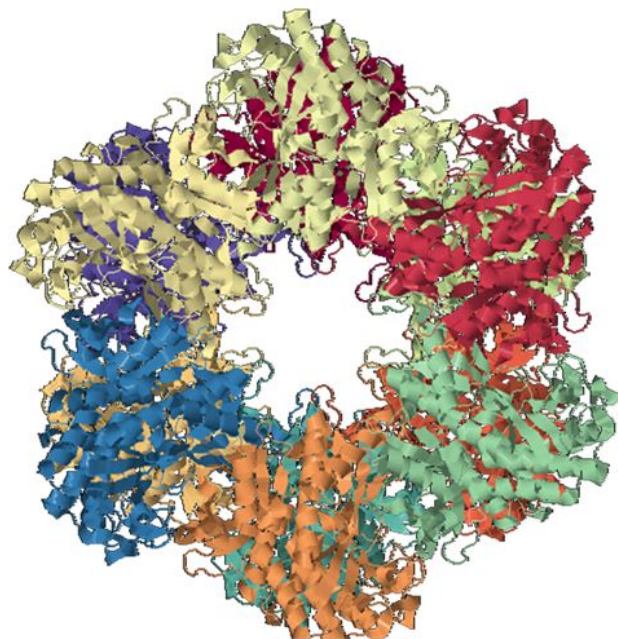


Кружок по медицинской химии

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

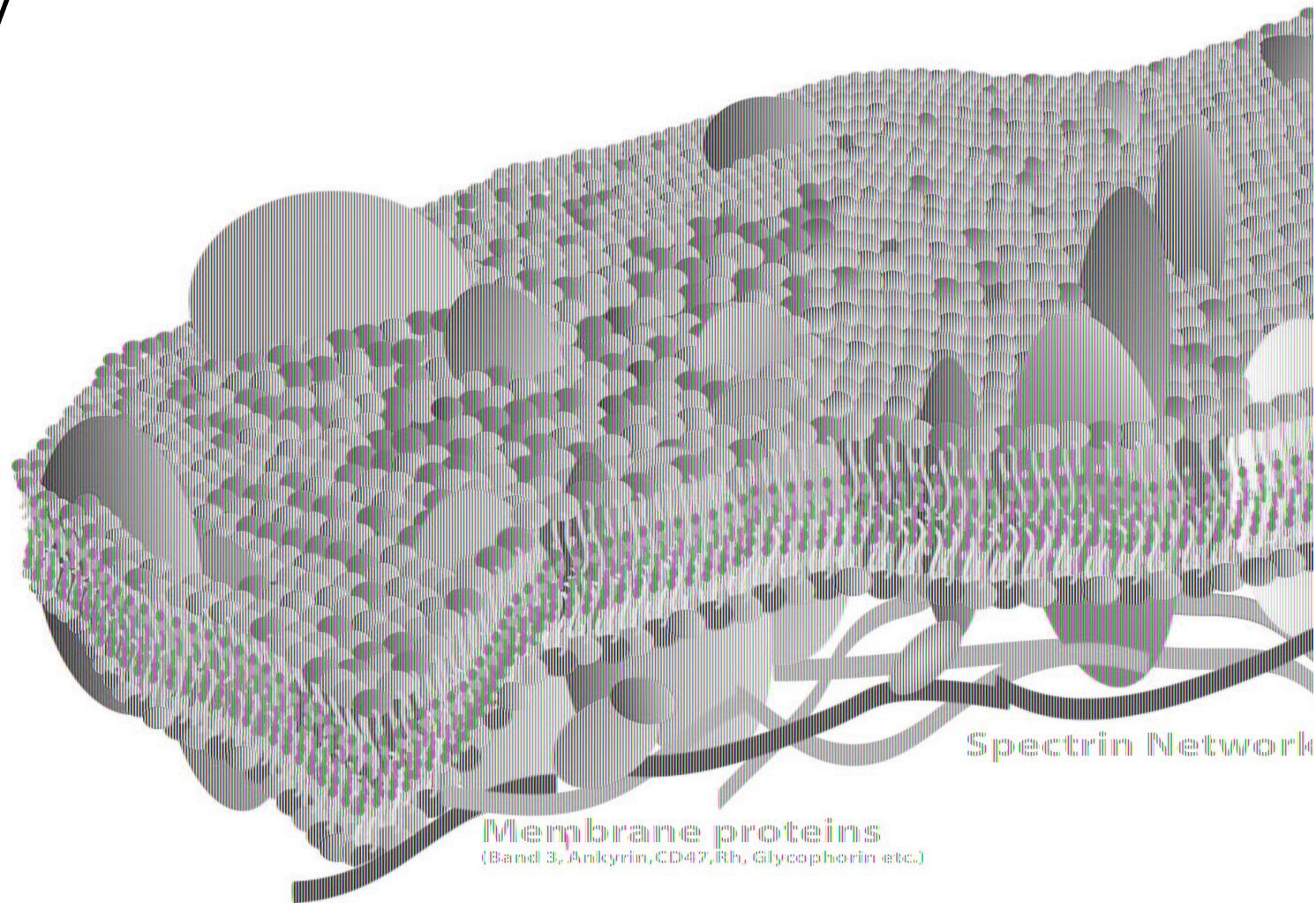
<http://qsar.chem.msu.ru/ru/obrazov/kruzhok>

