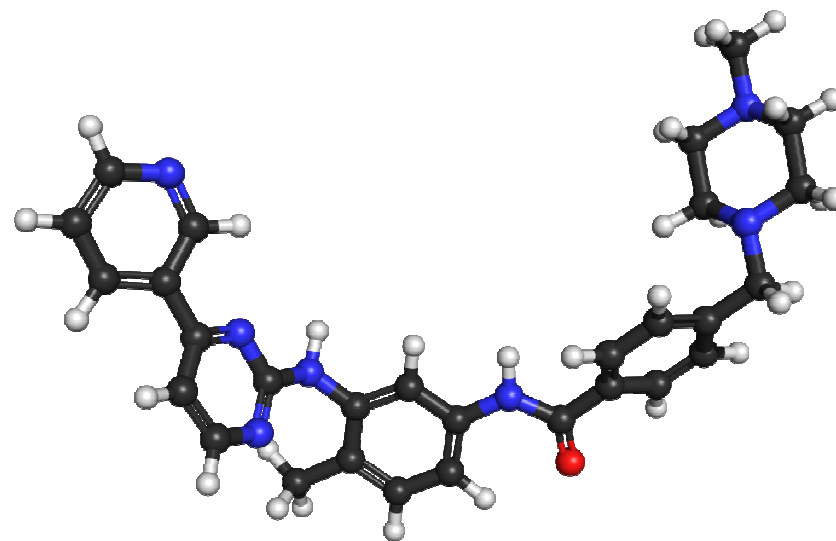


MUNI  
SCI

# Kinázové inhibitory



# Důležité otázky

- Co je to **inhibice** respektive **inhibitor**?
- Jaké má funkce **kináza**? Co pro nás představuje?
- Jak probíhá **proces vývoje inhibitorů**?

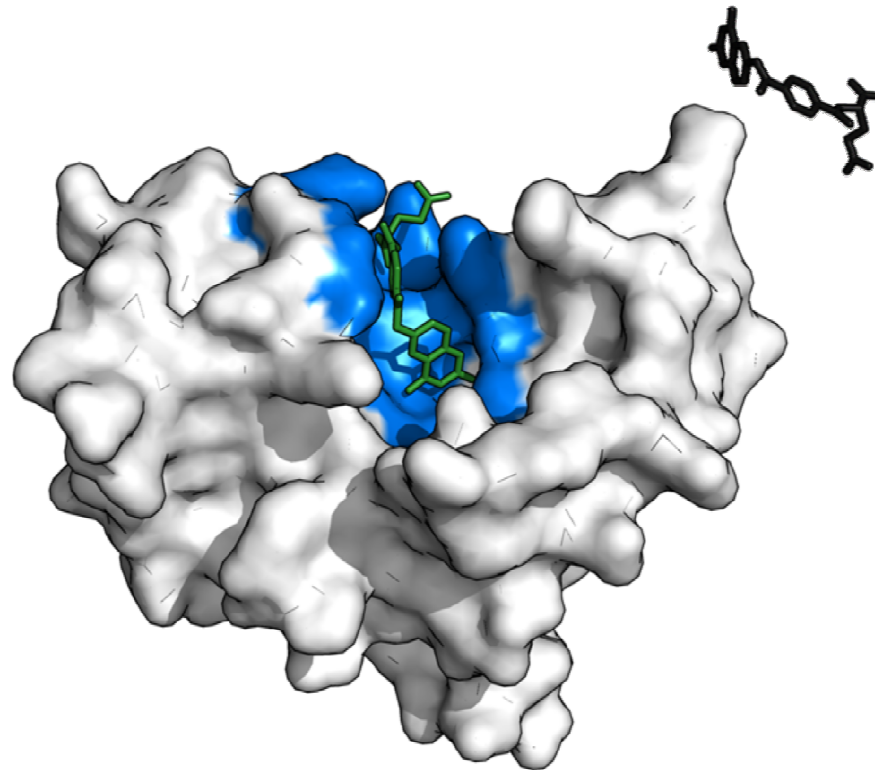
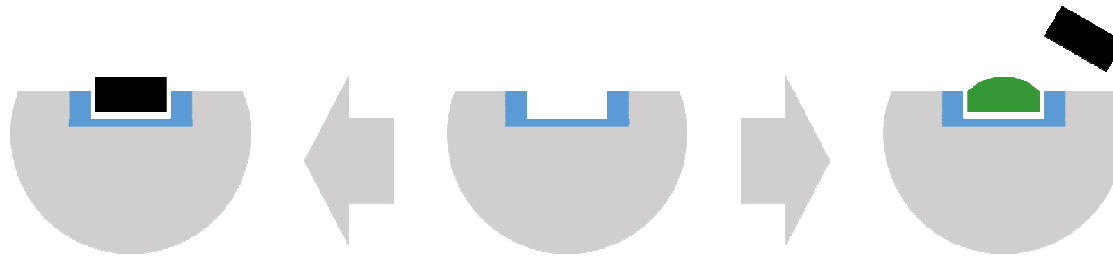
# Enzym a jeho funkce/struktura

