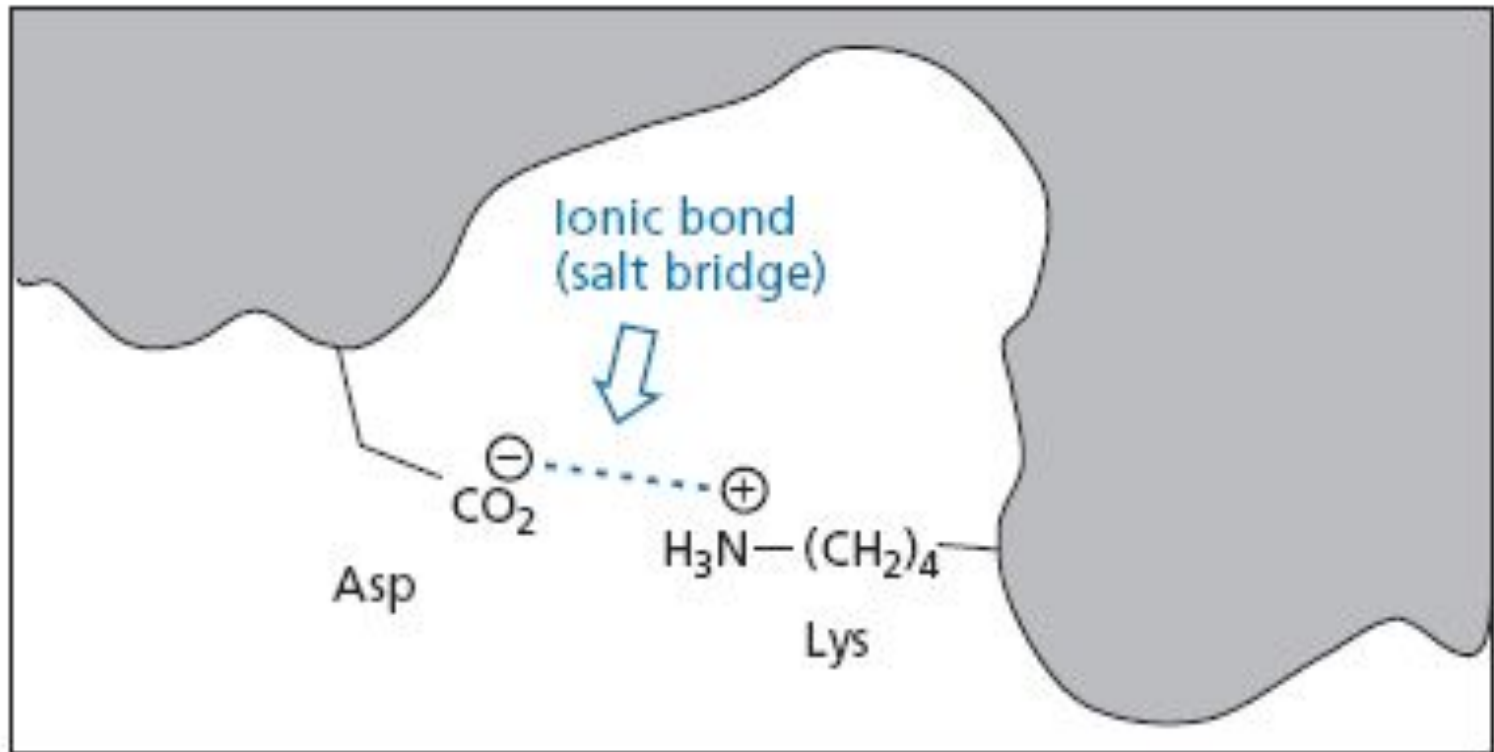




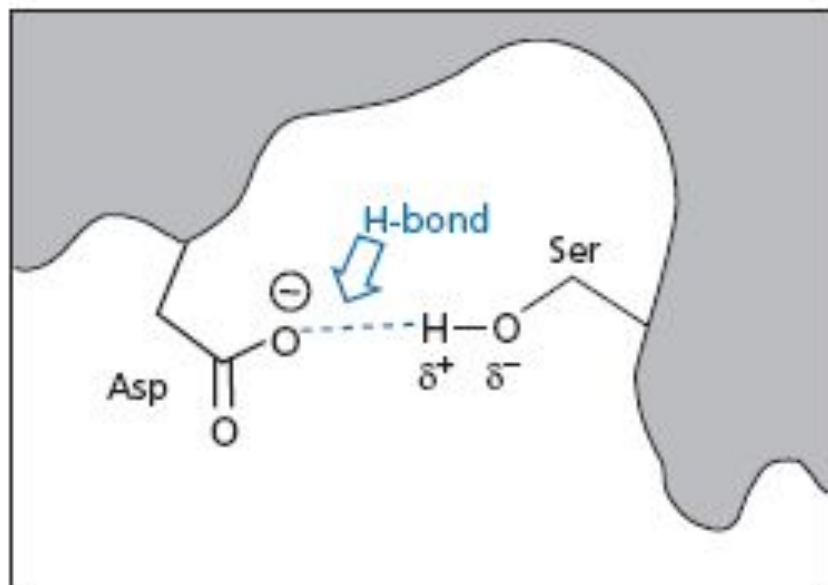
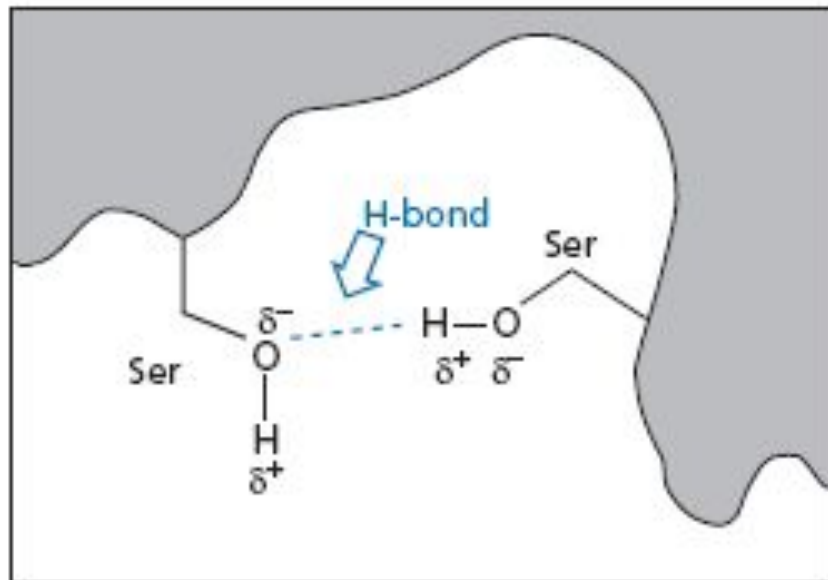
..... Repulsive interactions      ~~~~~ van der Waals interactions  
 ----- Hydrogen bonding interactions  
 ..... Ionic bonding interactions