<http://goo.gl/UCM8s0>

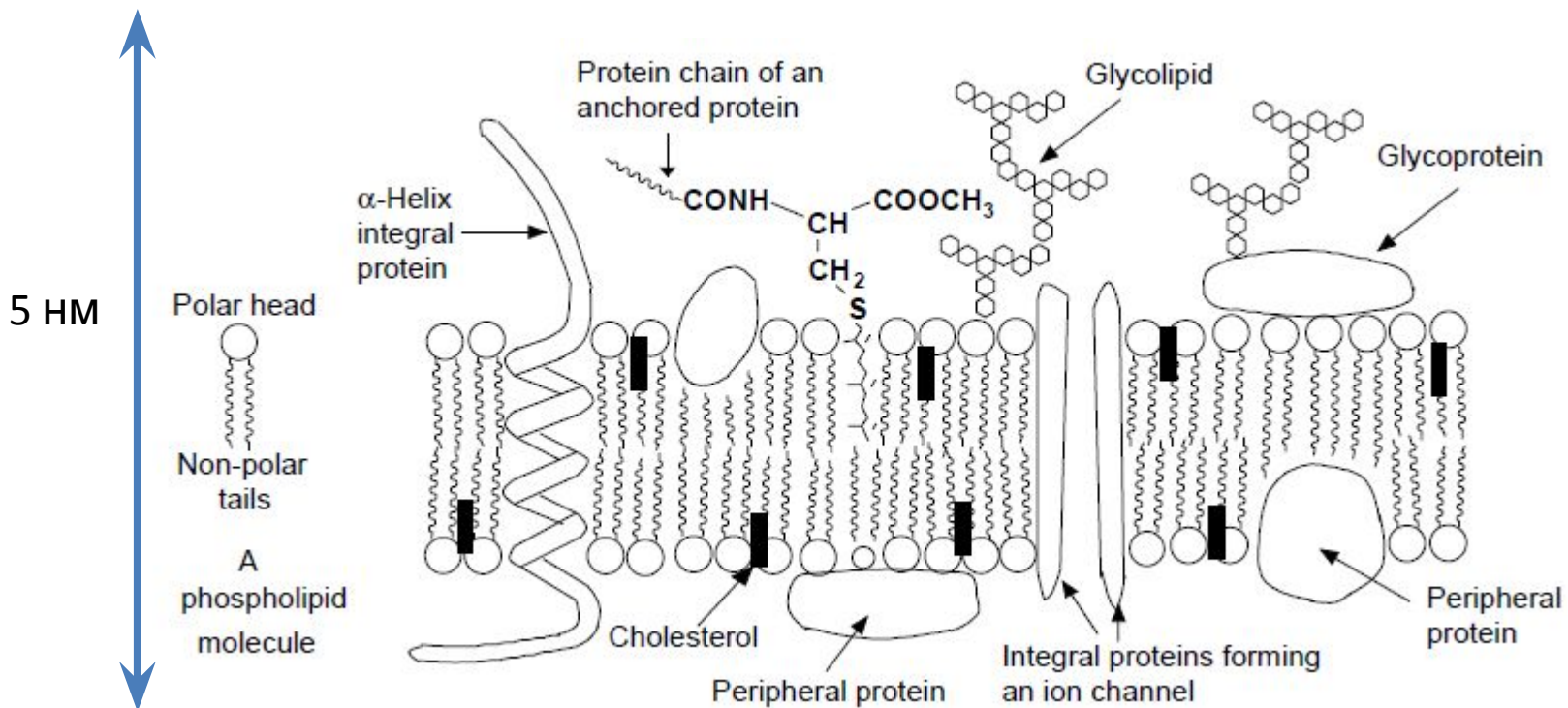


Занятие 5

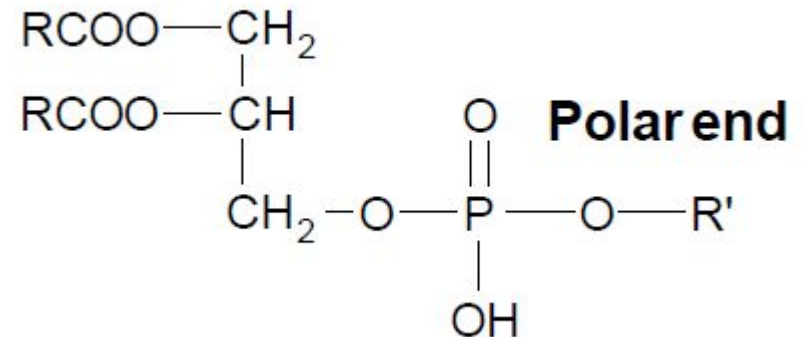
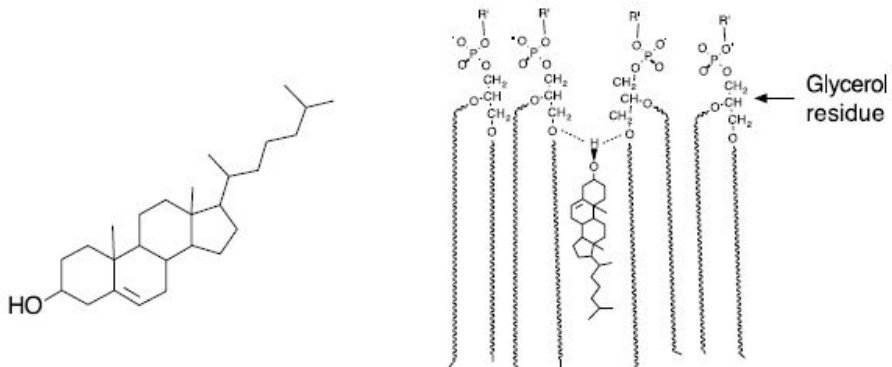
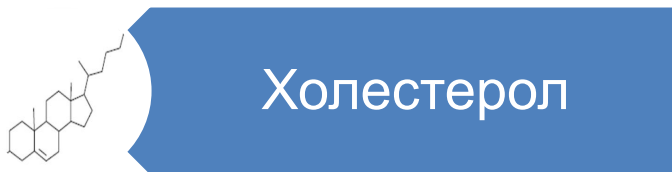
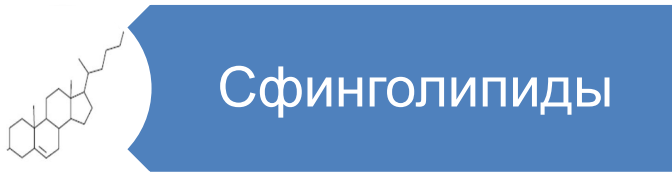
Вещества, действующие на мембрану клетки и клеточную стенку



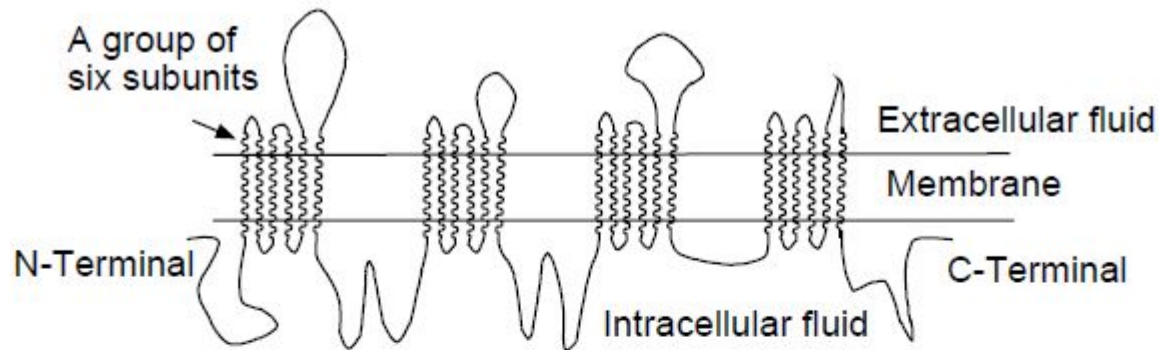
Строение мембраны



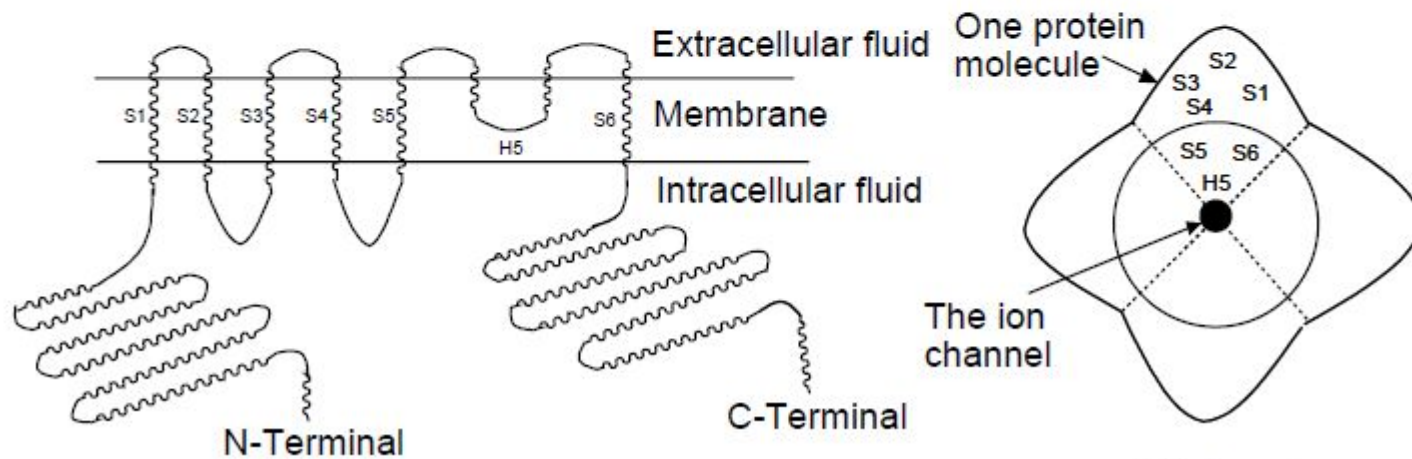
Состав мембраны



Мембрана и белки



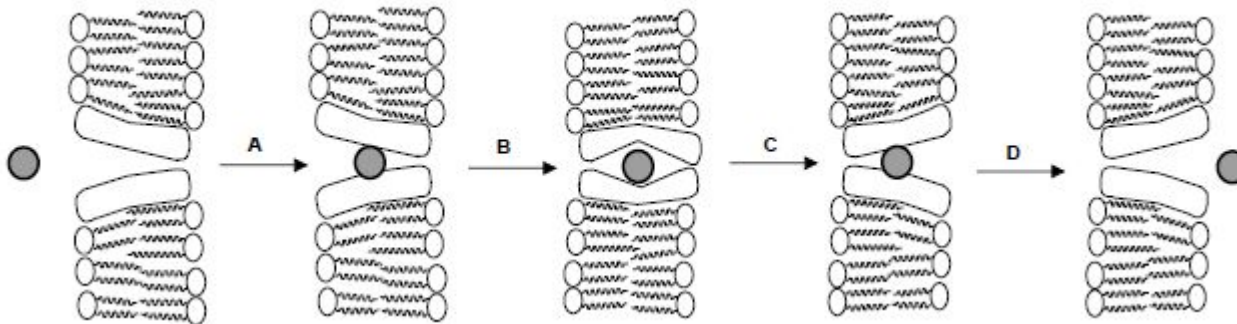
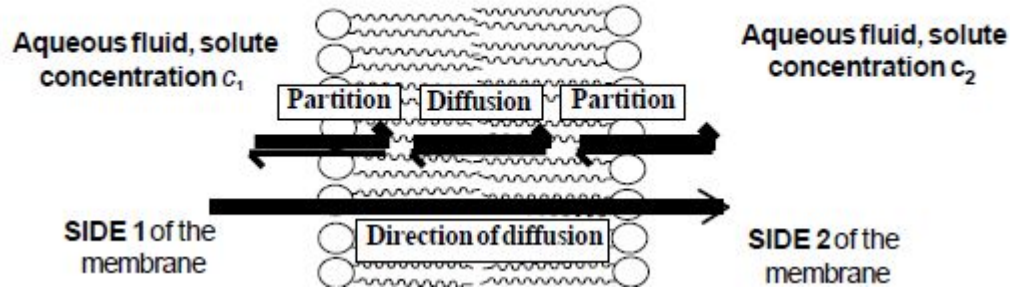
(a) Na⁺ ion channel protein



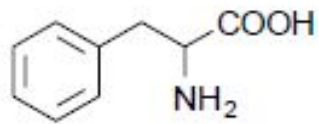
(b) Side view

(c) Top view

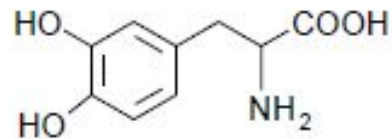
Активный и пассивный транспорт



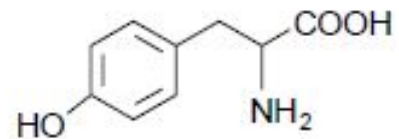
Активный транспорт



Phenylalanine



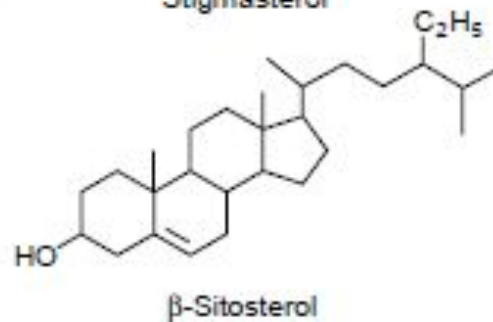
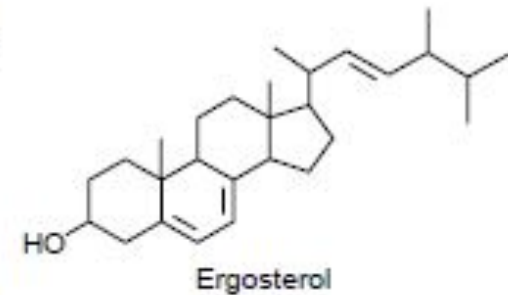
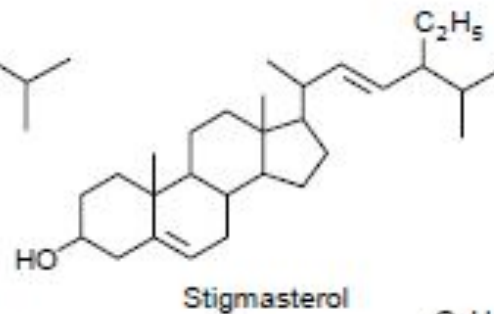
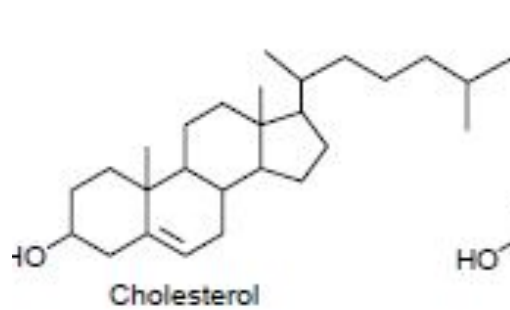
Levodopa