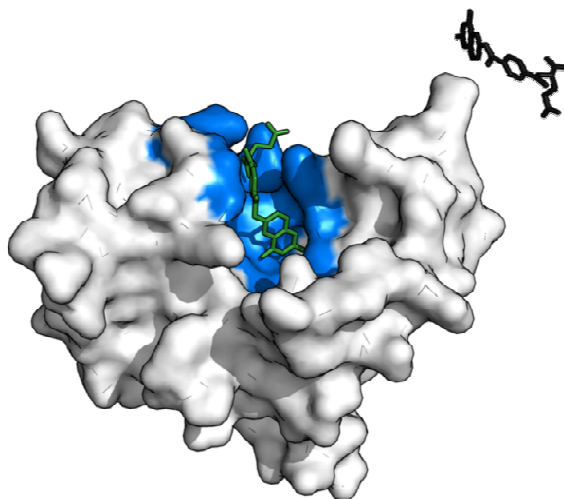
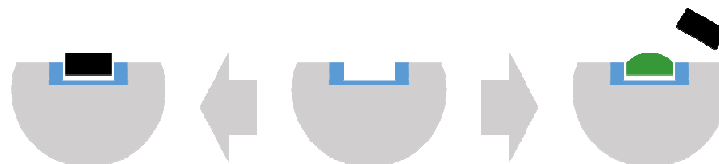
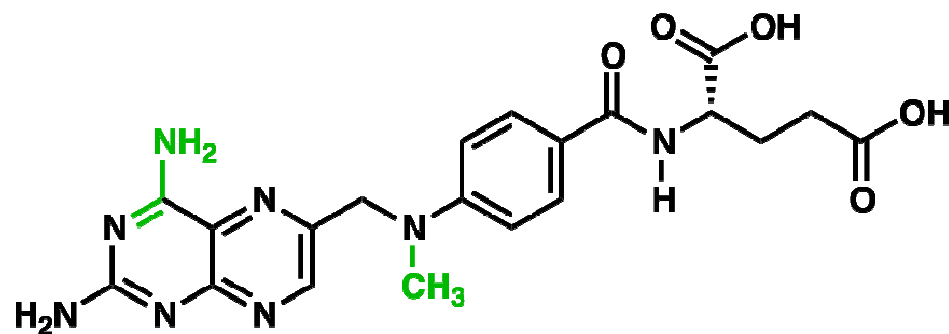
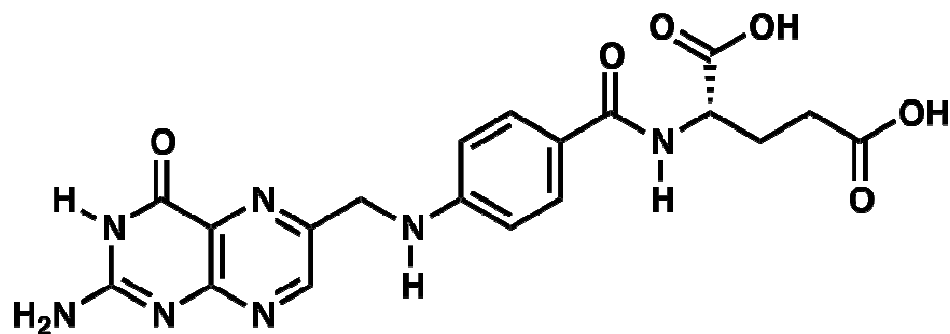
- Protein fungující jako „biologický katalyzátor“
- Pro nás důležité vědět:
  - Navázání substrátu je podmínka pro vykonání funkce enzymu.
  - V naprosté většině případů jsou velmi selektivní.
  - Substrát se váže vždy do jednoho místa.
  - V jistých případech potřeba kofaktoru.
- *Existuje nějaké připodobnění z každodenního života?*