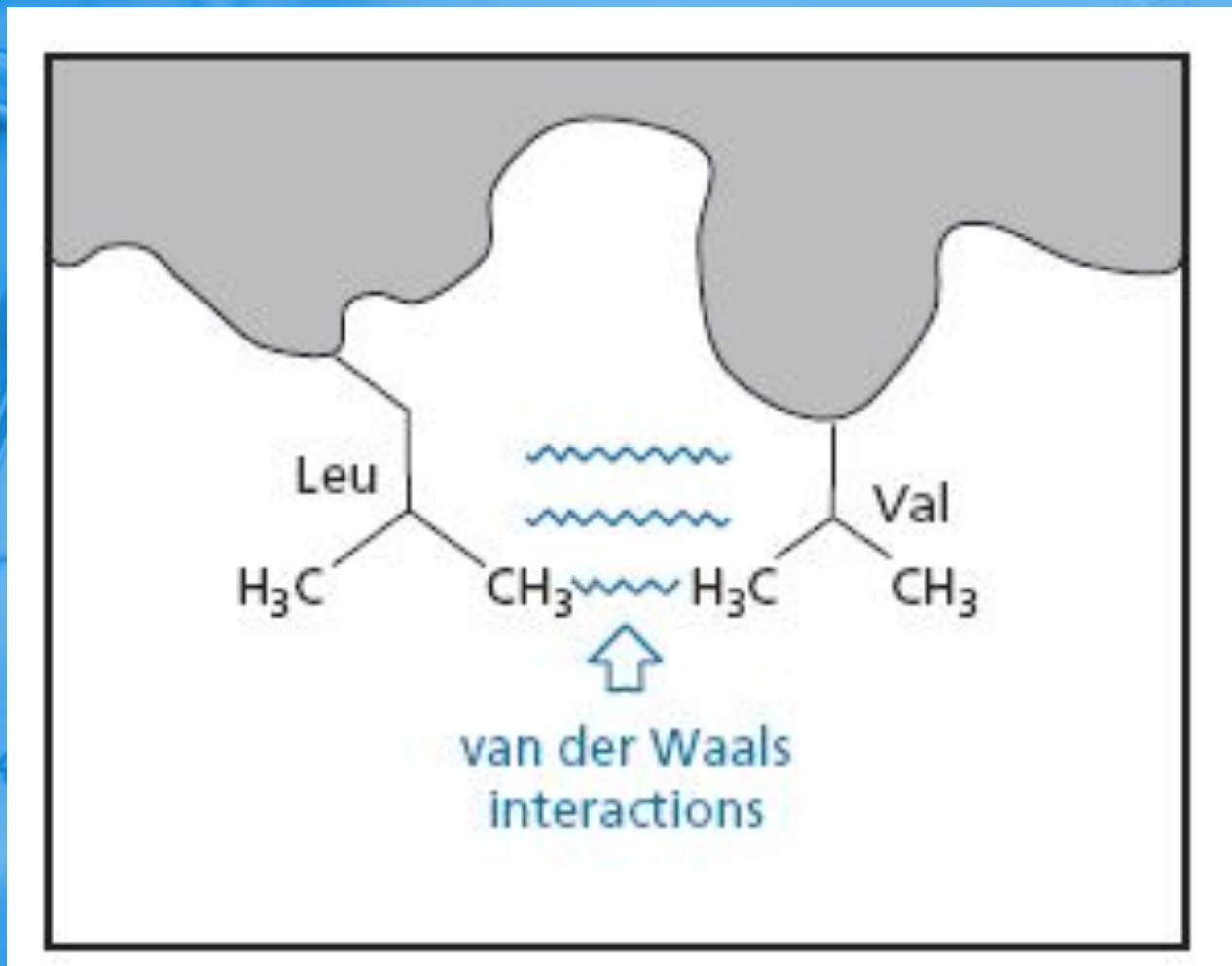


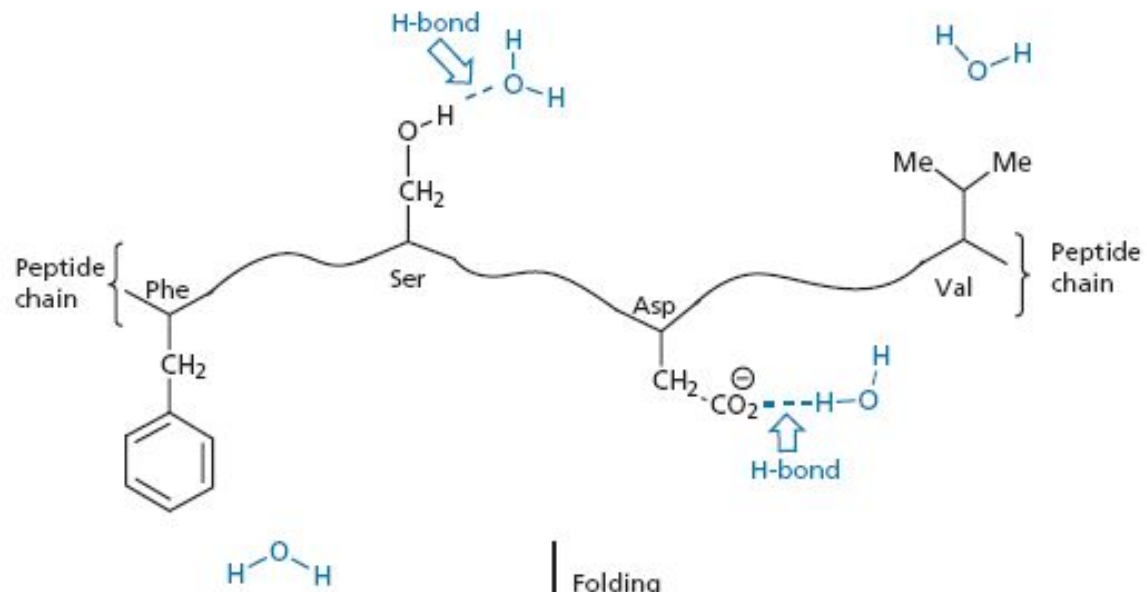




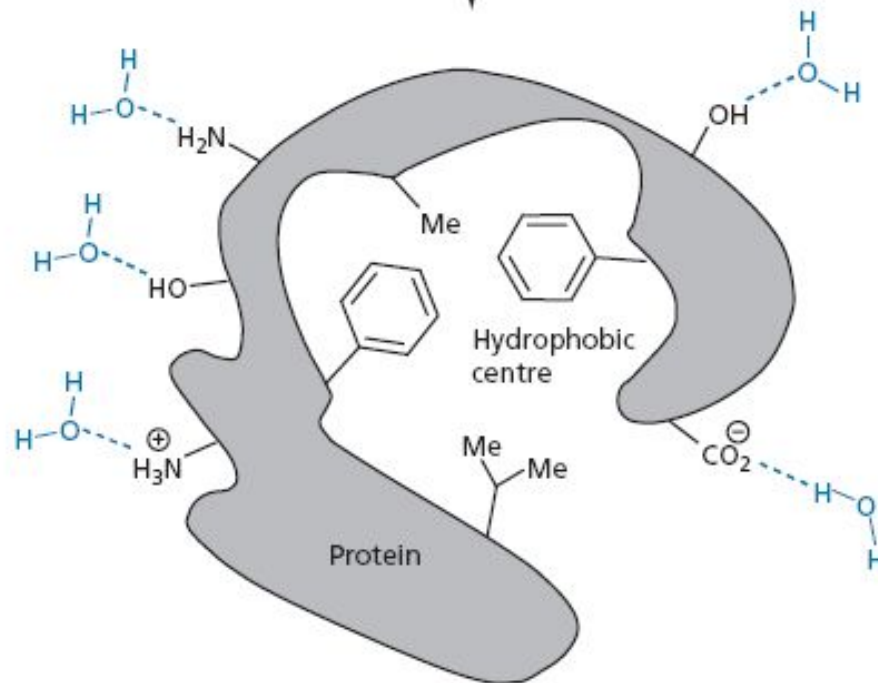


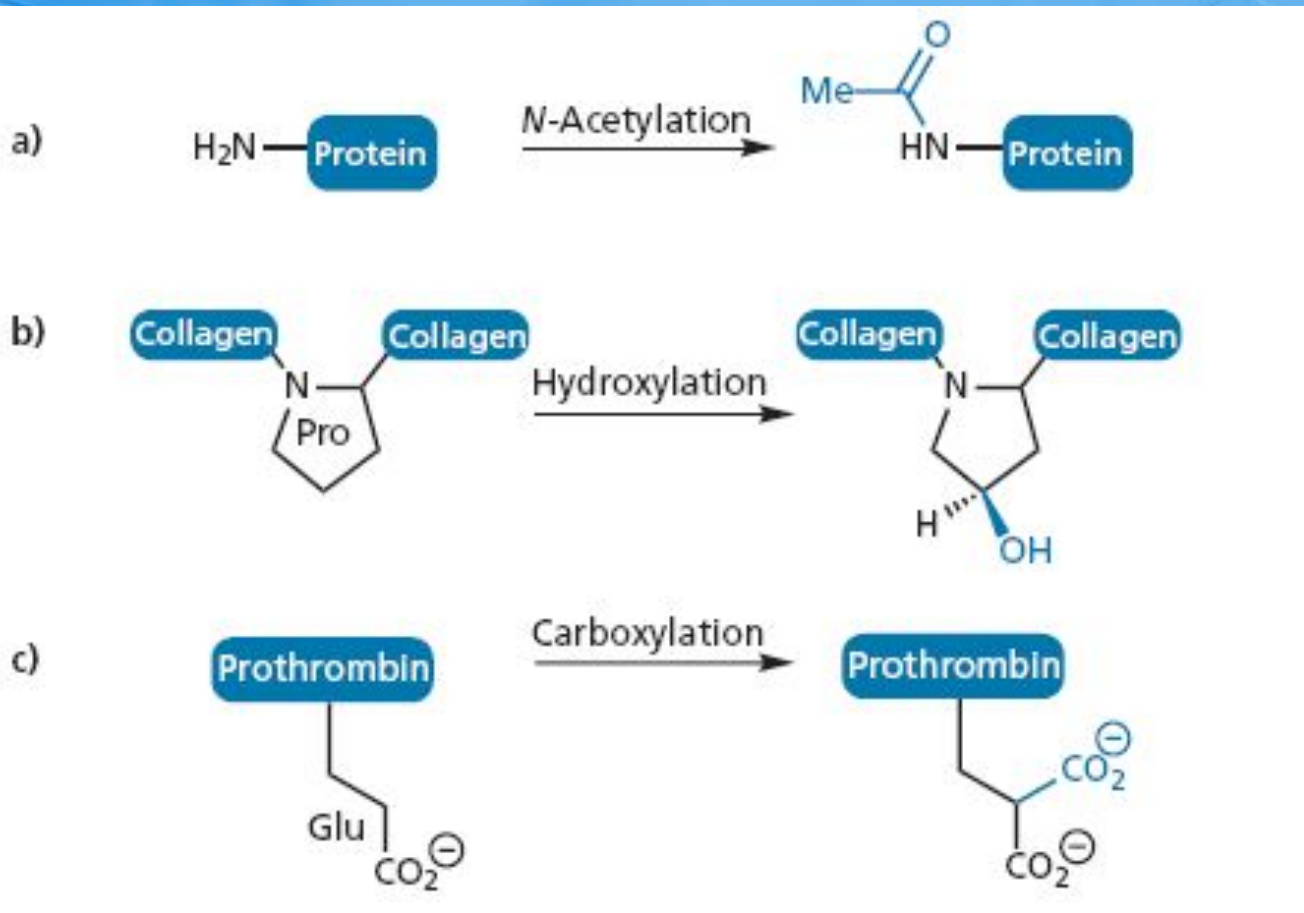