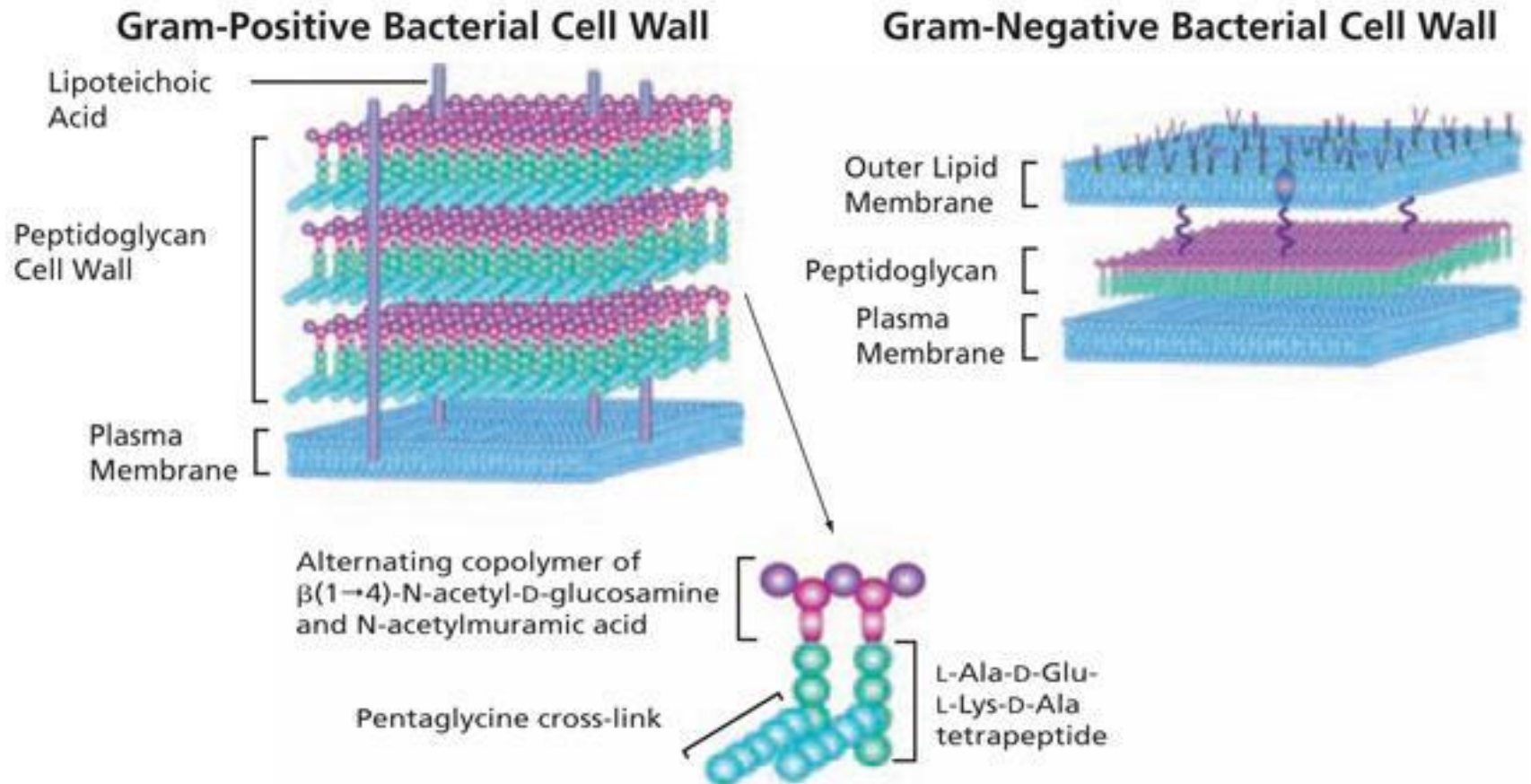
Tyrosine

Различие в мембранах

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

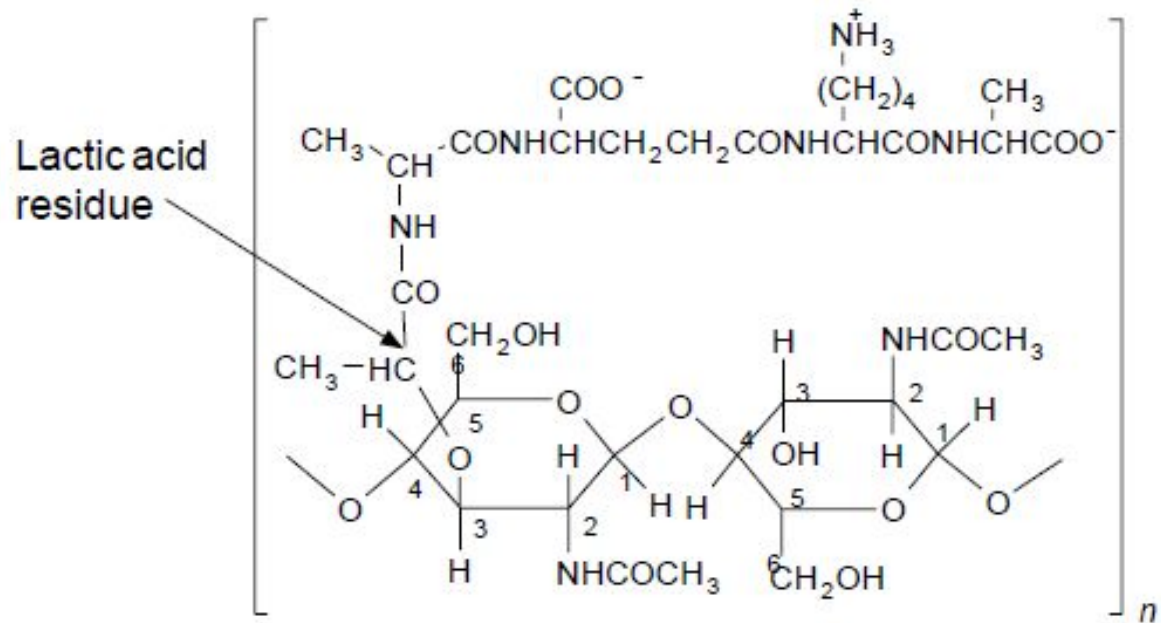


Строение клеточной стенки бактерий



Пептидогликан

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



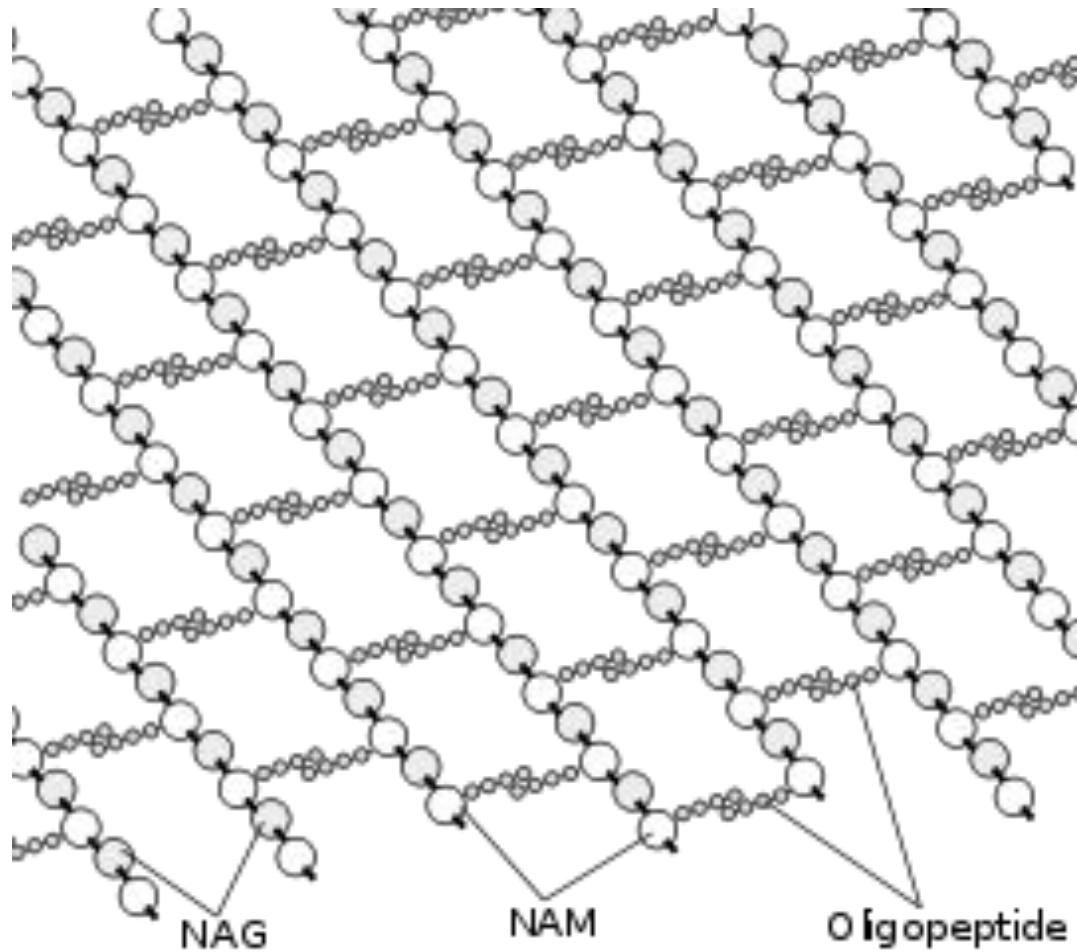
NAM

β -N-acetylmuramic acid

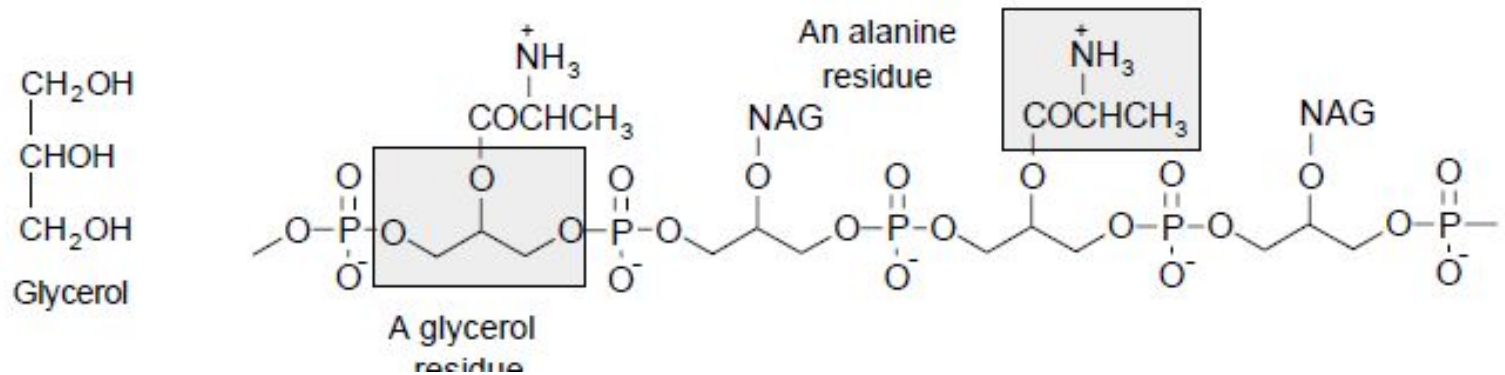
NAG

β -N-acetylglucosamine (NAG)

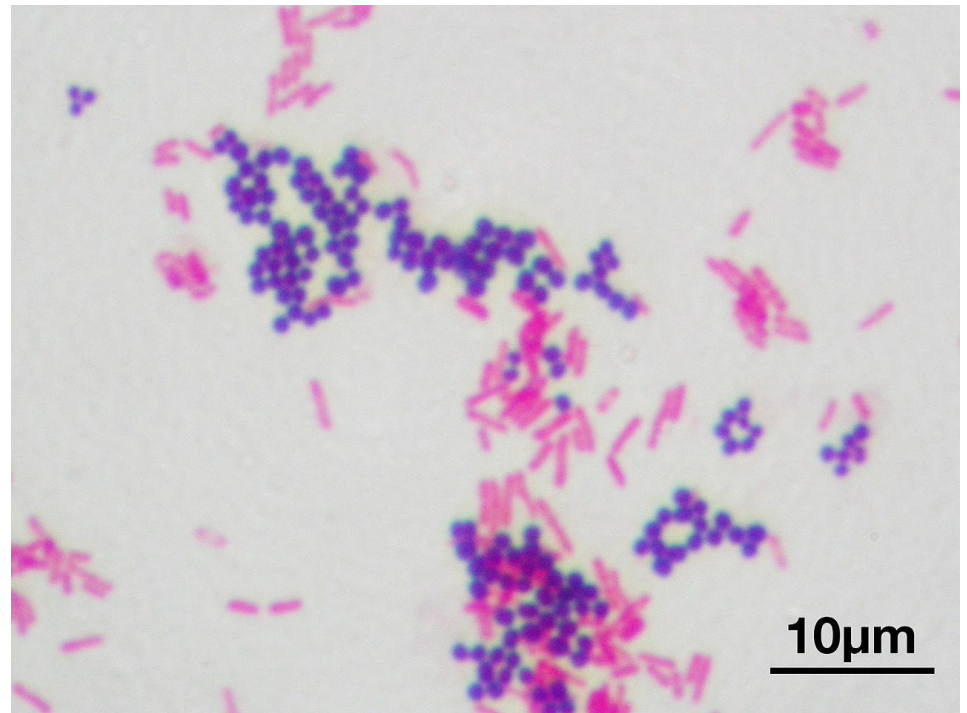
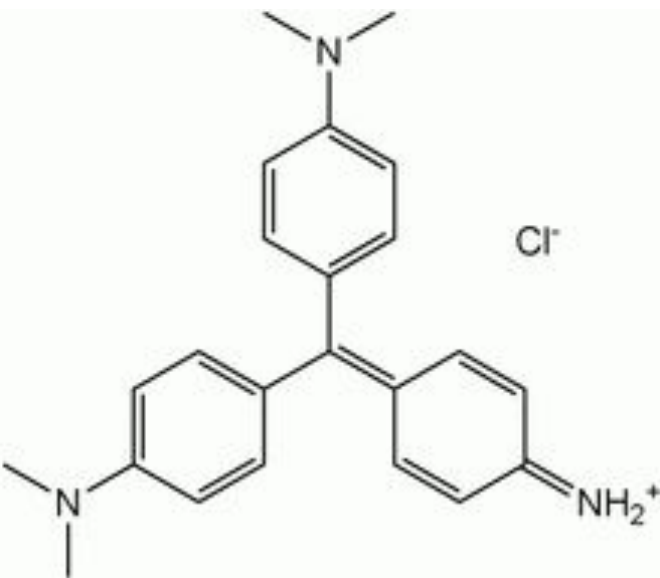
Клеточная стенка



Тейхоевые кислоты



Окрашивание по Граму



