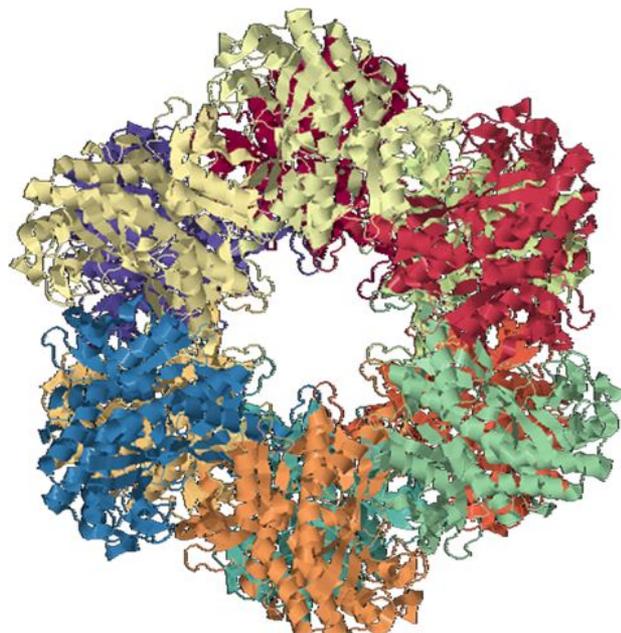


# Кружок по медицинской химии

Приглашаем студентов, интересующихся созданием лекарств, на занятия кружка по медицинской химии!



Пятое занятие **03 апреля** в **18:30** в **411**.

**Ждём Вас!**

**Подробная информация:**

[rnase@qsar.chem.msu.ru](mailto:rnase@qsar.chem.msu.ru)

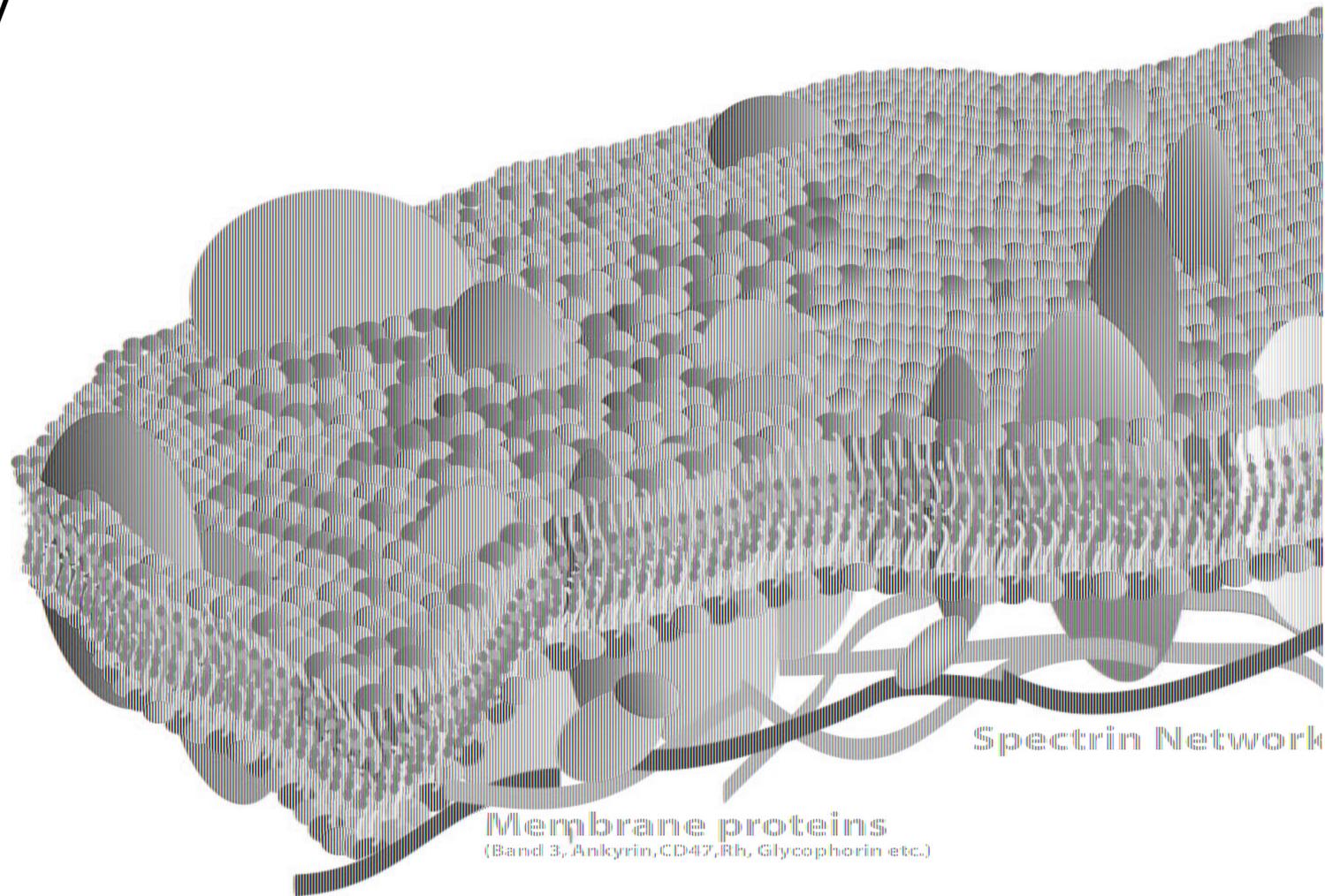
<http://qsar.chem.msu.ru/ru/obrazov/kruzhok>

<http://goo.gl/UCM8s0>

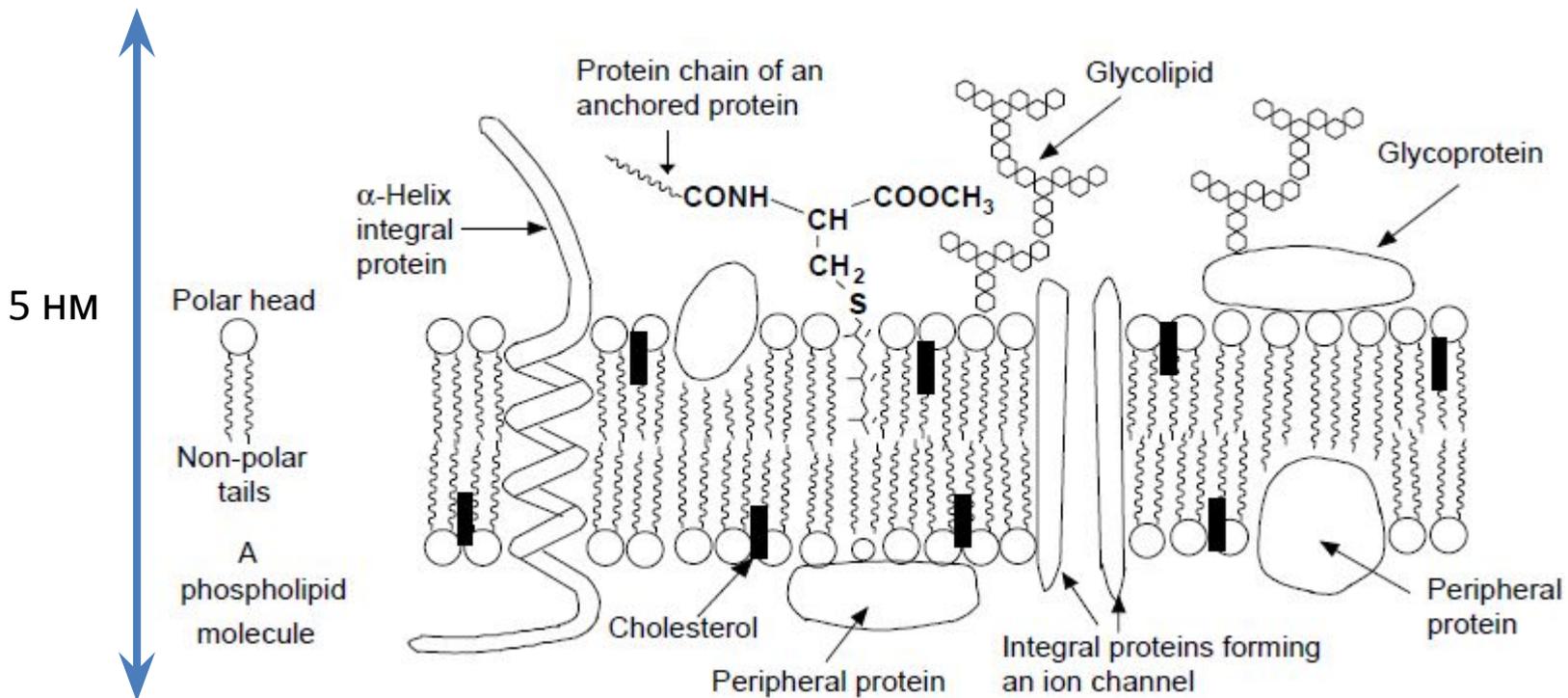


# Занятие 5

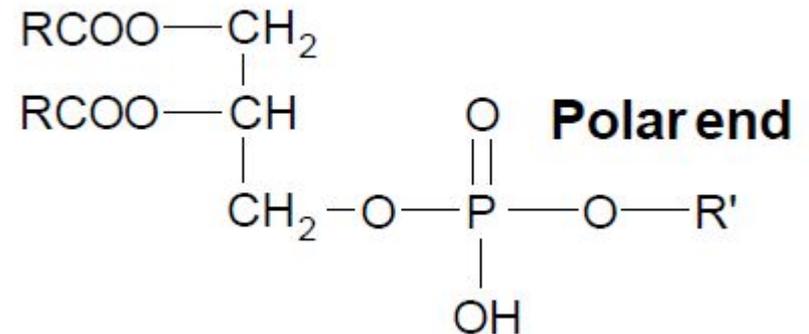
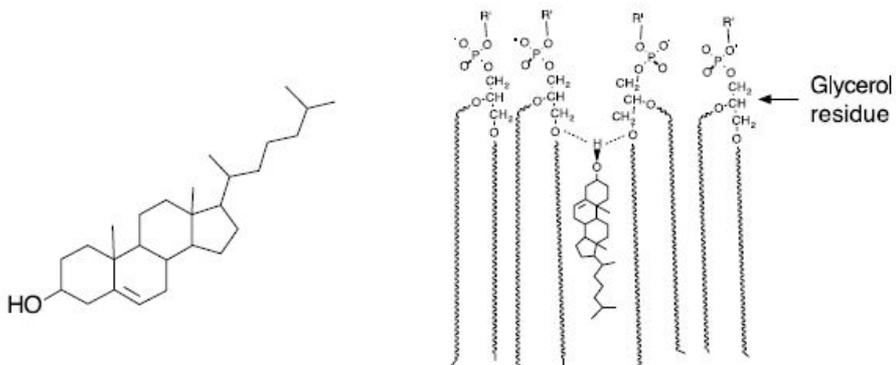
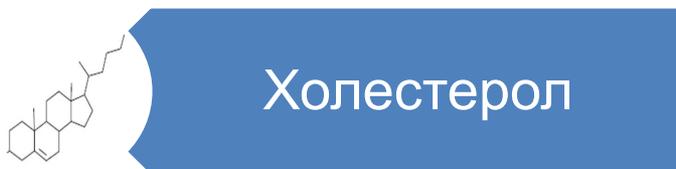
Вещества, действующие на мембрану клетки и клеточную стенку