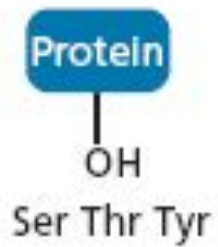


Folding

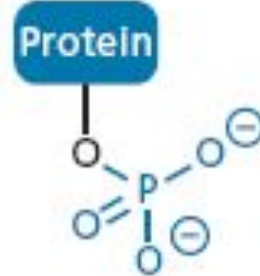




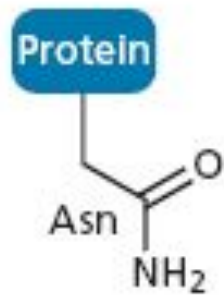
d)



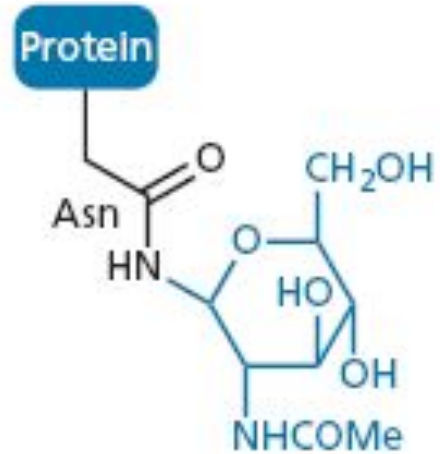
Phosphorylation

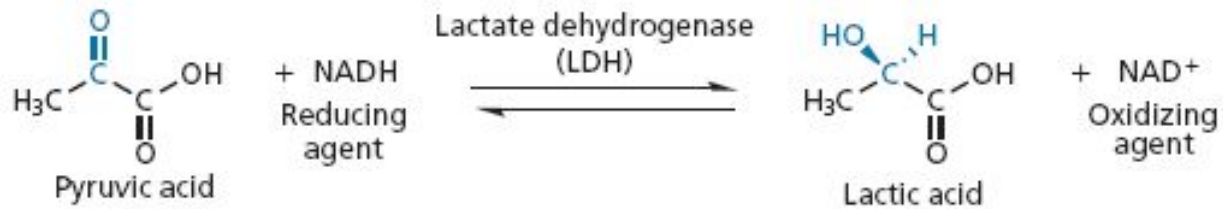


e)

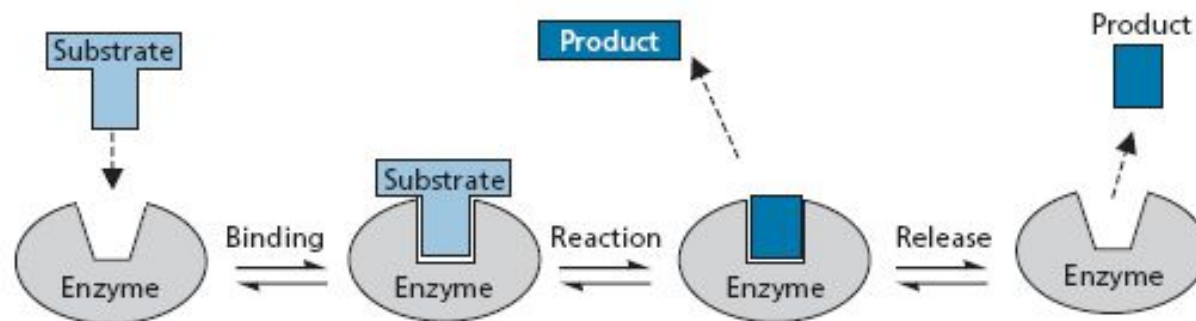
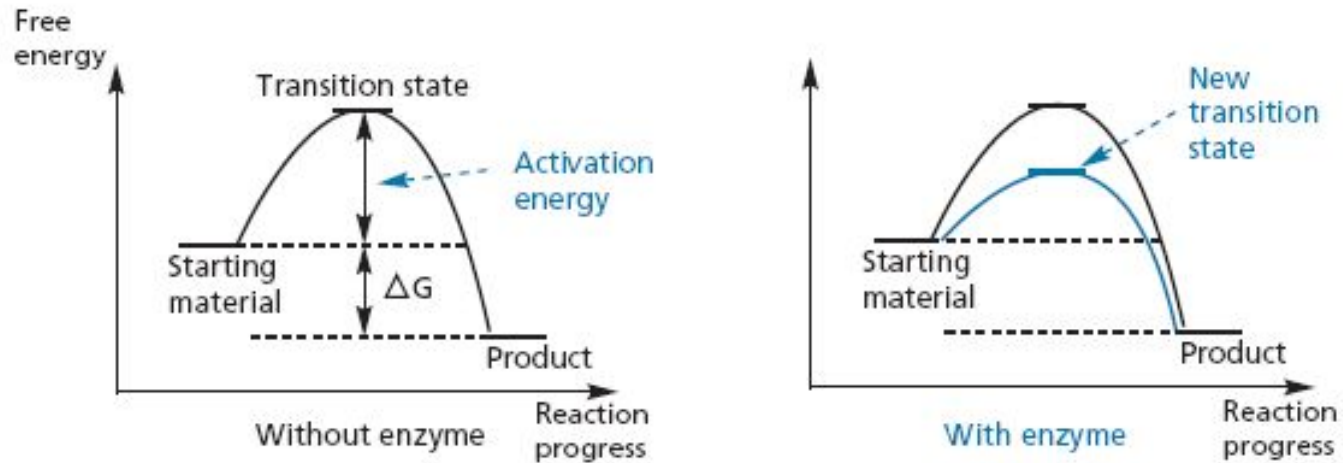