Классификация соединений, действующих на клеточные мембраны и стенку

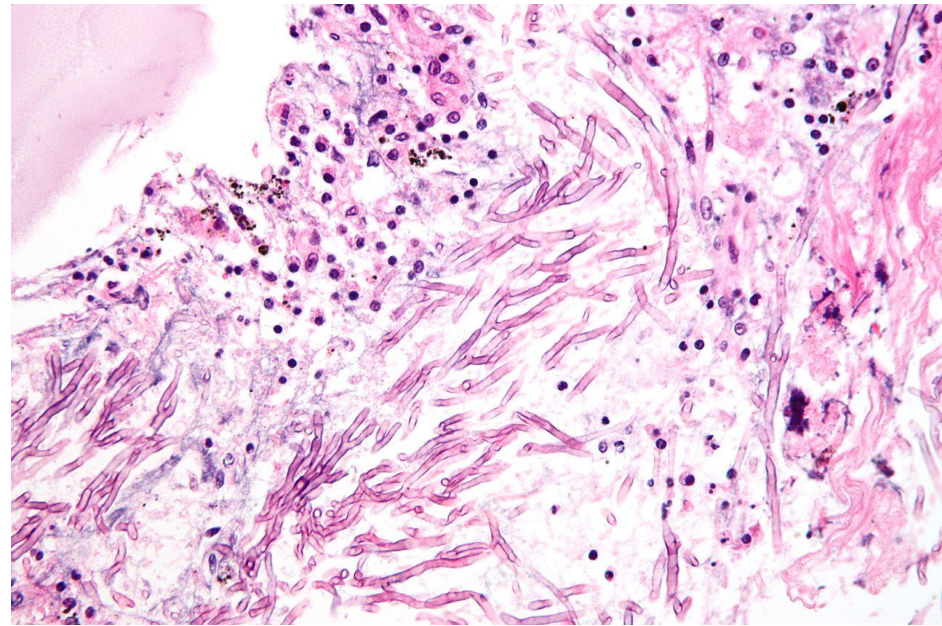
Ингибирование ферментов, отвечающих за синтез соединений необходимых для мембраны или стенки

Ингибирование процессов образования клеточных стенок

Образование каналов переноса веществ

Изменение физико-химических свойств мембраны

Противогрибковые соединения

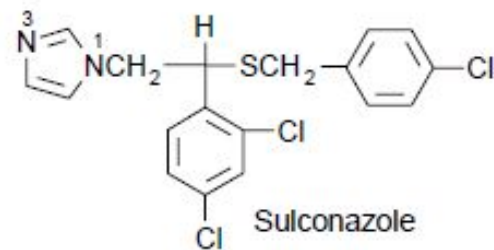
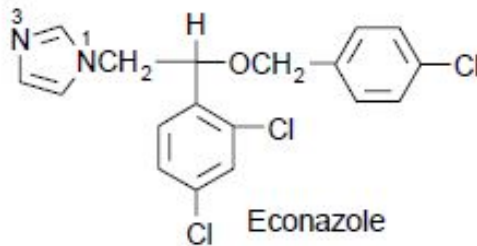
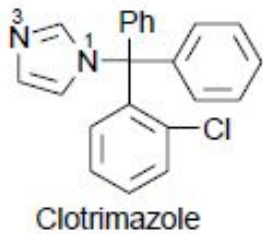
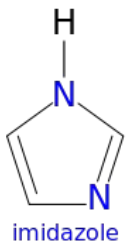


- Азолы
- Аллиламины
- Фенолы
- Другие

Противогрибковые соединения.