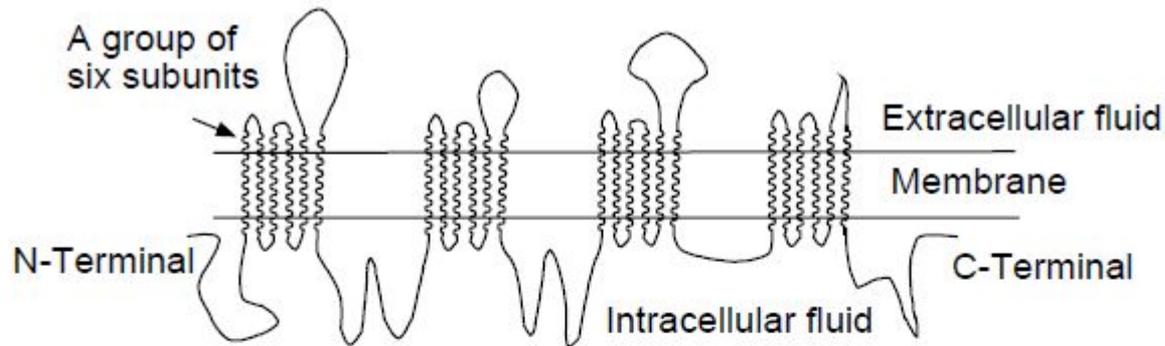
# Строение мембраны



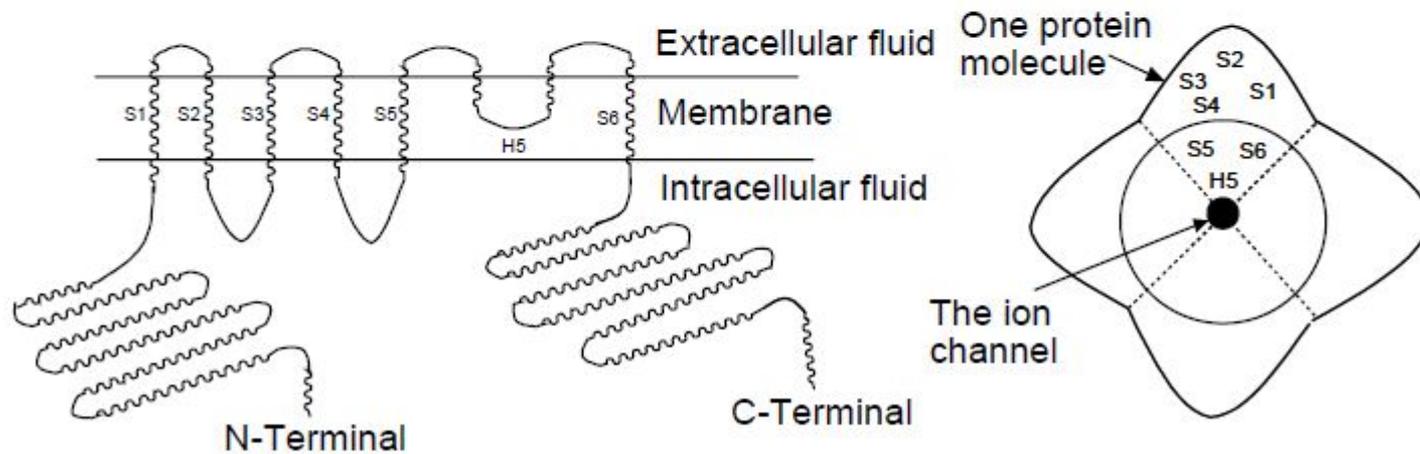
# Состав мембраны



# Мембрана и белки



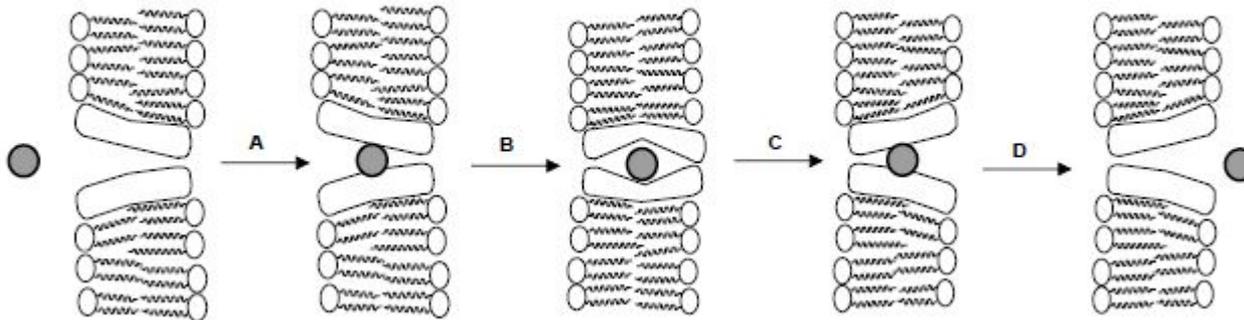
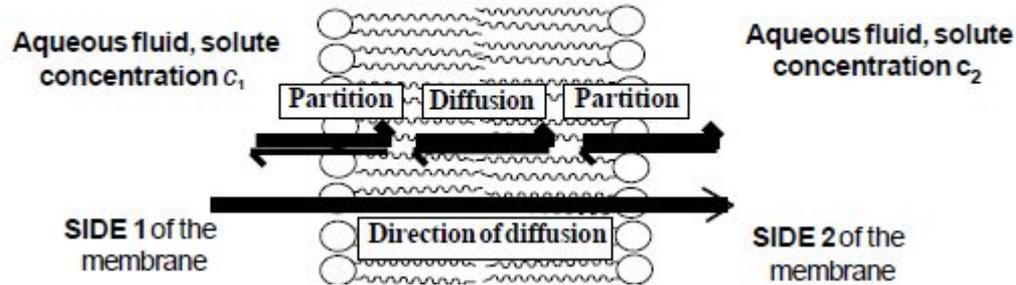
(a) Na<sup>+</sup> ion channel protein



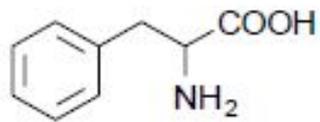
(b) Side view

(c) Top view

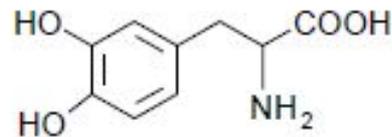
# Активный и пассивный транспорт



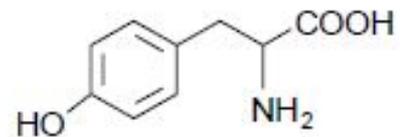
# Активный транспорт



Phenylalanine



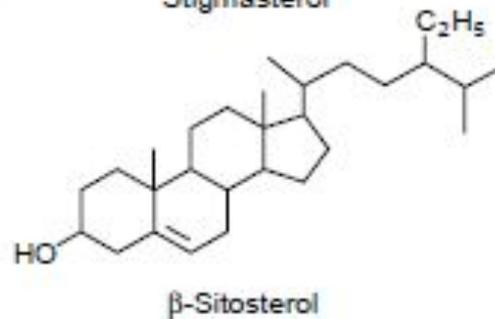
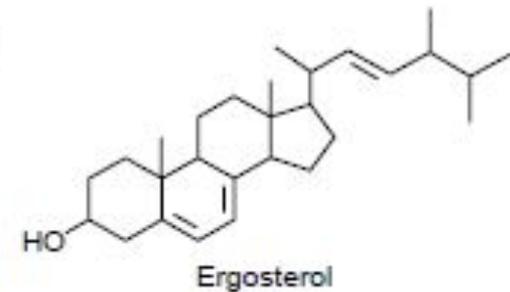
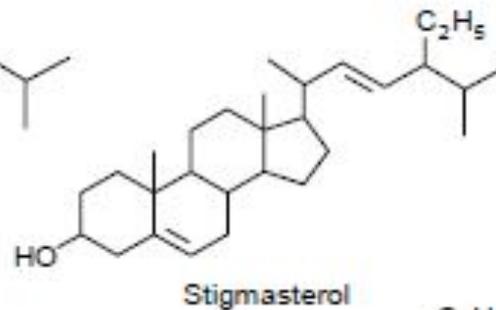
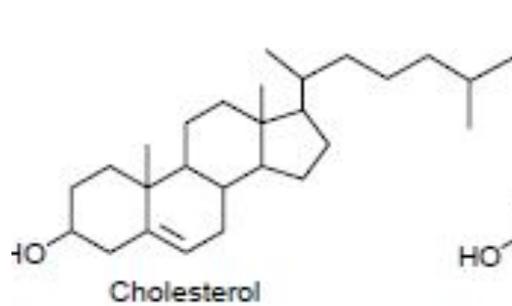
Levodopa



