

## Секция «Биоорганическая химия»

### Ингибиторы ферментов как потенциальные лекарственные субстанции

Поротников Д.А.<sup>1</sup>, Пышняк М.Г.<sup>2</sup>, Лепихина А.В.<sup>3</sup>

1. Кафедра химической термодинамики и кинетики

2. Кафедра лазерной химии и лазерного материаловедения

3. Кафедра органической химии

Почти все лекарства представляют собой ингибиторы ферментов, начиная от аспирина и заканчивая новейшими соединениями, используемыми для лечения ВИЧ-инфекции. Основопологающую роль в создании эффективных лекарственных субстанций играет изучение кинетики ферментативных реакций, поскольку данные исследования позволяют предсказать их потенциальную эффективность в качестве лекарственных препаратов.

Существуют два основных класса ингибиторов ферментов: обратимые и необратимые. Они различаются по величине их сродства к ферменту. Необратимые ингибиторы прочно связываются с ферментом, образуя постоянный комплекс. Обратимые ингибиторы связываются с ферментом слабыми нековалентными связями и при определённых условиях легко отделяются от фермента. Обратимые ингибиторы, в свою очередь, делятся на конкурентные, неконкурентные и бесконкурентные.

К конкурентному ингибированию относят обратимое снижение скорости ферментативной реакции, вызванное ингибитором, связывающимся с активным центром фермента. Такой тип ингибирования наблюдают, когда ингибитор представляет собой структурный аналог субстрата. В результате возникает конкуренция молекул субстрата и ингибитора за место в активном центре фермента.

Неконкурентным называют ингибирование ферментативной реакции, при котором ингибитор взаимодействует с ферментом в участке, отличном от активного центра (аллостерический участок) и не является структурным аналогом субстрата.

При бесконкурентном ингибировании ингибитор связывается только с фермент-субстратным комплексом. Субстрат, связываясь с ферментом, изменяет его конформацию, что делает возможным связывание с ингибитором [1].

На сегодняшний день выделяют следующие основные группы ингибиторов ферментов: ингибиторы протеаз, ацетилхолинэстеразы, моноаминоксидазы, карбоангидразы, ксантиноксидазы и ацетальдегидрогеназы. В ходе доклада будут кратко описаны механизмы действия различных групп ингибиторов, а также их применение в качестве лекарственных субстанций для лечения различных заболеваний.

1. Rengasamy *et al.* Biotechnol Adv., 32 (2014) 1364-81. IF 9.015