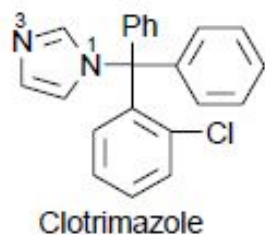
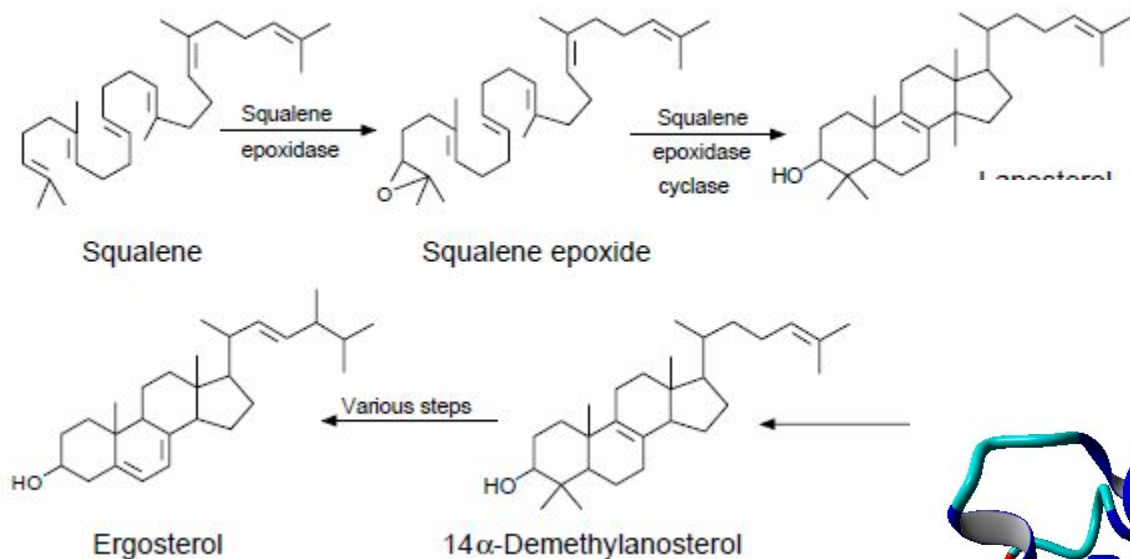
Азолы

—эффективны против большинства грибов, инфицирующих кожу и слизистые оболочки

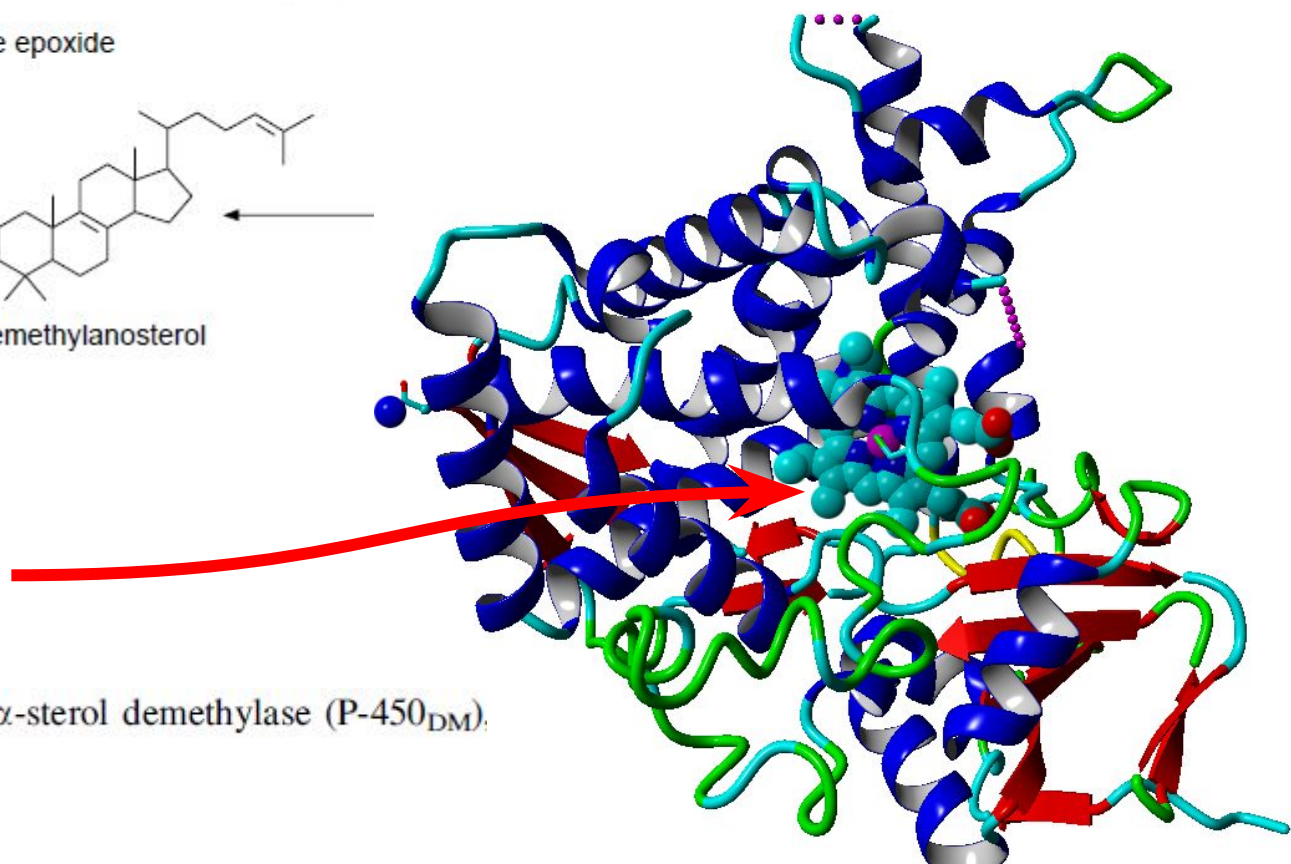


Местно, наносят тонким слоем на пораженные участки кожи и слизистых оболочек 2–4 раза в сутки. Курс лечения подбирают индивидуально, обычно — не менее 4 нед; по его завершении (исчезновение клинических проявлений) целесообразно продолжить применение препарата еще в течение 14 дней.

Азолы. Механизм действия

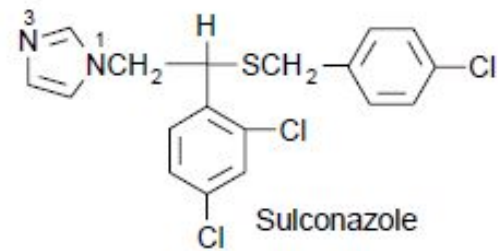
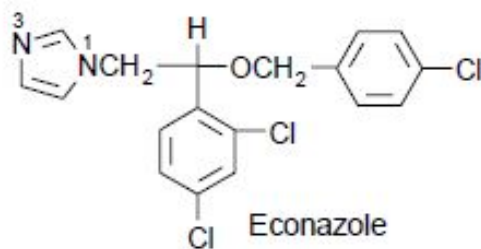
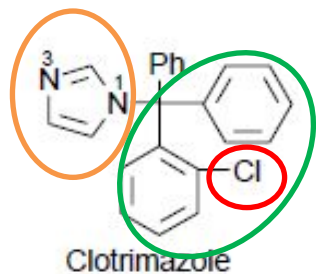


14 α -sterol demethylase (P-450_{DM}).