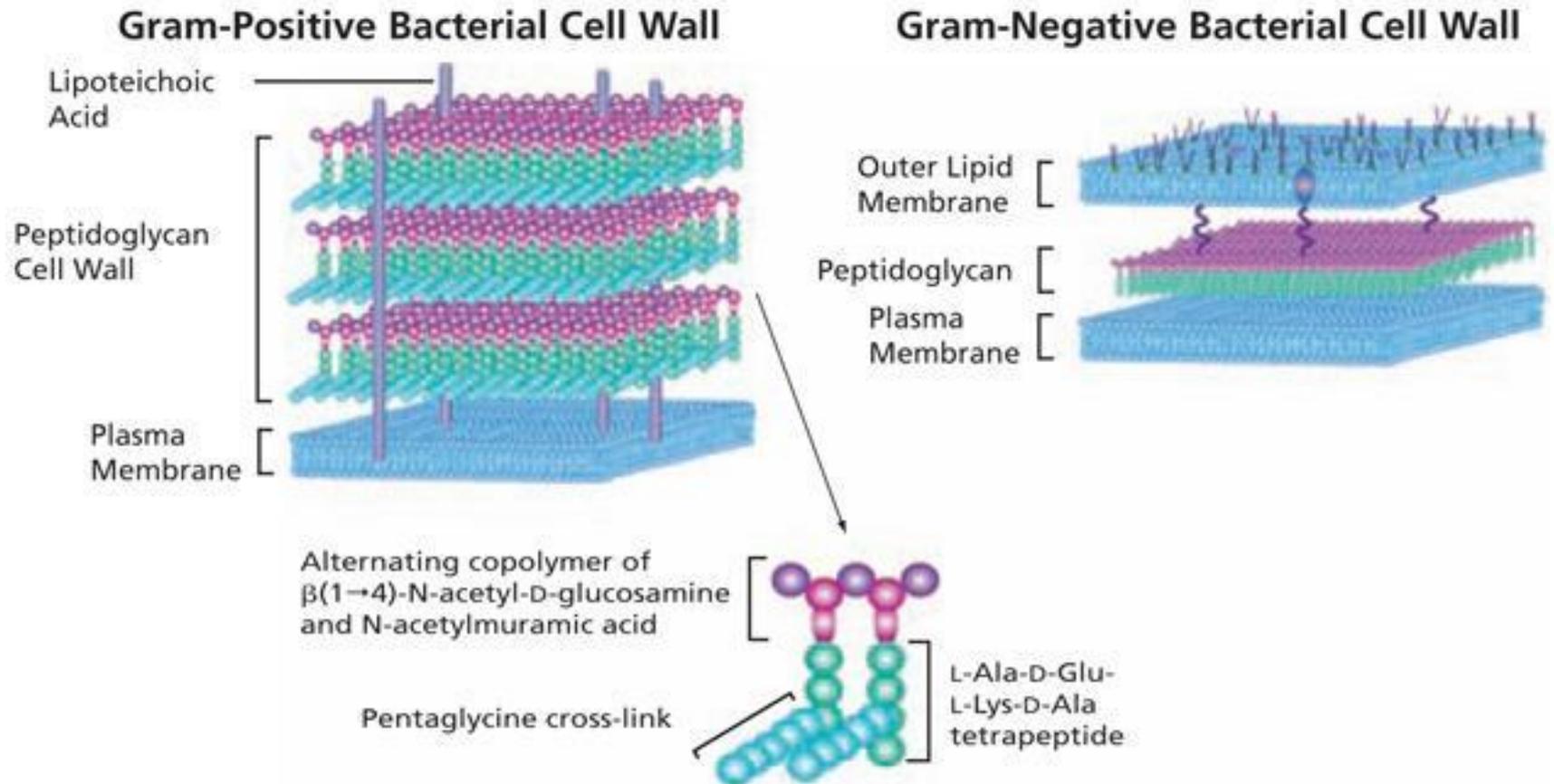
Tyrosine

# Различие в мембранах

Compound	Animals	Bacteria	Fungi	Plants
<b>Steroids</b>	Cholesterol	Rare	Ergosterol (yeast and other fungi)	Stigmasterol Sitosterol Cytosterol
<b>Phospholipids</b>	PC, PE, DPG, SM	PC, PE, PI (cyanobacteria)		PC, PE, PI, DPG (chloroplasts)