# Inhibice

- Proces zpomalení nebo omezení funkce.
- Dva hlavní typy inhibice:
  - Vratná a nevratná
- *Jak to tedy funguje? Příklady?*





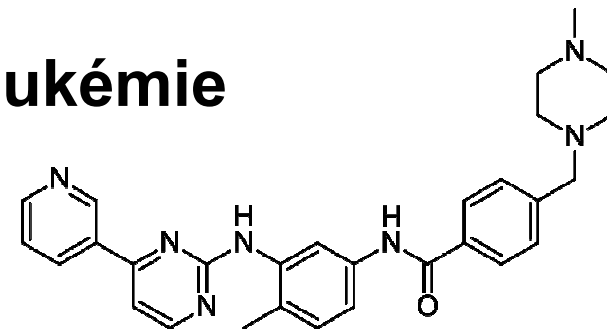
MUNI  
SCI

⟨#⟩ Zápatí prezentace

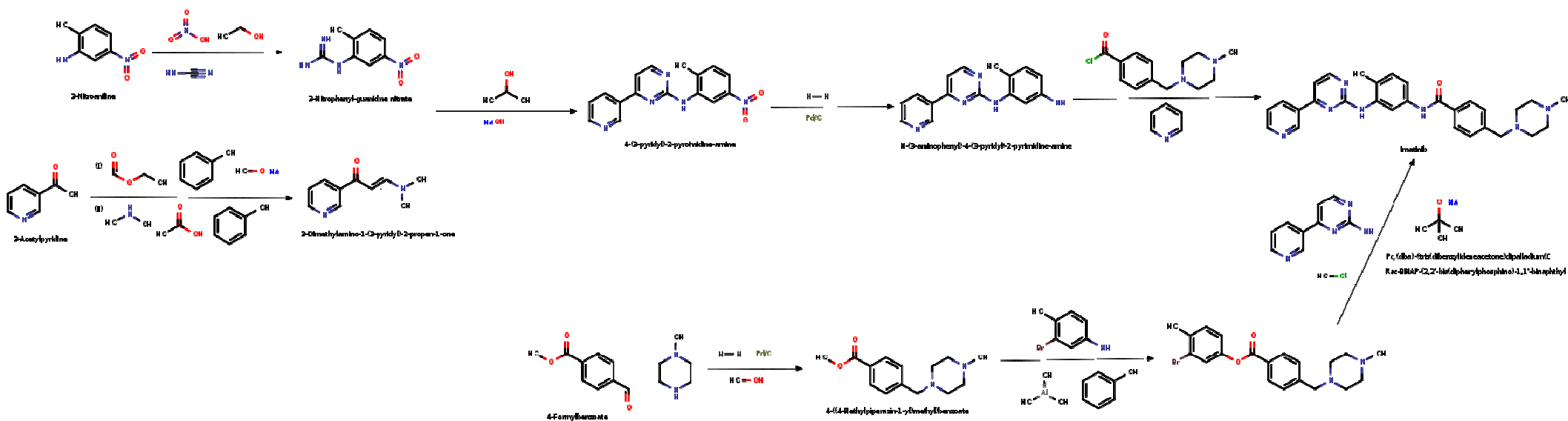


# Imatinib (Gleevec/Glivec), 2001

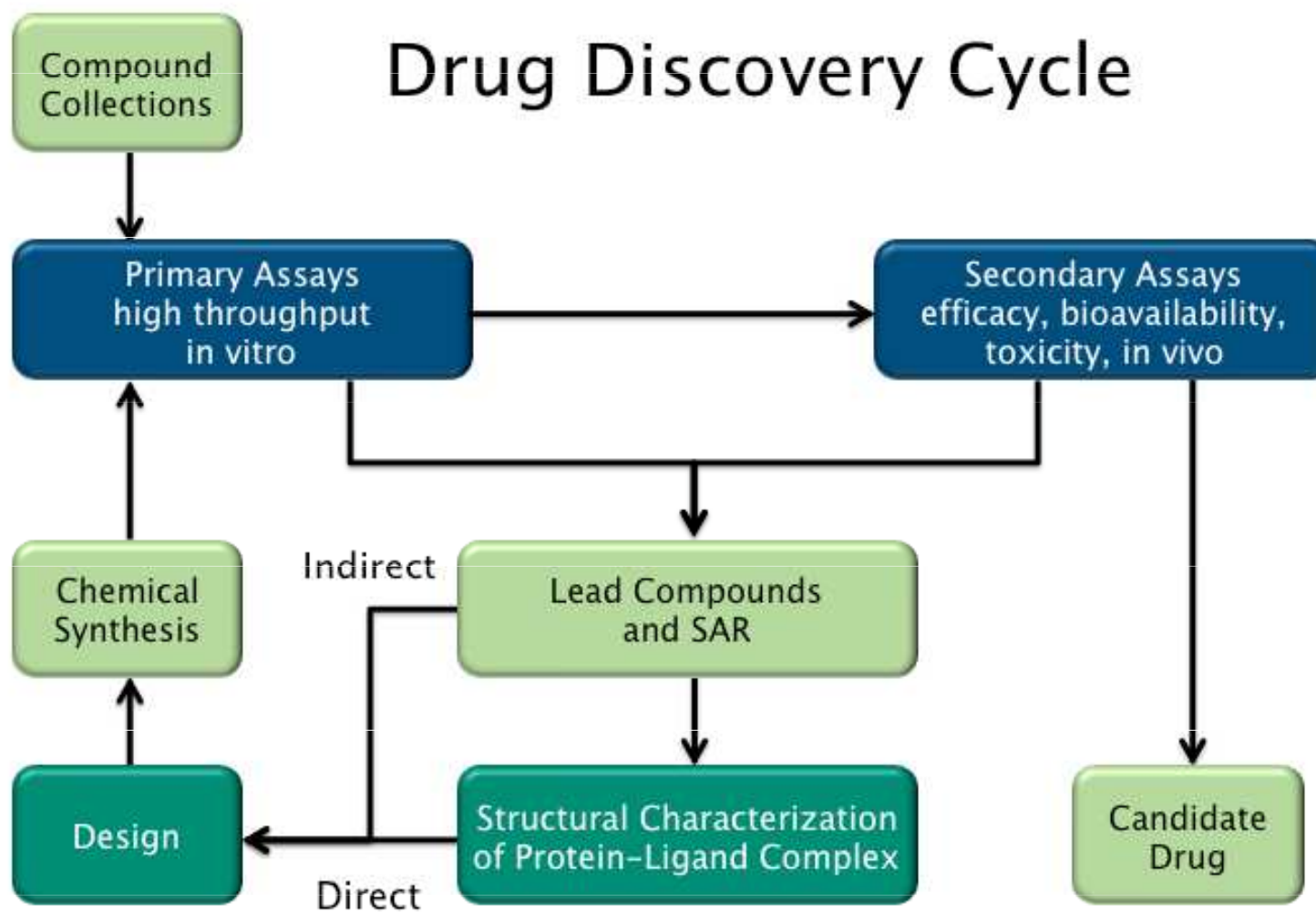
- Vzácný typ rakoviny **akutní lymfoblastická leukémie**
  - Vysoká úmrtnost, smrt do 3-5 let od diagnózy.
- *A lék je na světě! Až na to, že vůbec.*
- **Bi0001 Příběh vědy: rakovina**
  - Prof. RNDr. Jan Šmarda, CSc.