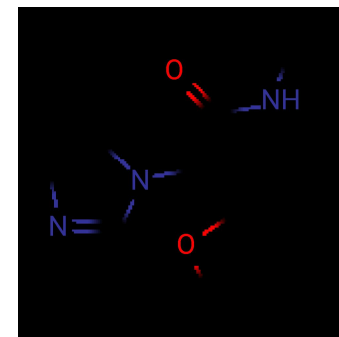
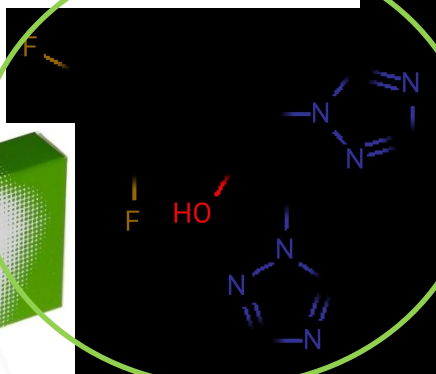
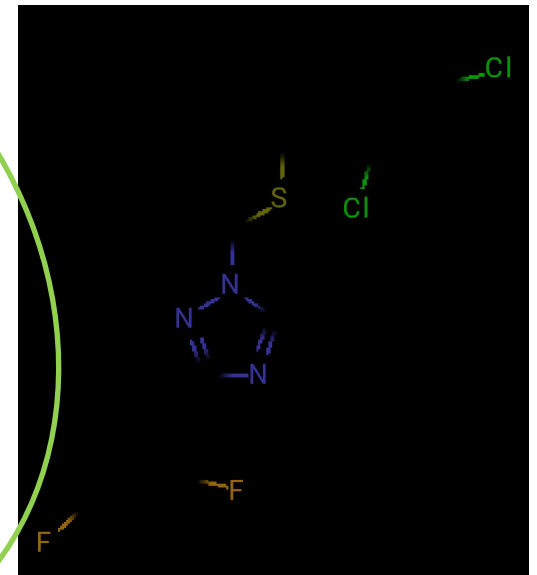
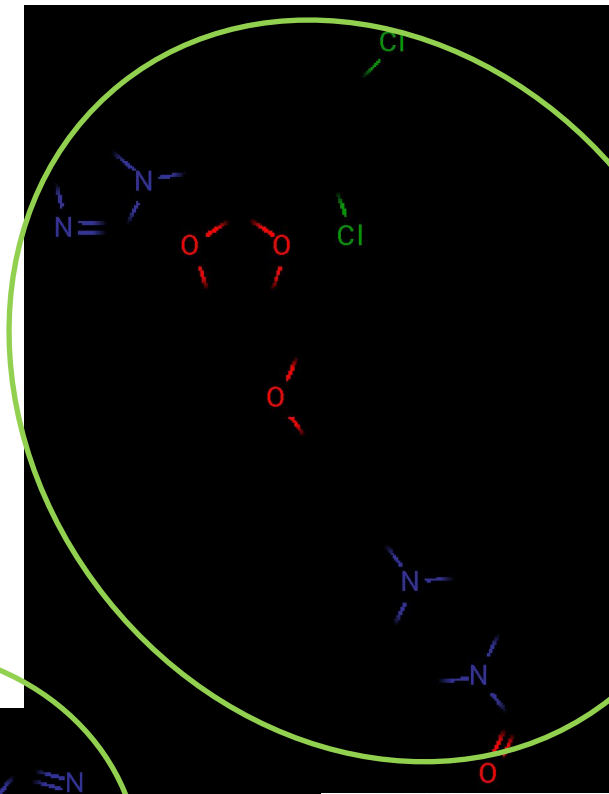
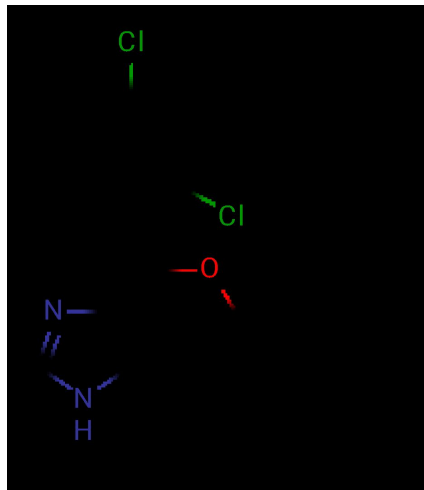


Азолы. SAR

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).

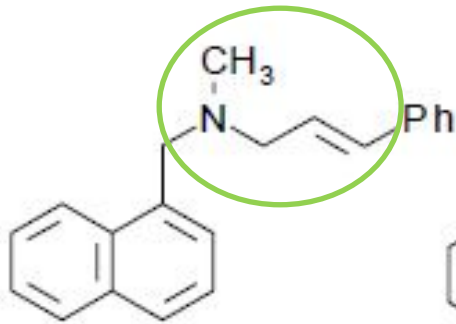


АЗОЛЫ. SAR

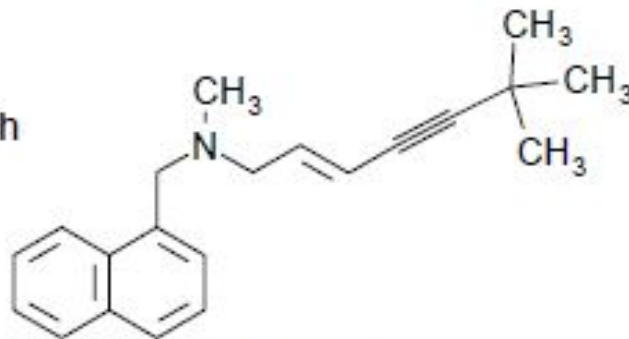


Противогрибковые соединения. Аллиламины

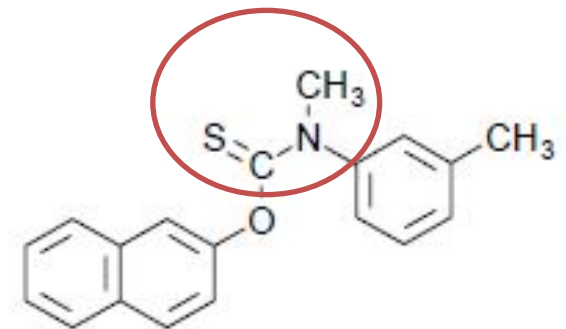
—ингибируют сквален
монооксидазу



Naftifine



Terbinafine



Tolnaftate

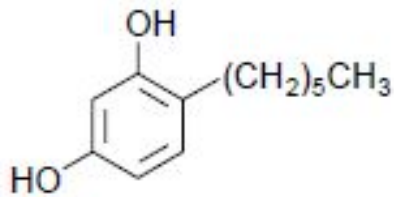


Грибковые поражения кожи,
ногтей и волос, кандидоз кожи
и слизистых оболочек.

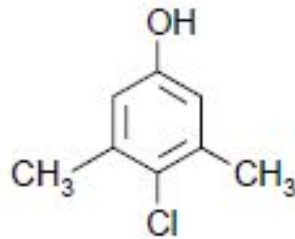
Противогрибковые соединения.

Фенолы

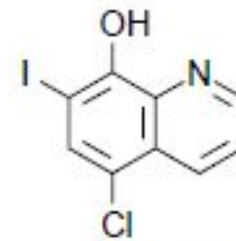
— разрушают отдельные участки мембраны



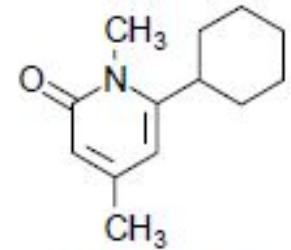
Hexylresorcinol



Chloroxylenol



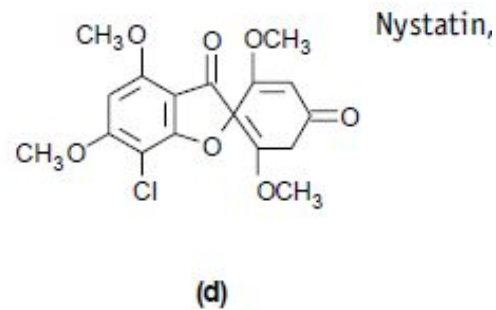
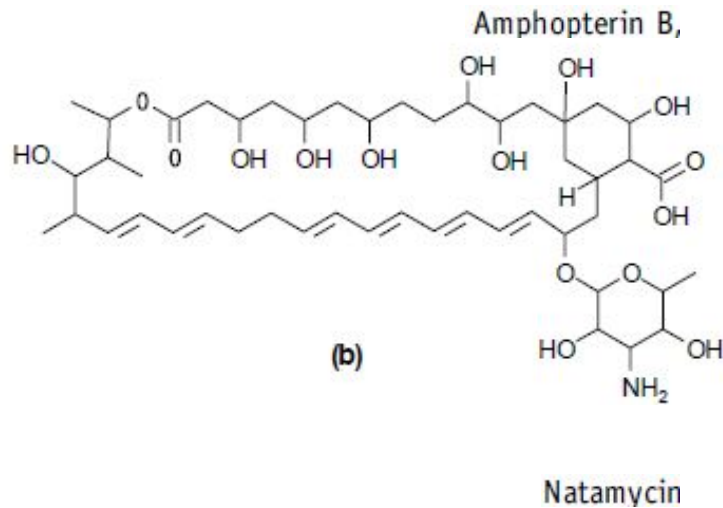
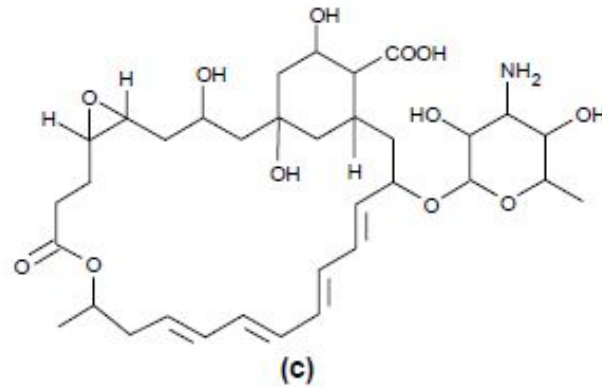
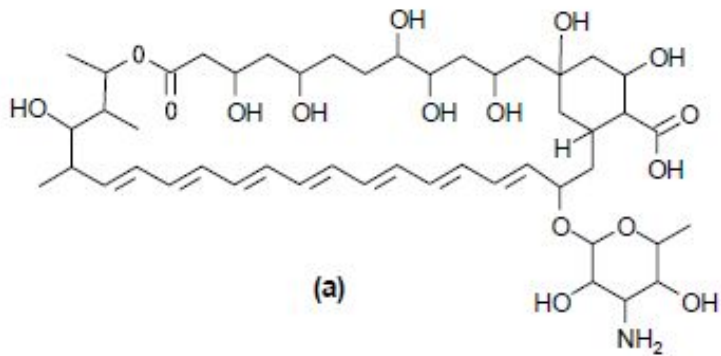
Clioquinol