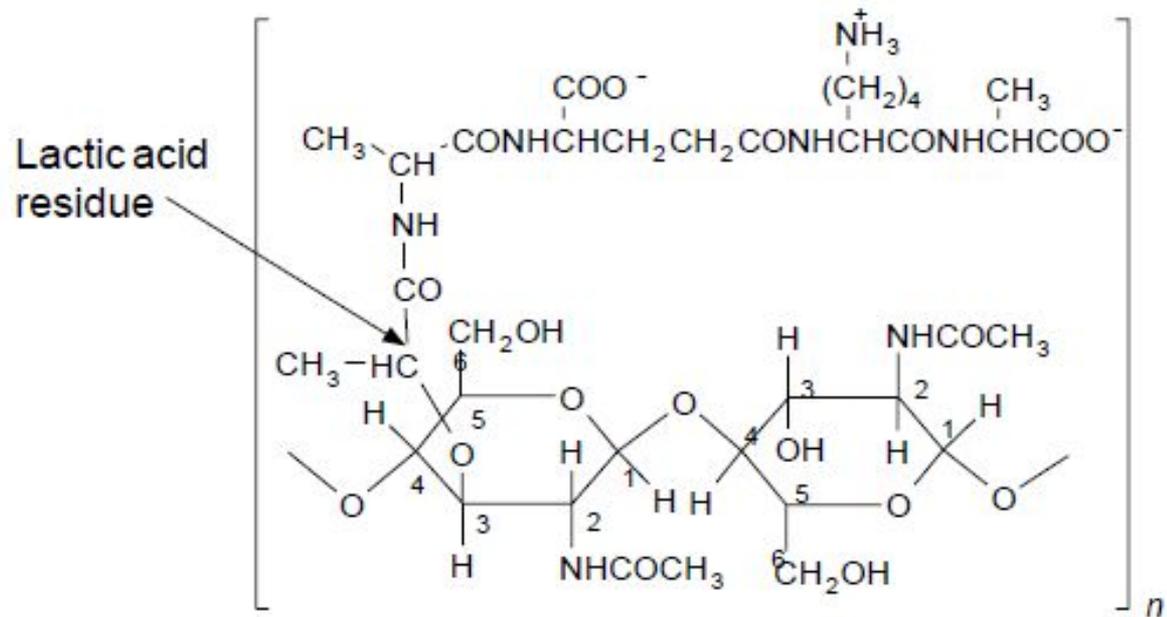


# Строение клеточной стенки бактерий



# Пептидогликан

Tetrapeptide chain L-alanine — D-glutamic acid — L-lysine — D-alanine



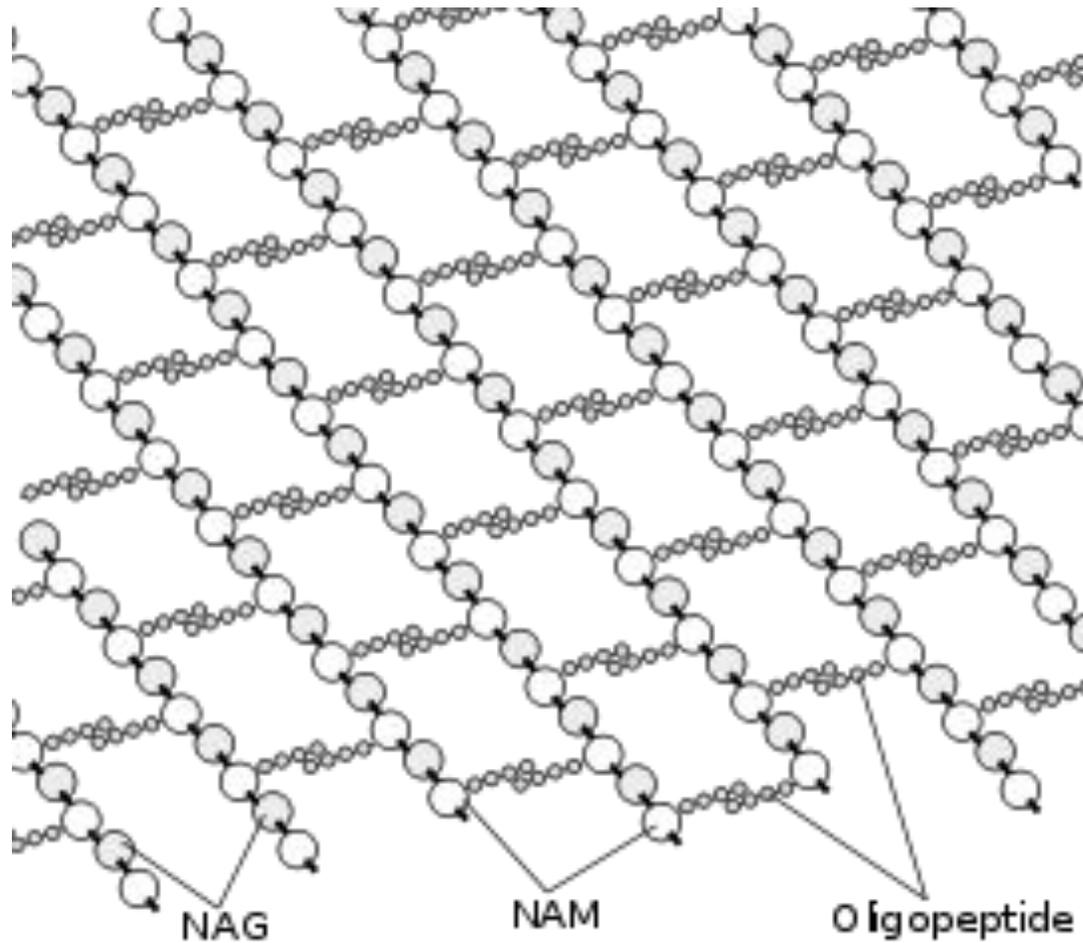
**NAM**

$\beta$ -N-acetylmuramic acid

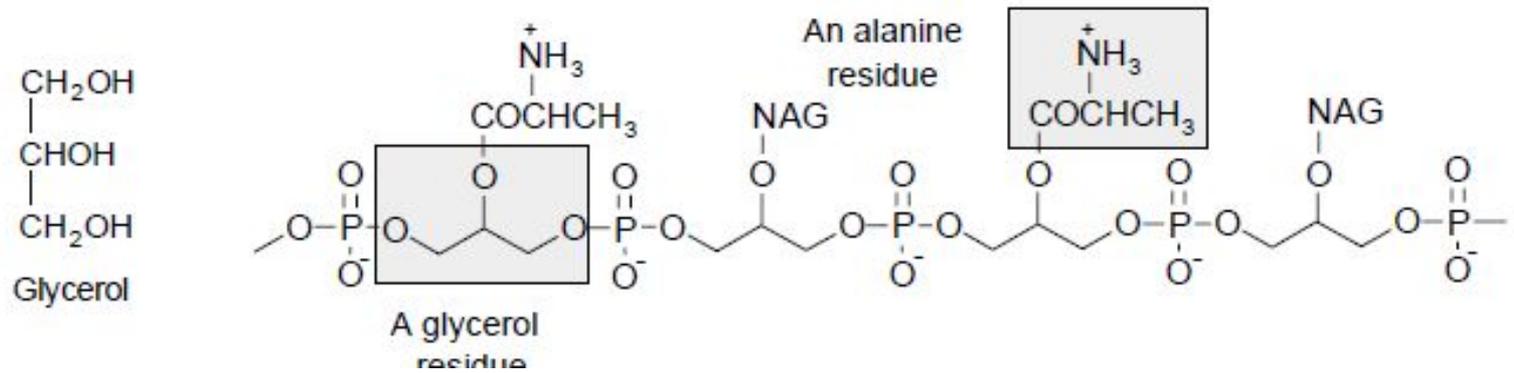
**NAG**

$\beta$ -N-acetylglucosamine (NAG)

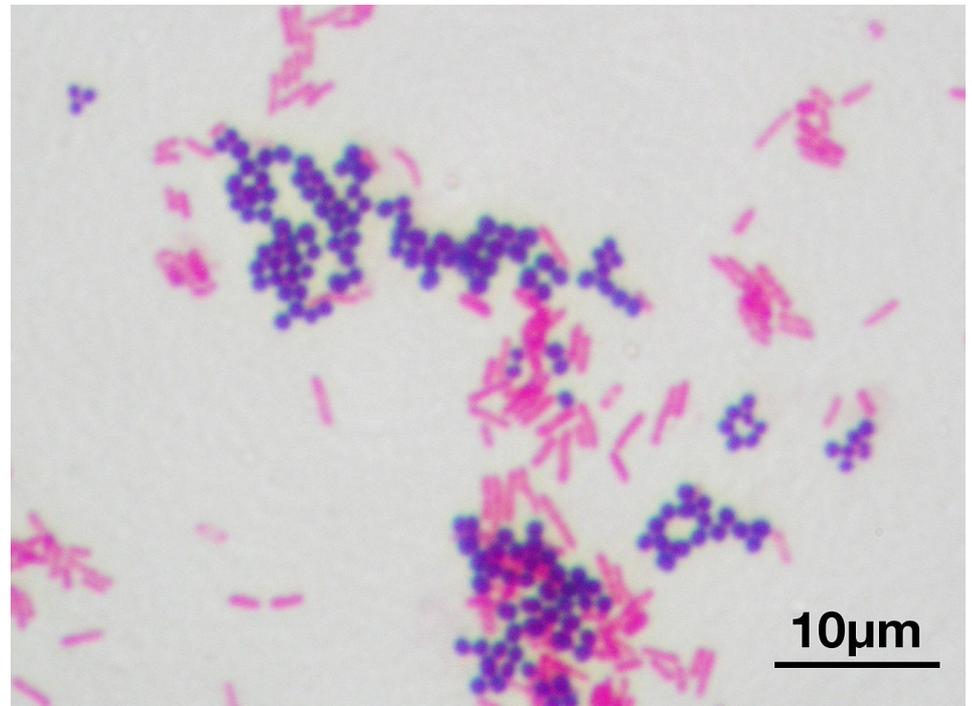
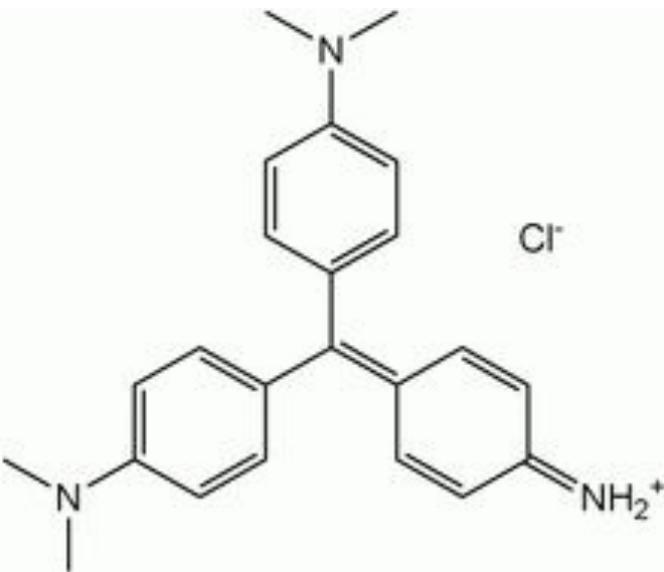
# Клеточная стенка



# Тейхоевые кислоты



# Окрашивание по Граму



# Классификация соединений, действующих на клеточные мембраны и стенку

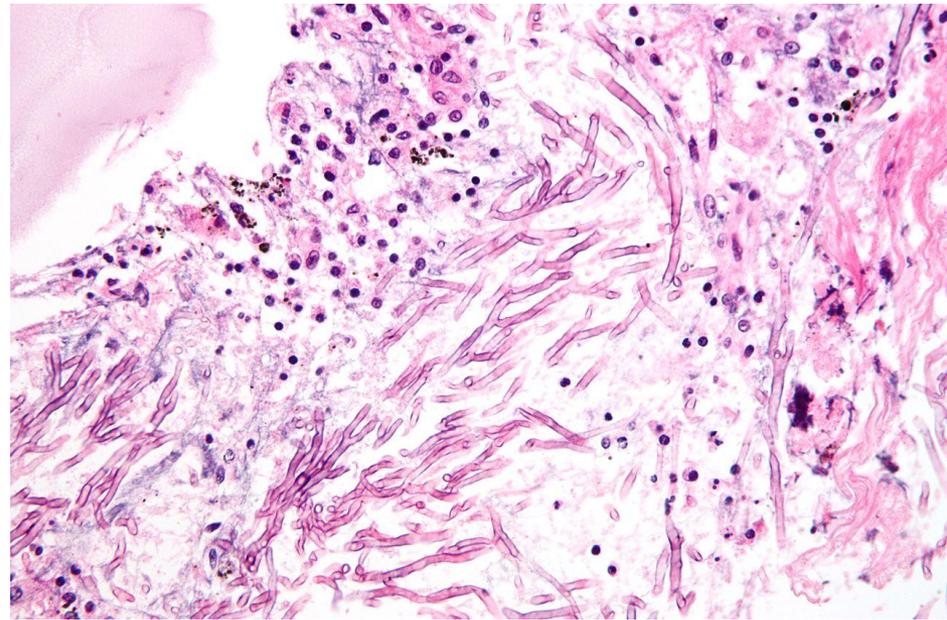
Ингибирование ферментов, отвечающих за синтез соединений необходимых для мембраны или стенки

Ингибирование процессов образования клеточных стенок

Образование каналов переноса веществ

Изменение физико-химических свойств мембраны

# Противогрибковые соединения

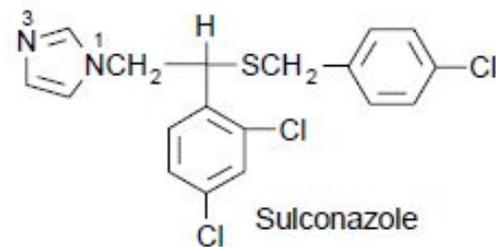
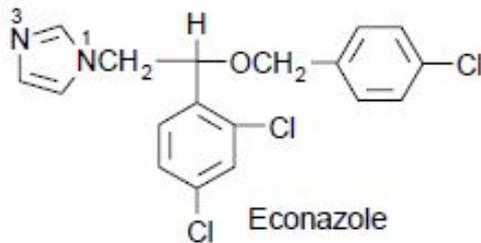
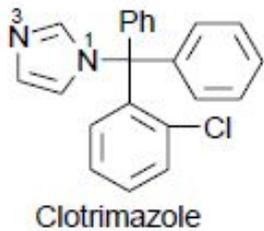
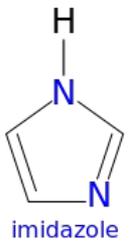


- Азолы
- Аллиламины
- Фенолы
- Другие

# Противогрибковые соединения.

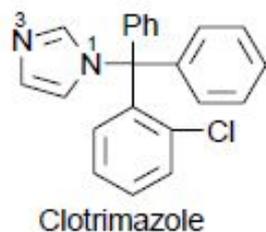
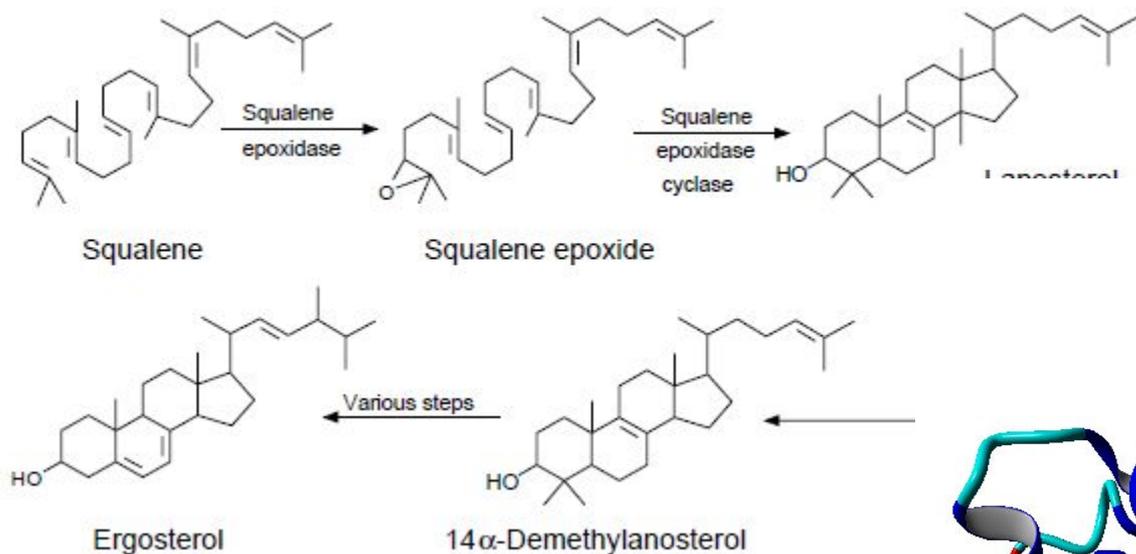
## Азолы