# Syntéza Imatinibu



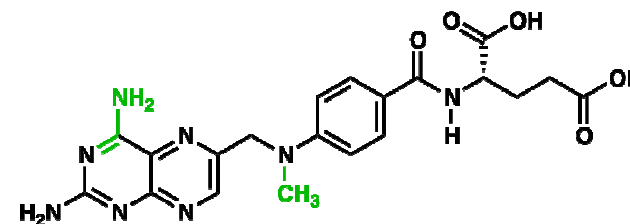
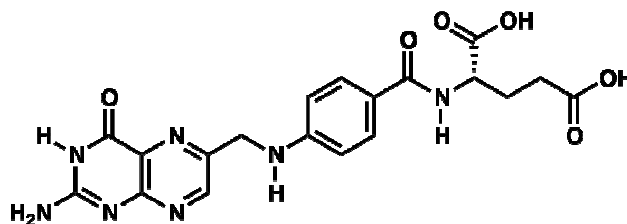
# Drug Discovery Cycle



# Jak takový inhibitor vznikne?

- V dnešní době převážně hledání na základě znalostí.
- Klasická farmakologie metodou „pokus-omyl“.

– porovnání struktury



- pokrytí velkého množství velkých derivátů
- využíváné *in silico* výpočty

# Důležité otázky

- Co je to **inhibice** respektive **inhibitor**?
- Jaké má funkce **kináza**? Co pro nás představuje?
- Jak probíhá **proces objevu inhibitorů**?

**MUNI**  
**SCI**

**Děkuji za pozornost**