Ciclopirox



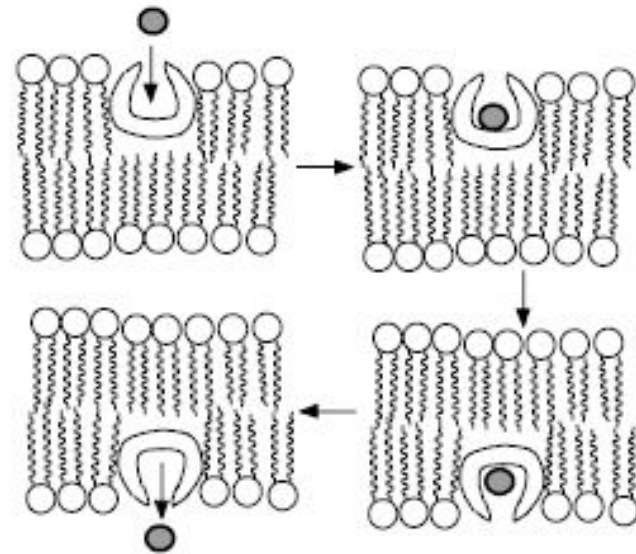
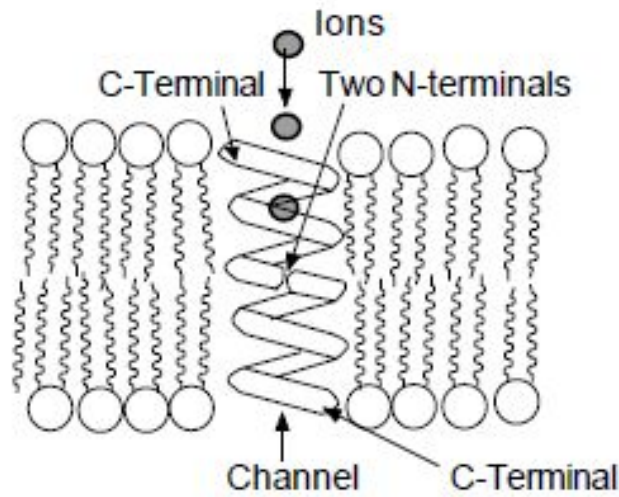
Антибиотики с противогрибковым действием



Griseofulvirin

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

Ионофоры. Механизм действия

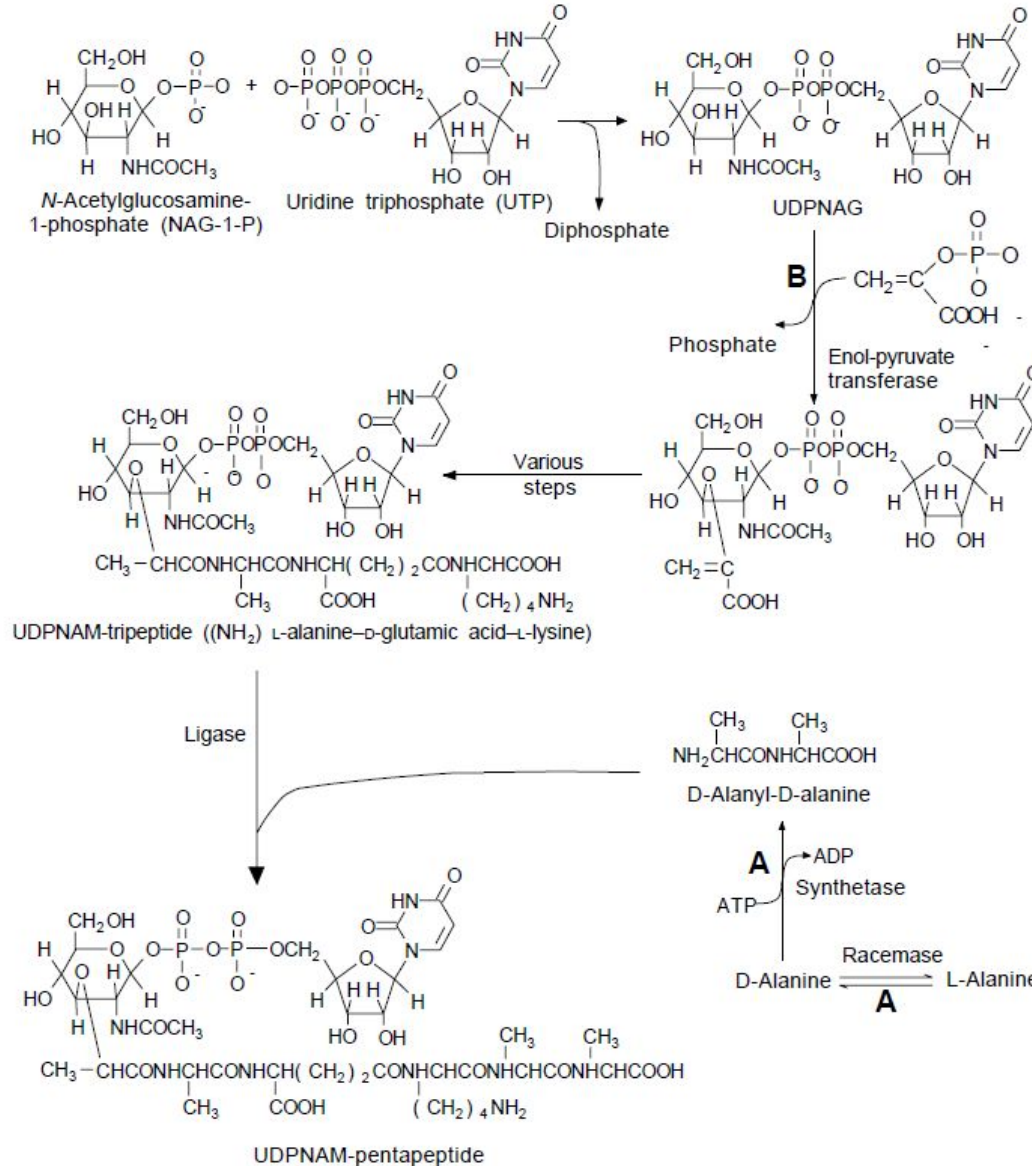


Ингибиторы синтеза клеточной стенки

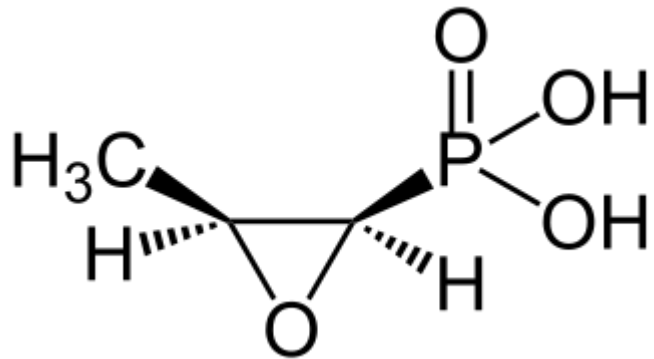
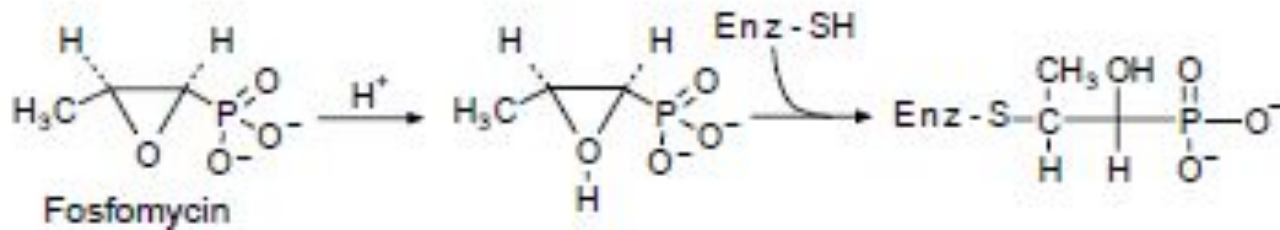
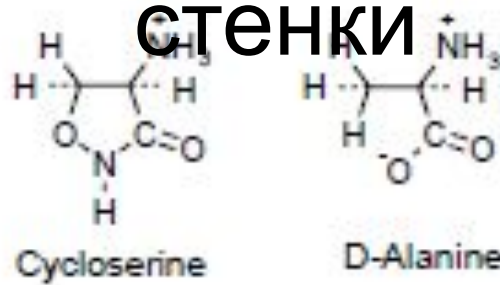
- Ингибиторы синтеза прекурсоров исходных материалов для клеточной стенки
- Ингибиторы образования пептидогликановых цепей
- Ингибиторы сшивания пептидогликановых цепей