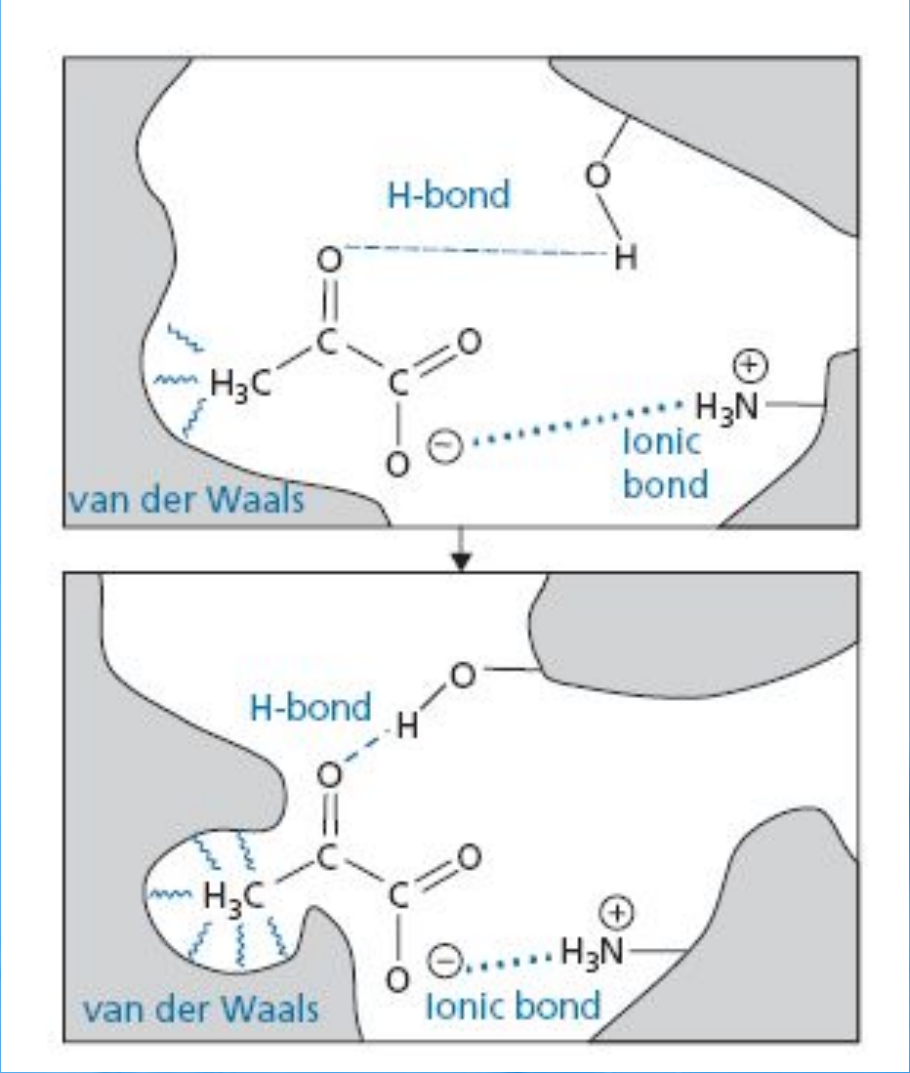
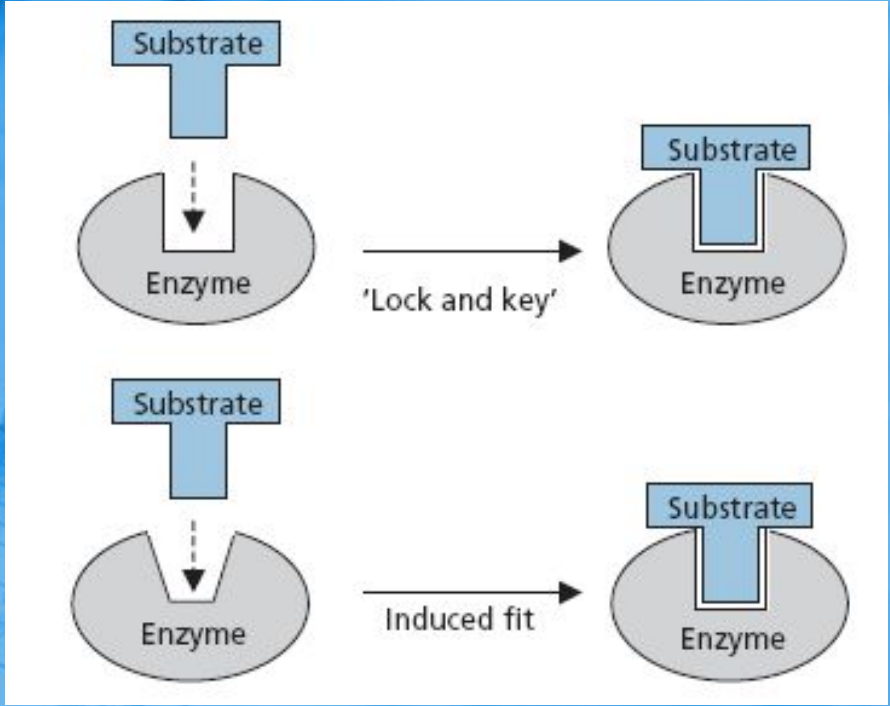
Glycosylation