—эффективны против большинства грибов, инфицирующих кожу и слизистые оболочки

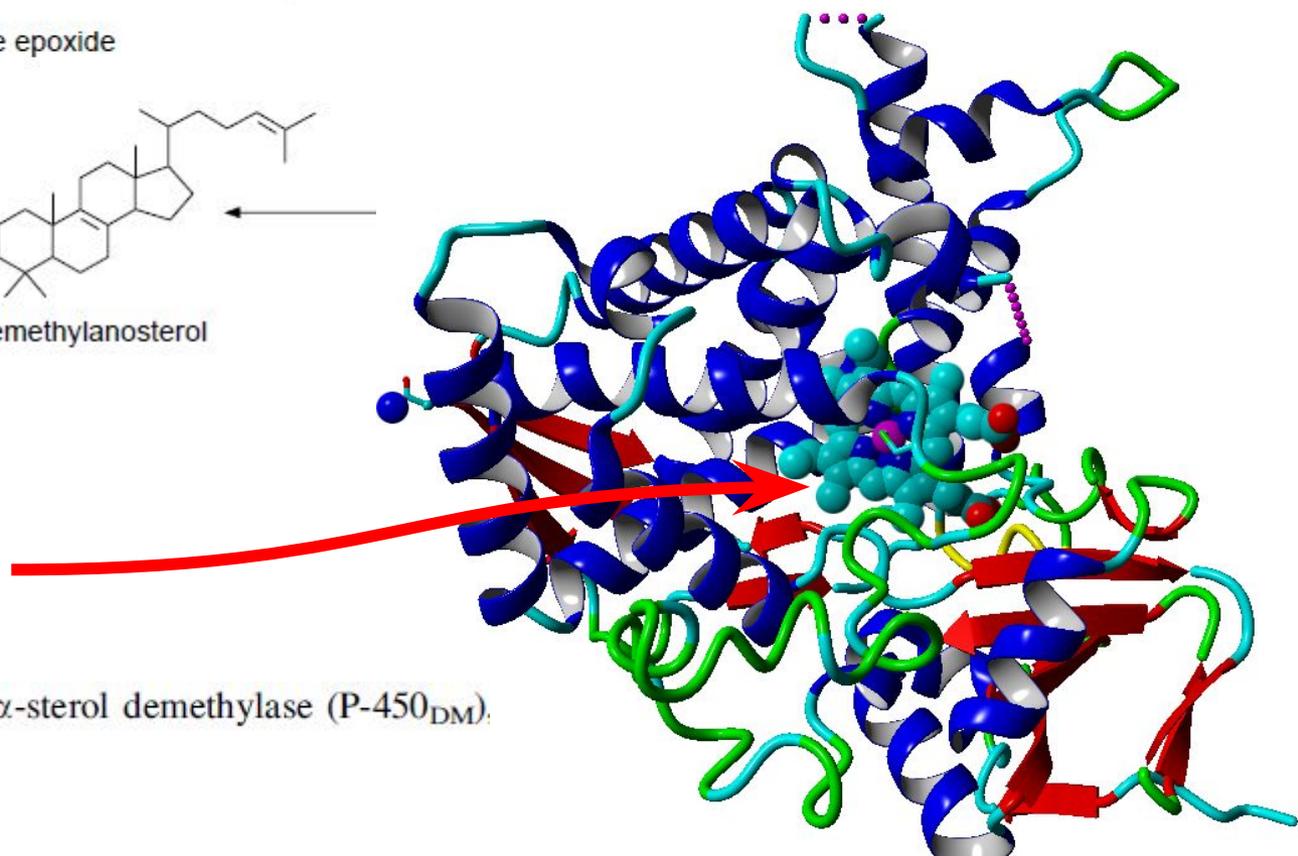


*Местно*, наносят тонким слоем на пораженные участки кожи и слизистых оболочек 2–4 раза в сутки. Курс лечения подбирают индивидуально, обычно — не менее 4 нед; по его завершении (исчезновение клинических проявлений) целесообразно продолжить применение препарата еще в течение 14 дней.

# Азолы. Механизм действия

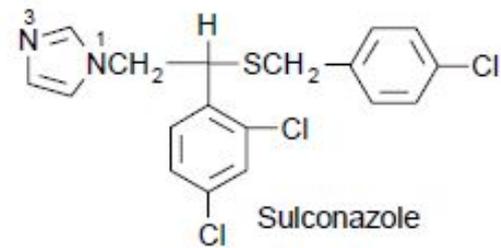
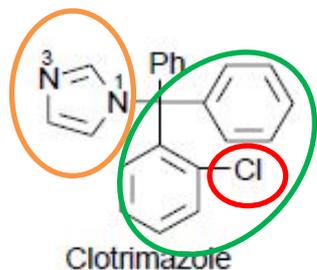


14 $\alpha$ -sterol demethylase (P-450<sub>DM</sub>).

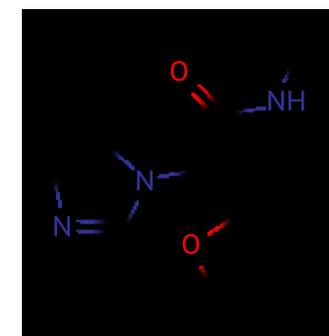
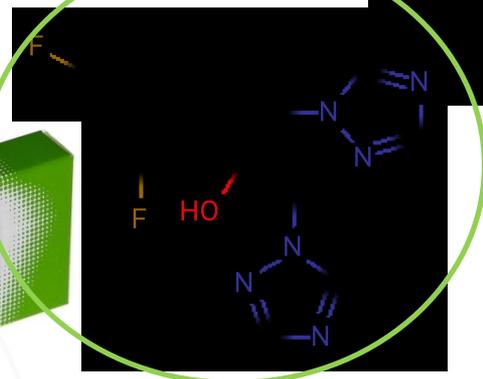
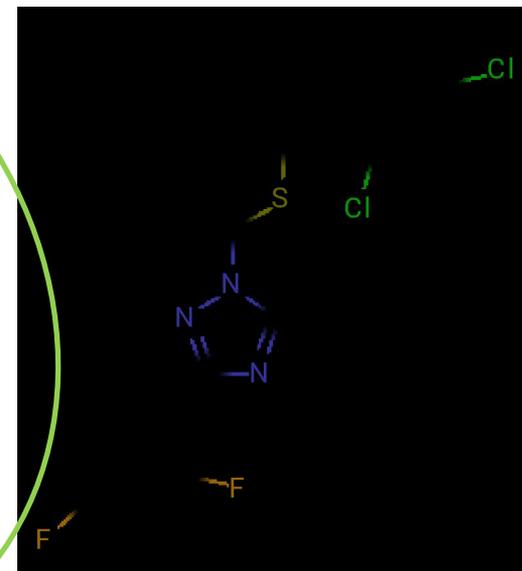
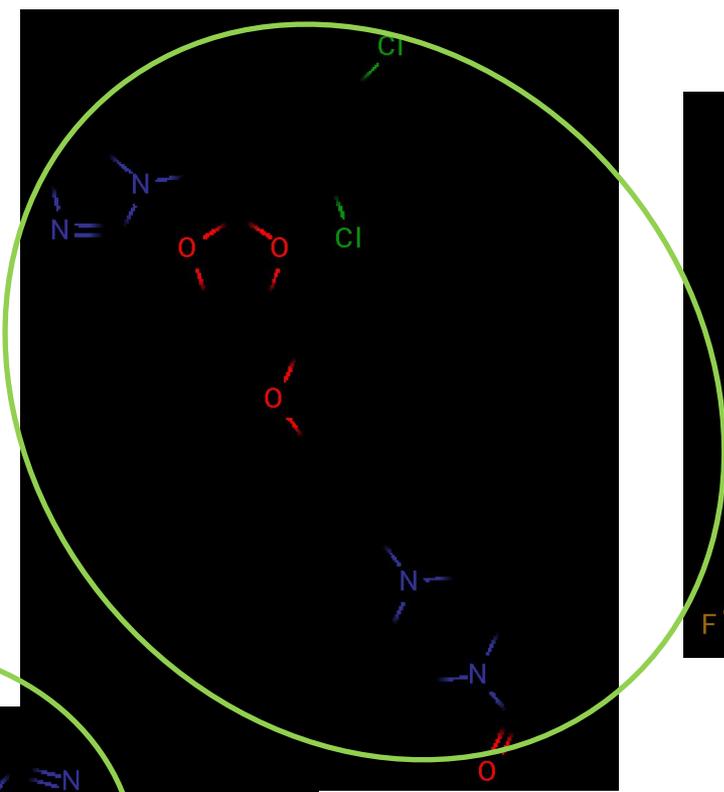
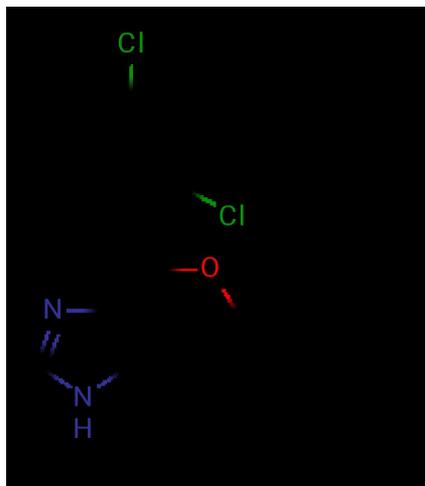


# Азолы. SAR

N-1 замещённые азолы или 1,2,4 триазолы. Заместители должны быть липофильными. Обычно они представляют собой 5 или 6 кольца, присоединённые через атом углерода с последующей эфирной связью, вторичным амином, тиоэфирной группой. Наиболее активные соединения содержат 2 или 3 ароматических кольца, моно- или полизамещённые в 2,4,6 положения (заместители хлор или фтор).