ИНГИБИРОВАНИЕ СИНТЕЗА ПРЕКУРСОРОВ ИСХОДНЫХ МАТЕРИАЛОВ КЛЕТОЧНОЙ

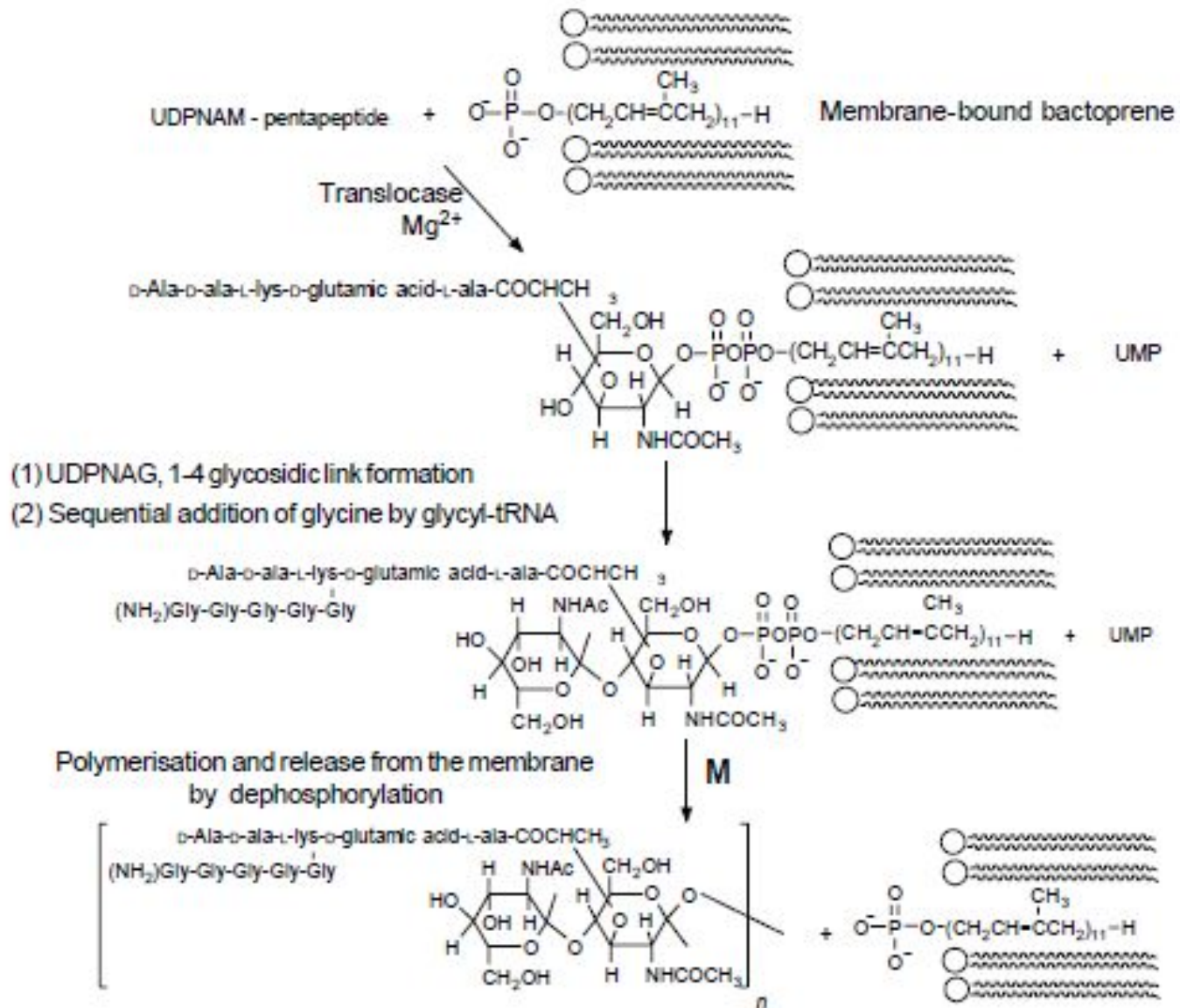
СТЕНКИ



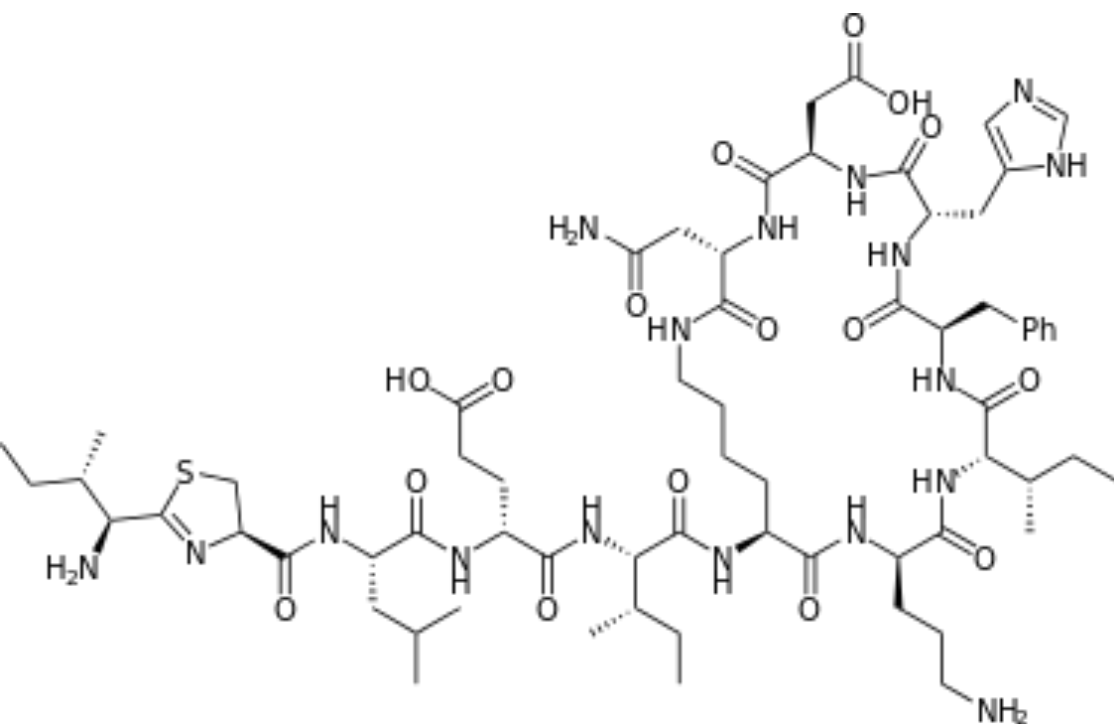
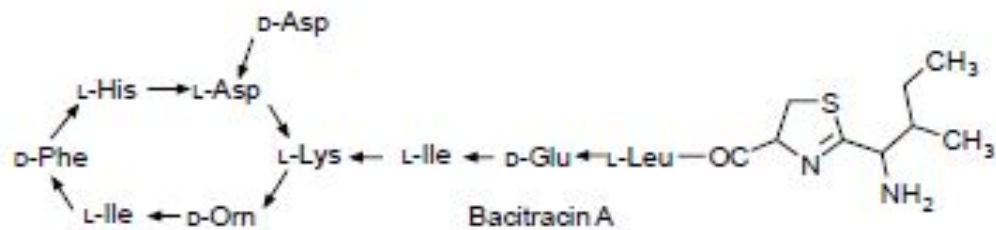
Ингибирование синтеза прекурсоров исходных материалов клеточной стенки



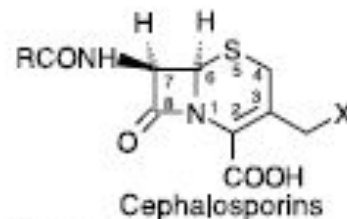
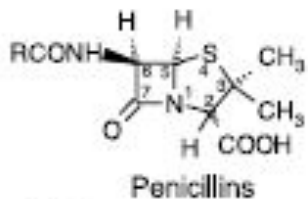
Ингибирование синтеза клеточной СТЕНКИ



Бацитрацин



Ингибиторы «сшивки» стенки



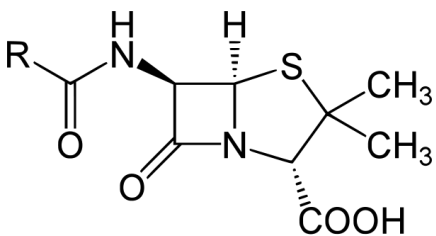
Penicillin

R-

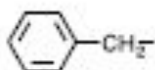
Cephalosporins

R-

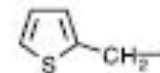
X-



Benzylpenicillin
(Penicillin G)

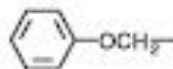


Cephalothin

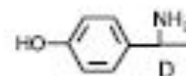


-OCOCH₃

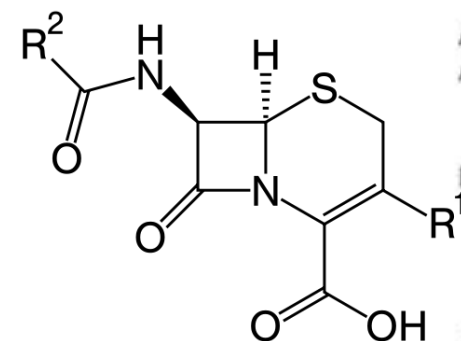
Phenoxymethylpenicillin
(Penicillin V)



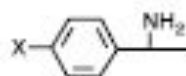
Cefadroxil



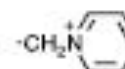
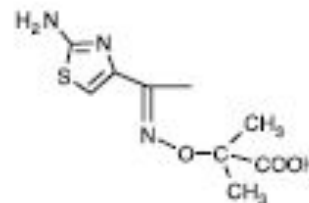
-H



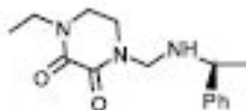
Ampicillin (X = H)
Amoxicillin (X = OH)



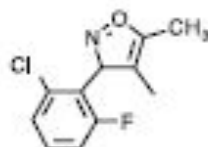
Ceftazidime



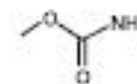
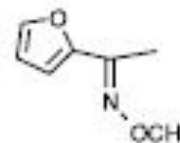
Piperacillin



Flucloxacillin

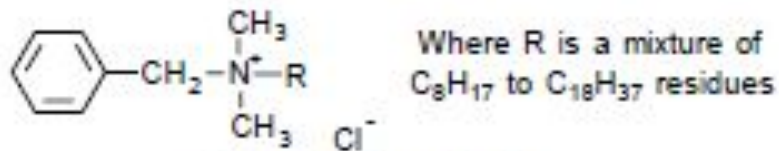


Cefuroxime

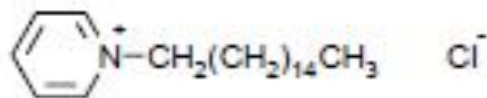


ПАВЫ

Cationic surfactants

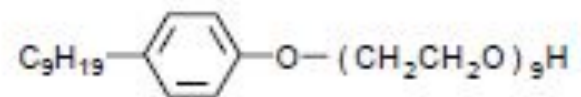


Benzalkonium chloride

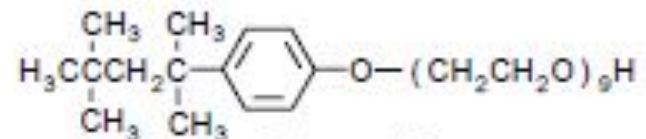


Cetylpyridinium chloride

Non-ionic surfactants



Nonoxynol-9



Octoxynol-9