



TANTÁRGYI ADATLAP

Tárgy neve:		Kódja:	
Gyógyszerkémia és szintézistervezés		VEMKOT4244A	
Chemistry of medicines and the design of organic syntheses			
Tárgyfelel s oktató:		Tárgyfelel s tanszék:	
Törös Szilárd Dr.		Szerves Kémia	
Elmélet (óra):	Gyakorlat (óra):	Kredit:	Számonkérés:
2 (/hét)	2 (/hét)	4	Vizsga

A tárgy oktatója:			
név	kurzus típusa	kurzus kódja	nyelv
Törös Szilárd Dr.	Elmélet	01	magyar
Törös Szilárd Dr.	Gyakorlat	02	magyar

Tantárgy képzési célja:

A gyógyszerkutató és fejlesztés megismertetése. Az egyes gyógyszer típusok illetve molekulák szintézisének tárgyalása. A szerveskémiai szintézisút-kidolgozás elméleti és gyakorlati módszereinek megismertetése, gyakorlása.

Tantárgy tematikája:

Ismeretkörök (heti bontásban):

- Gyógyszerkémiai alapismeretek. A gyógyszerkutató folyamat; a biológiailag aktív, új molekulák szintézise. Az új szerek engedélyeztetése. Iparjogvédelmi ismeretek.
- A gyógyszerek csoportosítása hatásmechanizmusuk szerint. A központi idegrendszerre ható szerek, jellemzésük példák alapján.
- Általános érzéstelenítők, altatók, minor és major trankvillánsok, szintézisük és alkalmazásuk.
- Láz- és fájdalomcsillapítók, természetes és félszintetikus morfin származékok. Pszichostimulánsok, pszichoenergetikumok, hallucinogének.
- Helyi érzéstelenítők, görcsoldók, izomrelaxánsok, mozgató végkészülék bénítók. A vérkeringésre, a légzésre és az emésztésre ható szerek.
- Az anyagcserére ható szerek, a vitaminok szerepe, a szteroid hormon háztartás.
- A kemoterápiás szerek; az antibiotikumok működése és legfontosabb képviselőik.
- Esettanulmányok: hogyan állítható elő benzolból antibiotikum? A chlorocid szintézis technológiai folyamatának részletes áttekintése.
- Toxicológiai alapismeretek; gyógyszeripari hulladékok, melléktermékek feldolgozása.
- A szintézisút tervezés lényege: a "gyengén meghatározott igénytől a megelégedett fogyasztóig". A tervezés hierarchiája, költségmegosztás, megvalósítási valószínűség különböző szinteken.
- Irodalmi és szabadalmi helyzet. Az eljárás specifikus és külső jellemzői. Az eljárás határai. Laboratóriumi és ipari eljárások.
- Molekula felépítése: szinten elmélet. Alapmolekula. Elektrofil-, nukleofil centrumú molekulák reakciói. Egyszerű szintézisek felépítése. Komplex szintézisek tervezése. Funkciós csoportok bevitele és átalakítása. Szénváz kialakítások.
- Munkamódszerek az eljárások kidolgozása során: Heurisztika, expert rendszerek, logisztika. Az eljárás struktúrájának kidolgozása. Eljárás minősítése: Wagner-, Pattern rendszer, minősítési kritériumok. Ipari példák.
- Reaktor kiválasztás szempontjai. Kísérlettervezés. Faktoriális kísérlettervezés: teljes, egyfaktoros analízis, szűkített analízis, Plackett-Burman módszer; kiértékelésük. Optimálás: Simplex módszer. Kinetikai leírás-, mechanizmus vizsgálati szintek, szűrőpróba vizsgálatok.
- Kísérleti üzem típusai: "miniplant", "pilot plant", feladataik, méretek, lépték növelés, költségek, felépítési szabályok. Biztonsági intézkedések.



TANTÁRGYI ADATLAP

Tantárgy követelménye:

A hallgatók 2-3 fős csoportja team munkában kidolgozza egy-egy gyógyszer vagy szerves intermedier szintézisének lehetséges útjait és kritikailag értékeli azokat.

Vizsgakérdések, vizsgakövetelmények:

- Ismertesse, milyen vizsgálatok előzik meg egy gyógyszer törzskönyvezését!
- Melyek a szervezetben lejátszódó gyógyszer-metabolizmus alapvető folyamatai?
- Ismertesse a központi idegrendszerre ható fontosabb gyógyszereket hatásuk szerint csoportosítva!
- Ismertesse gyógyszeripari példákban az acilezési folyamatok jelentőségét!
- Mi a Contergan, és mi volt a "Contergan-botrány" lényege?
- Csoportosítsa a kábítószereket veszélyességük szerint és ismertesse hatásukat.
- Mik a legfontosabb hatóanyagai a nem kábító fájdalomcsillapító, hőcsökkentő és gyulladásgátló szereknek?
- Ismertesse és csoportosítsa felszívódásuk szerint vitaminokat, mit okoz hiányuk?
- Mik az ún. Minor-, illetve major trunkvillánsok? Ismertesse a fontosabb képviselőiket!
- Mi a "bakteriosztatikus hatás"?
- Mik azok az "antihormonok"? Mondjon rá példákat!
- Ismertesse a félszintetikus penicillin-gyártás lényegét!
- Mi a különbség a marha-, a sertés- és humán inzulin között? Hogyan lehet az utóbbit előállítani?
- Ismertesse a klorocid kémiai szintézissel történő előállításának fontosabb lépéseit!
- Melyik az a szintézis lépés, amikor a klorocid-intermedier értéke a legnagyobb mértékben növekszik? Miért?
- Ismertesse a laboratóriumi-, illetve az ipari eljárások alapvető különbségeit.
- Ismertesse a kísérlettervezés során a faktoranalízis szerepét!
- Mi a lényege a "Pattern-féle eljárás kiértékelés módszernek"?
- Ismertesse, hogy mi az előnye illetve hátránya, ha "Miniplant" kísérleti üzemet alkalmazunk "Pilot Plant" helyett!
- Mit kell eldönteni, illetve milyen paramétereket kell megmérni a szintézisút tervezés laboratóriumi munka szakaszában?

Tantárgyhoz kapcsolódó irodalom:

Felhasznált tankönyvek:

Knoll József: Gyógyszertan, Medicina Könyvkiadó Rt., Bp, 1993.

Dr. Heiszman József: Szerves kémiai technológia, Tankönyvkiadó, Budapest, 1991.

R.K. Mackie, D.M. Smith: Szerves kémiai szintézisek, Műszaki Kiadó, Bp., 1986.

J.M. Douglas: Conceptual Design of Chemical Processes, McGraw Hill, NY, 1989.

M.S. Peters, K.D. Timmerhaus: Plant Design and Economics for Chemical Engineers, McGraw Hill, NY, 1991.