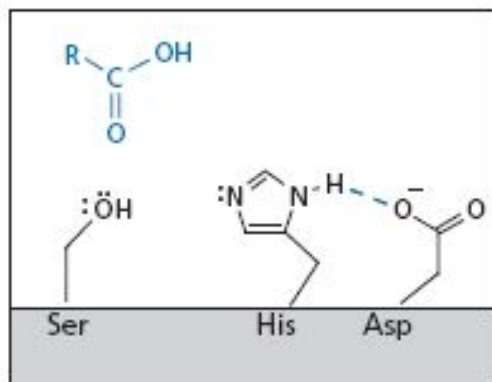
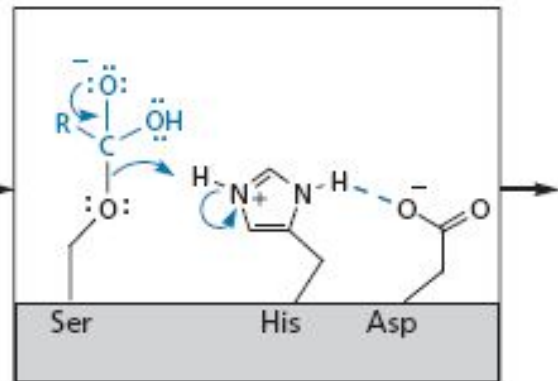
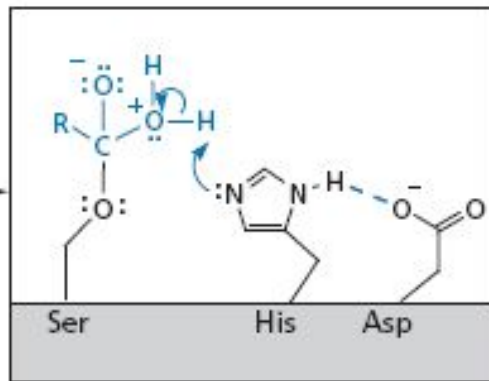
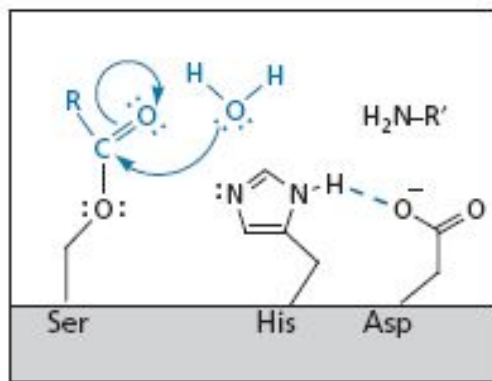
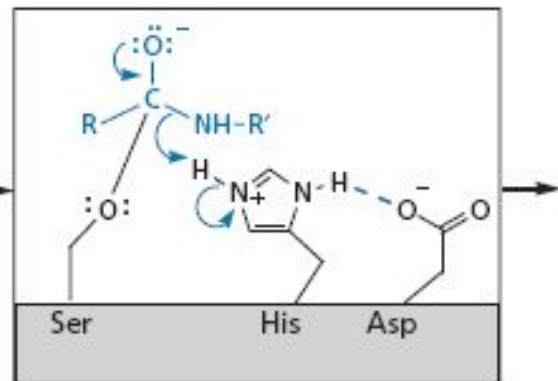
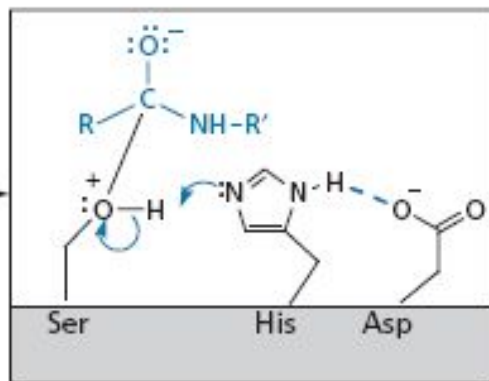
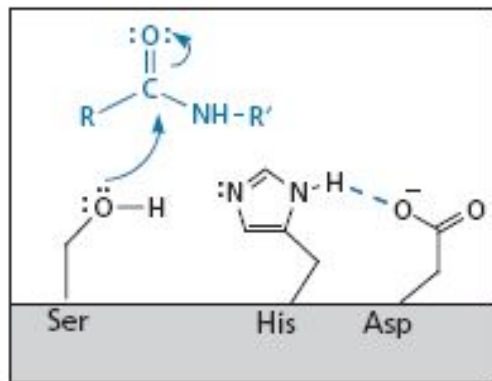