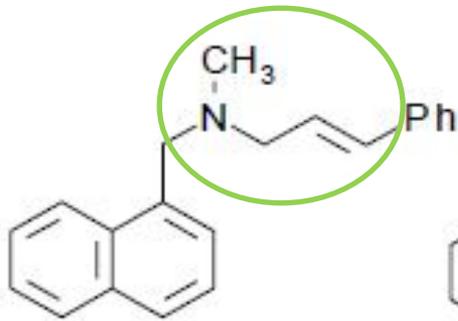


# АЗОЛЫ. SAR

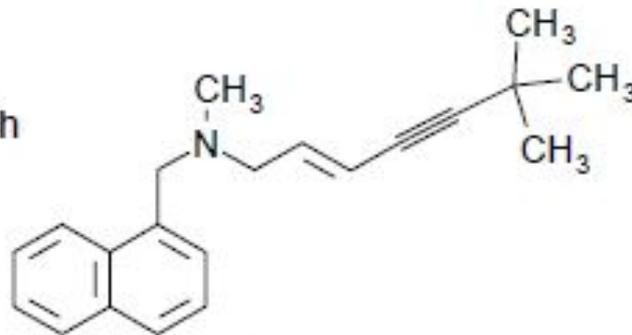


# Противогрибковые соединения. Аллиламины

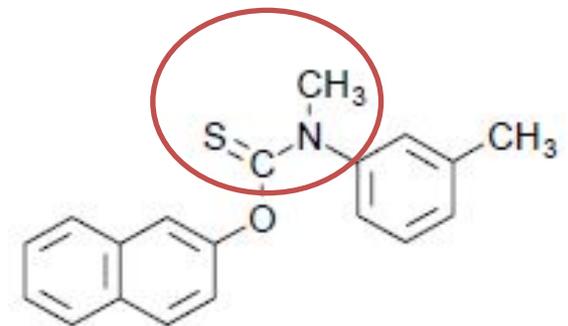
—ингибируют сквален  
монооксидазу



Naftifine



Terbinafine



Tolnaftate

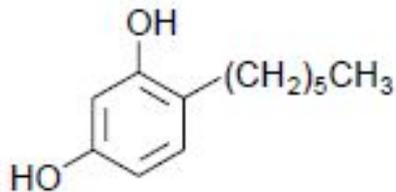


Грибковые поражения кожи,  
ногтей и волос, кандидоз кожи  
и слизистых оболочек.

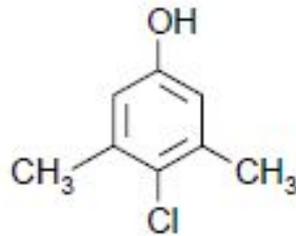
# Противогрибковые соединения.

## Фенолы

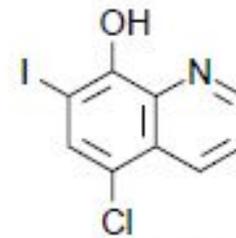
— разрушают отдельные участки мембраны



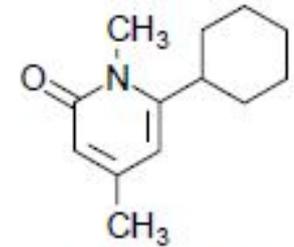
Hexylresorcinol



Chloroxylenol



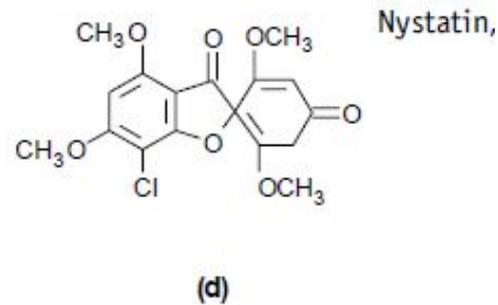
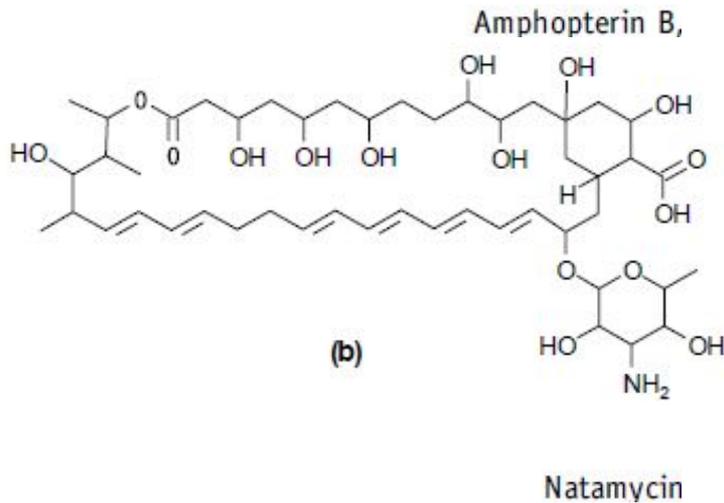
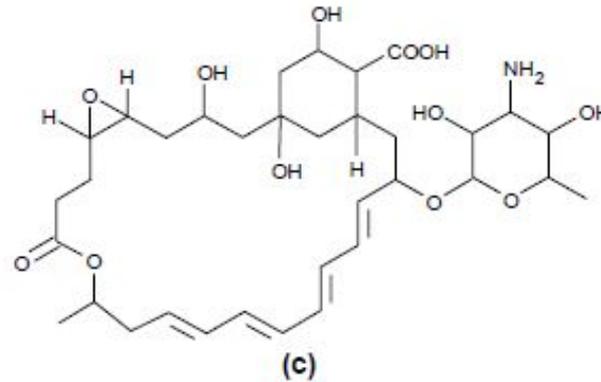
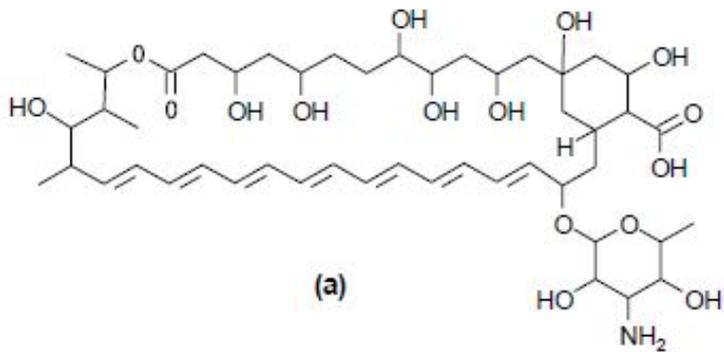
Clioquinol



Ciclopirox



# Антибиотики с противогрибковым действием

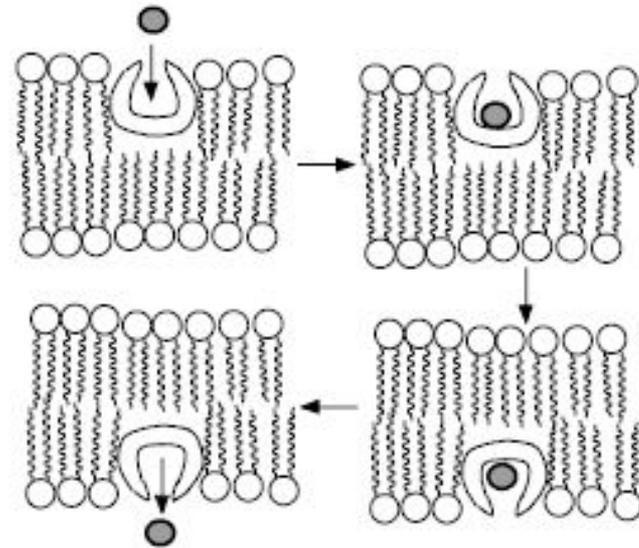
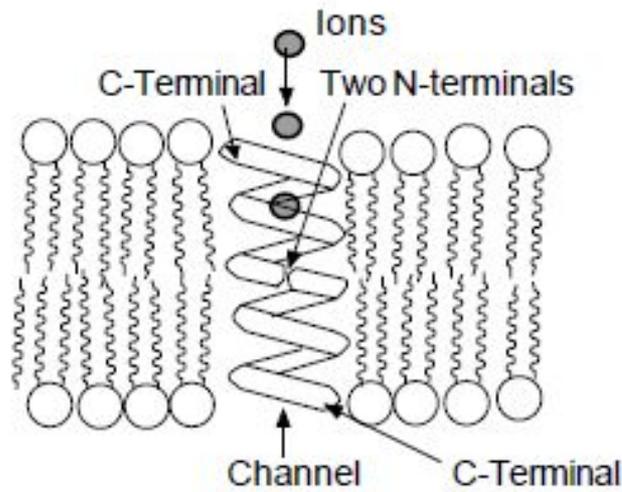


Griseofulvir

Антибиотик, продуцируемый плесневым грибом *Penicillium nigricans* (*griseofulvum*). Действует на микротубулярны е белки гриба.



