

Allostérie récap : définitions et effecteurs

Définition : enzymes qui permettent la transformation des molécules biologiques via des variations de conformations en réponse à la fixation d'un substrat ou d'un effecteur.

Donc on a un substrat qui se transforme en produit via l'intermédiaire de plusieurs réactions et donc de plusieurs enzymes.

→ Si le produit final est en trop → on inhibe l'enzyme

→ Si le produit final est en manque → on active l'enzyme

Les enzymes allostériques fonctionnent grâce à :

- Un site actif qui est responsable de la transformation du substrat en produit
- Un site régulateur qui permet l'interaction réversible avec un métabolite régulateur appelé effecteur

→ Cet effecteur ne participera pas à la catalyse mais conduira à des changements de conformations au niveau d'une partie de l'enzyme qui affectera la conformation globale du site actif → à ce moment là on aura une augmentation ou une diminution de l'activité enzymatique en fonction de si on veut l'activer ou l'inhiber.

L'allostérie s'explique par la mise en place d'effet coopératifs → ce n'est valable que si enzyme sous forme oligomérique = protéine constituée de plusieurs sous unités et possédant une structure quaternaire = sous unités ou protomères identiques entres elles possédant un axe de symétrie.

Enzyme allostérique sous forme tendu = inactive

Enzyme allostérique sous forme relâchée = active

Les effecteurs allostériques = ligands donc le site de fixation est différent du SA :

	Allostériques homotrope → toujours positif (coopératif)	Allostérique hétérotrope positif (coopératif)	Allostérique hétérotrope négatif = anti-coopératif
Nature	Identique à celle du substrat	Différente de celle du substrat	Différente de celle du substrat
Propriétés	La molécule de substrat joue donc le rôle homotrope positif → fixation sur un protomères → Passage de l'enzyme de la forme T à la forme R = passage de la forme inactive à la forme active de l'enzyme	L'effecteur augmente le complexe de l'enzyme sous forme relâchée donc sous forme ouverte → transition allostérique de la forme T à la forme R	L'effecteur diminue le complexe de l'enzyme sous forme relâchée donc inactivation de l'enzyme → transition allostérique de la forme R à la forme T
Évolution Vm en fonction du substrat (courbe)	- Augmentation rapide puis plateau lorsque forme R atteinte - Courbe SIGMOÏDE car coopération des protomères		Ici courbe aussi sigmoïde mais vitesse de réaction vers la forme R très diminuée → c'est l'effet anti coopératif, l'inhibiteur ralenti la vitesse de départ

Récap :

- Allostérique **homotrope ou allostérique hétérotrope positif** → T vers R → coopératif
- Allostérique **hétérotrope négatif** → R vers T → non coopératif
- Les modulateurs allostériques vont agir sur la vitesse de réaction en l'activant ou en l'inhibant parce qu'ils vont changer l'équilibre de la transition allostérique entre l'état tendu et l'état relâché des différents protomères qui composent l'enzyme.

Comparaison avec les enzymes

Michaeliennes :

- Courbe allostérique = sigmoïde et Michaelienne = parabole
- La cinétique allostérique est plus lente pour des petites concentrations de substrat et donc plus rapide pour des grosses concentrations