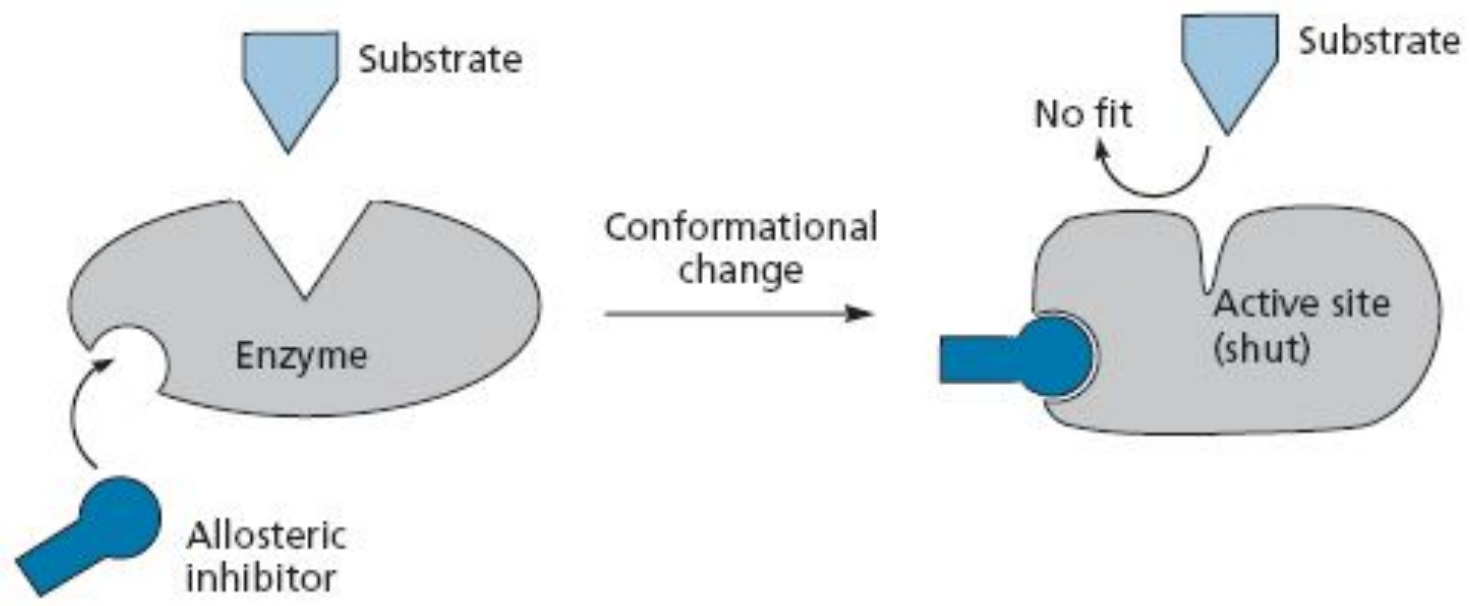
**FIGURE 3.1** Reaction catalysed by lactate dehydrogenase.





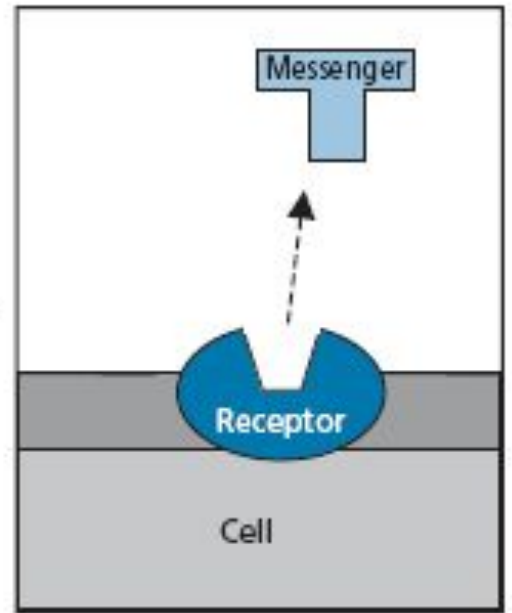
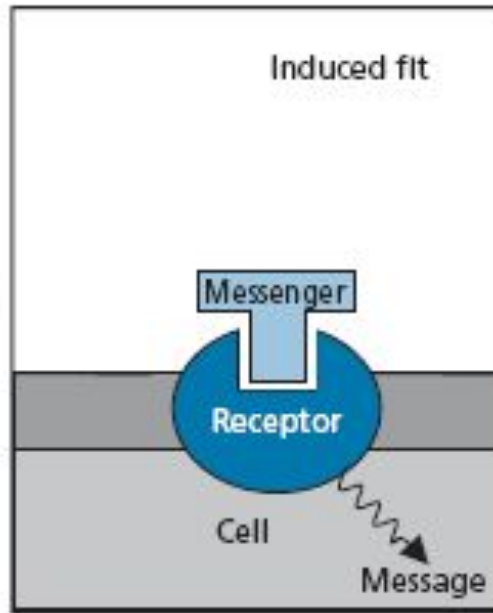
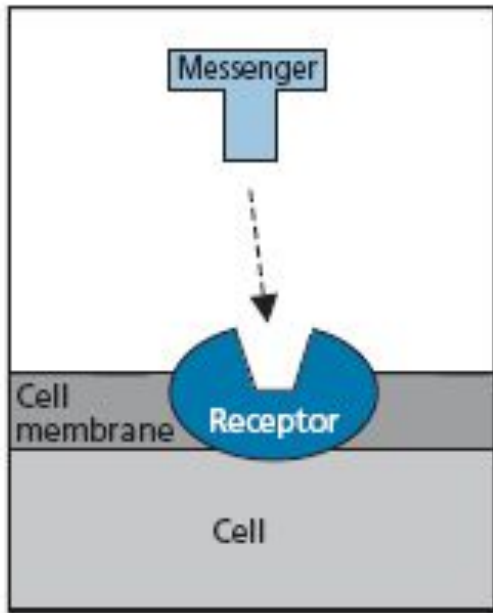