# Ионофоры. Механизм действия

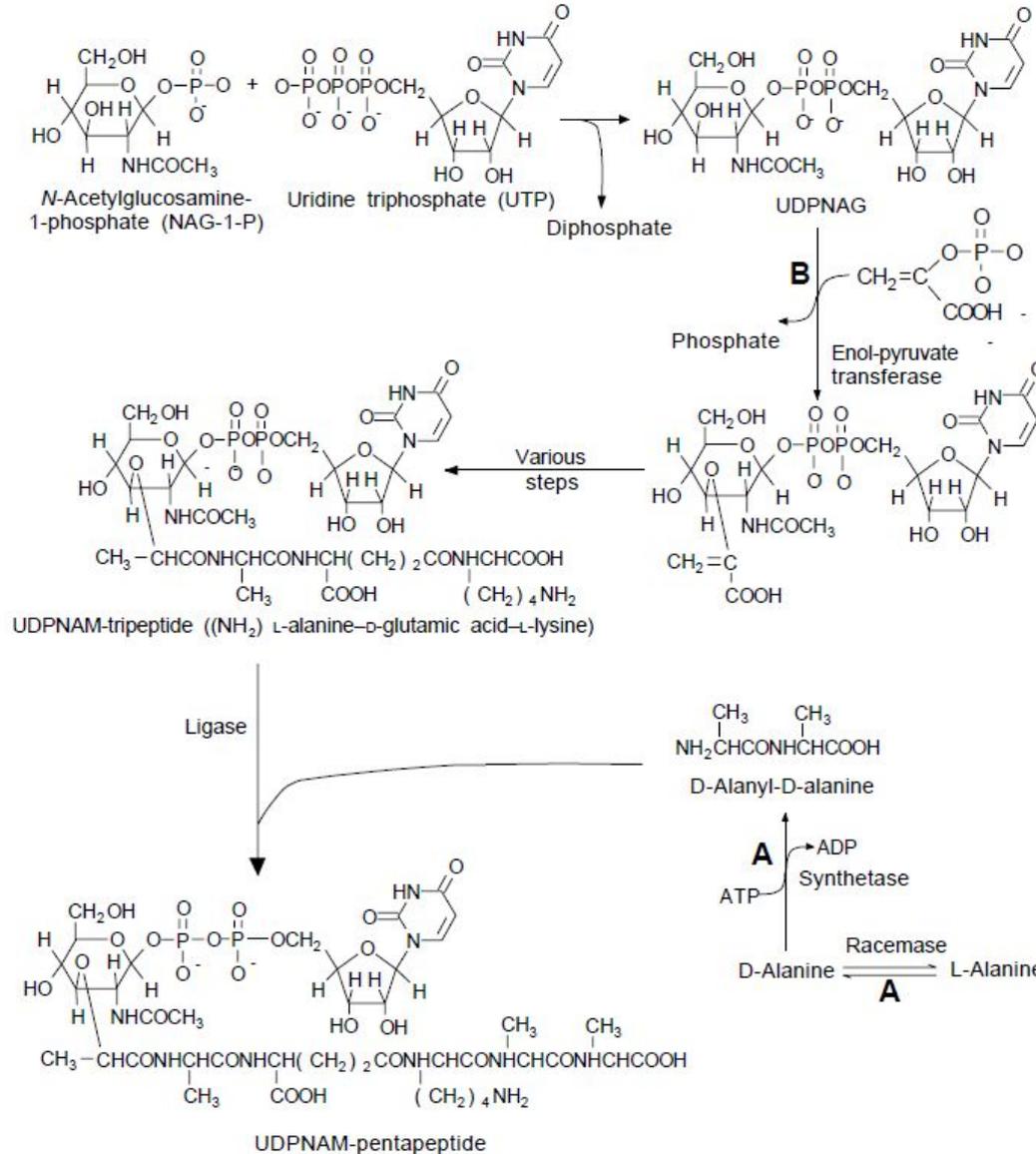


# Ингибиторы синтеза клеточной стенки

- Ингибиторы синтеза прекурсоров исходных материалов для клеточной стенки
- Ингибиторы образования пептидогликановых цепей
- Ингибиторы сшивания пептидогликановых цепей

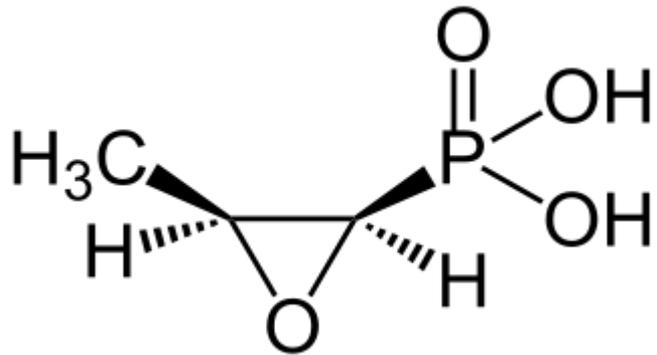
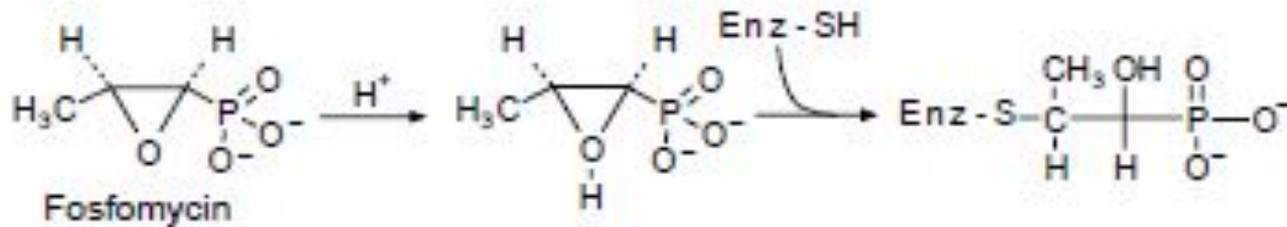
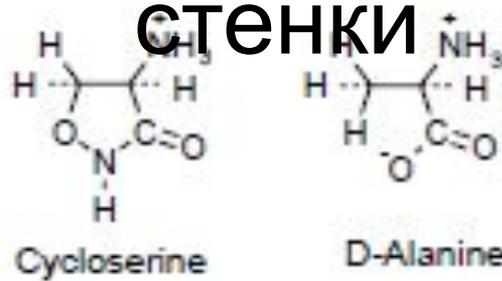
# ИНГИБИРОВАНИЕ СИНТЕЗА ПРЕКУРСОРОВ ИСХОДНЫХ МАТЕРИАЛОВ КЛЕТОЧНОЙ