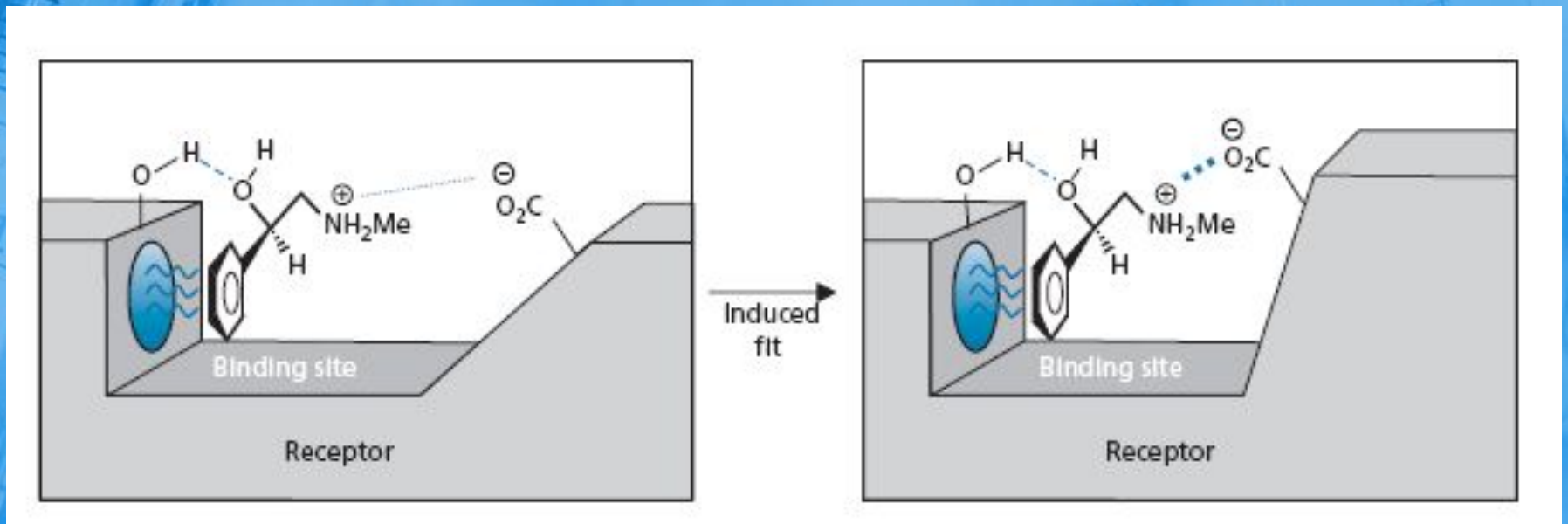
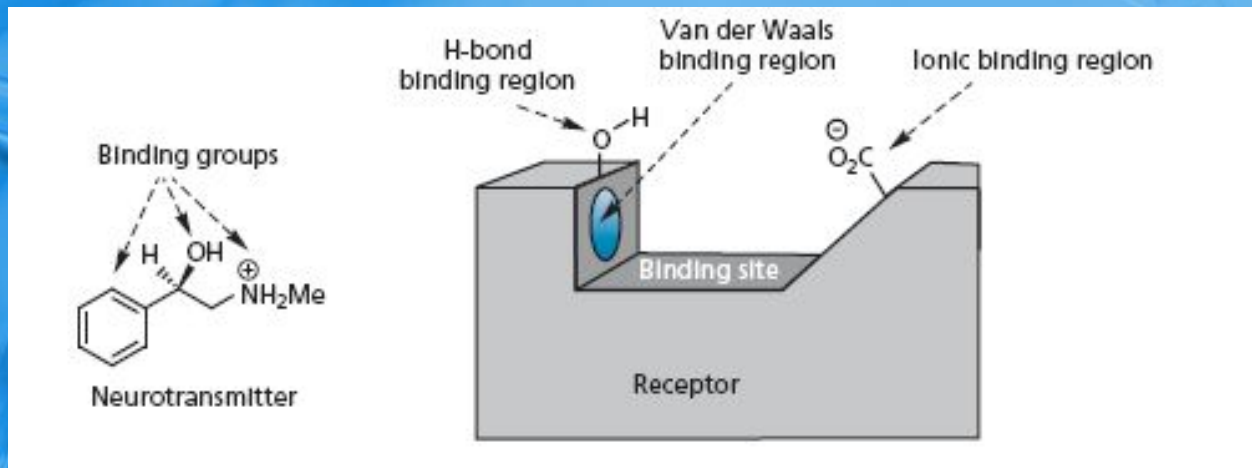


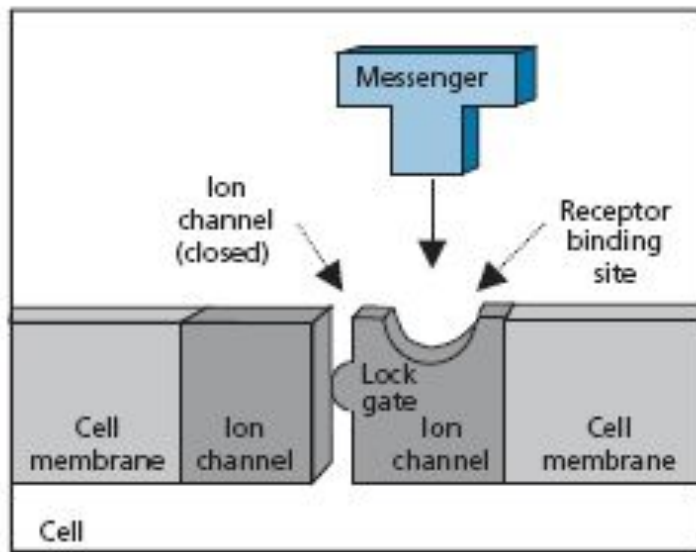


Клеточный рецептор — молекула (обычно белок или гликопротеид) на поверхности клетки, клеточных органелл или растворенная в цитоплазме. Специфично реагирует изменением своей пространственной конфигурации на присоединение к ней молекулы определённого химического вещества, передающего внешний регуляторный сигнал и, в свою очередь, передает этот сигнал внутрь клетки или клеточной органеллы, нередко при помощи так называемых вторичных посредников или трансмембранных ионных токов.

Вещество, специфически соединяющееся с рецептором, называется лигандом этого рецептора. Внутри организма это обычно гормон или нейромедиатор либо их искусственные заменители, применяемые в качестве лекарственных средств и ядов (агонисты). Некоторые лиганды, напротив, блокируют рецепторы (антагонисты).







Induced fit and opening of ion channel