## СТЕНКИ

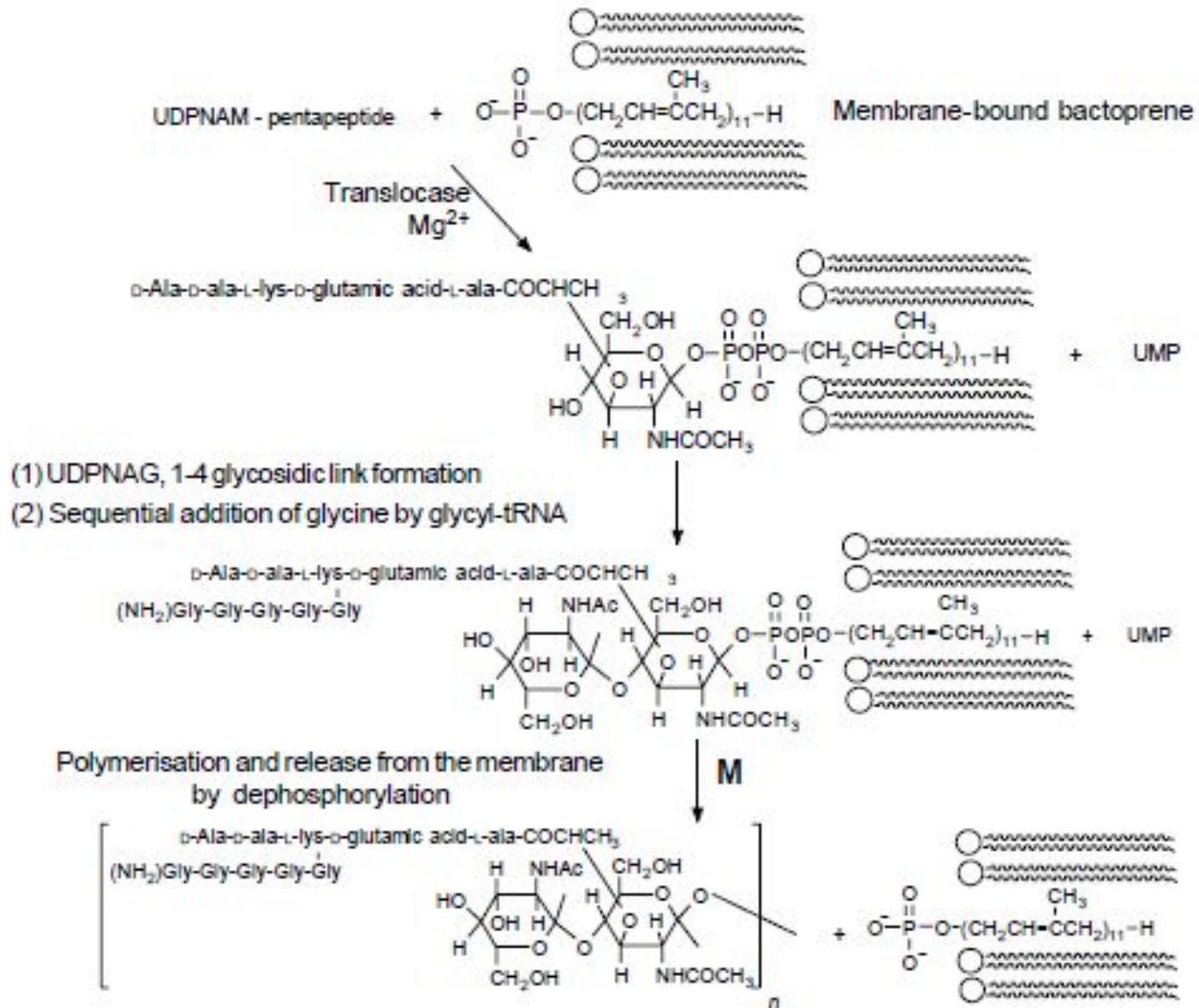


# Ингибирование синтеза прекурсоров исходных материалов клеточной

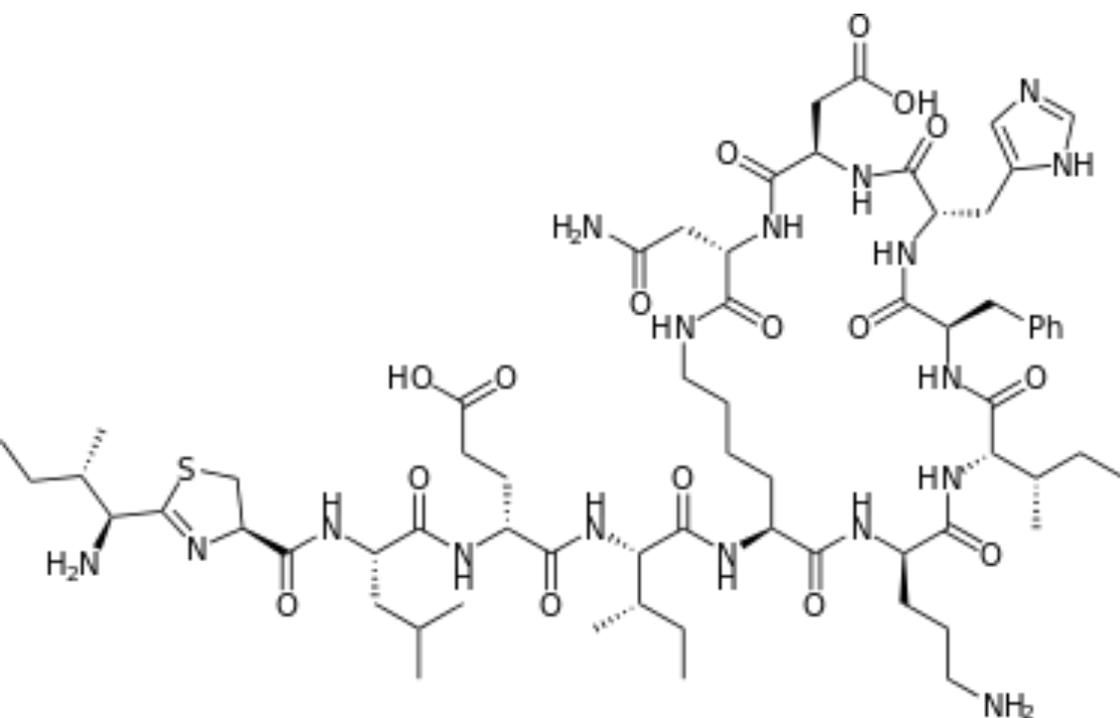
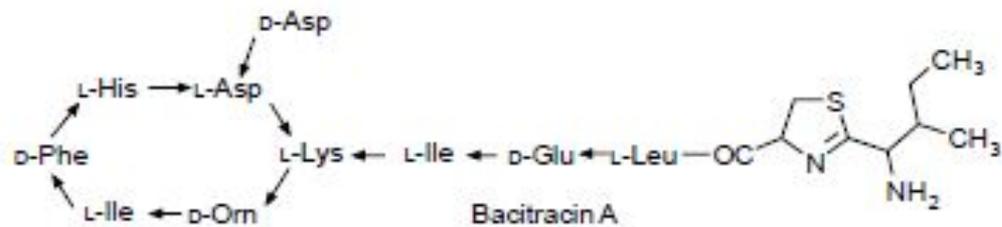
## стенки



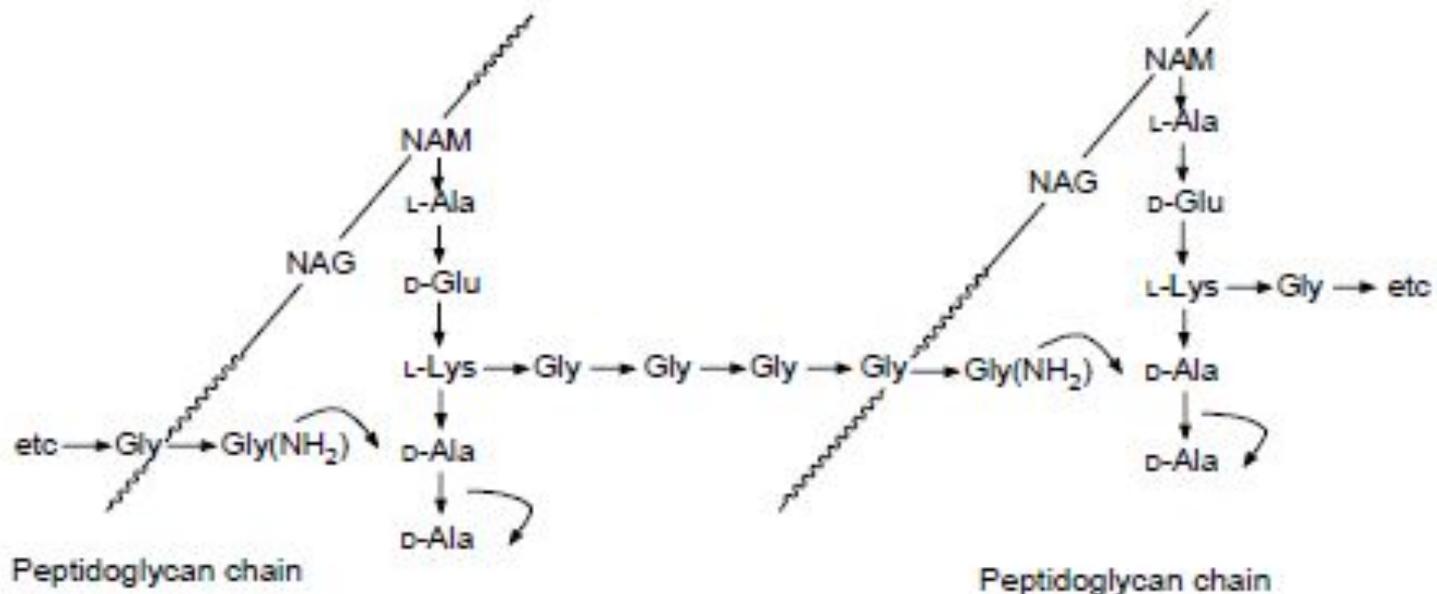
# Ингибирование синтеза клеточной СТЕНКИ



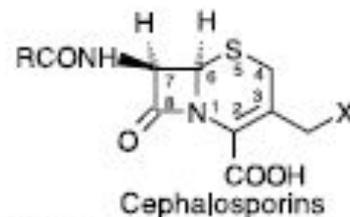
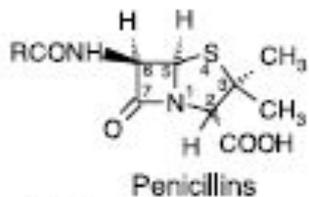
# Бацитрацин



# Ингибиторы «сшивки» стенок



# Ингибиторы «сшивки» стенки



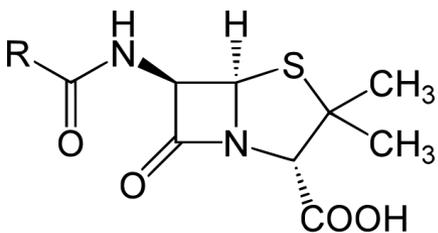
**Penicillin**

**R-**

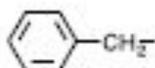
**Cephalosporins**

**R-**

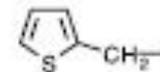
**X-**



Benzylpenicillin  
(Penicillin G)

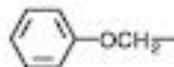


Cephalothin

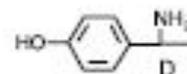


-OCOCH<sub>3</sub>

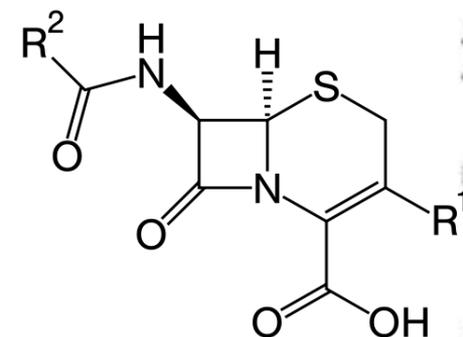
Phenoxymethylpenicillin  
(Penicillin V)



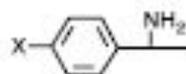
Cefadroxil



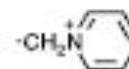
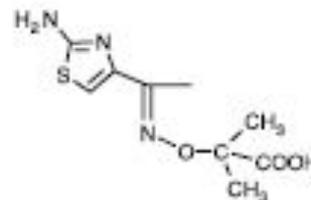
-H



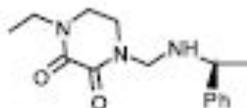
Ampicillin (X = H)  
Amoxicillin (X = OH)



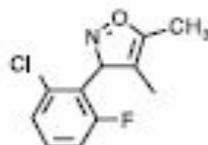
Ceftazidime



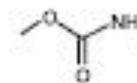
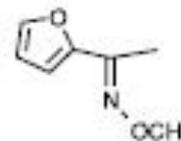
Piperacillin



Flucloxacillin

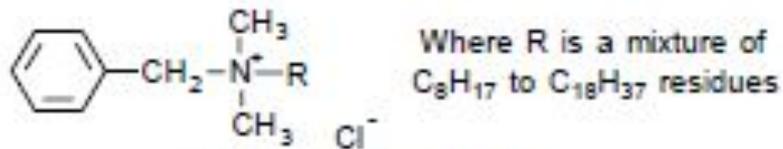


Cefuroxime

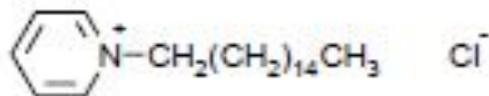


# ПАВЫ

## Cationic surfactants

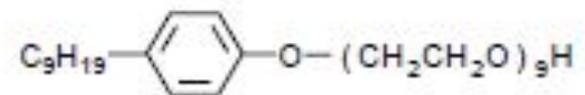


Benzalkonium chloride

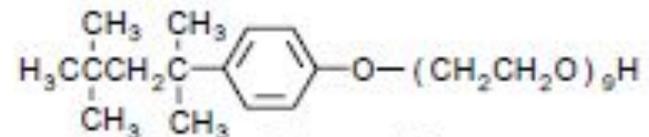


Cetylpyridinium chloride

## Non-ionic surfactants



Nonoxynol-9



Octoxynol-9