



Tárgytematika

Félév:	2012/13/2
Tárgynév:	Gyógyszerkémia és szintézistervezés
Tárgykód:	VEMKOT4244A
Felelős szervezet neve:	Szerves Kémia Intézeti Tanszék
Felelős szervezet kódja:	MKOK
Tárgyfelelős neve:	Dr. Tőrös Szilárd

Oktatás célja:

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

Tantárgy tartalma:

Ismeretkörök (heti bontásban): 1. Gyógyszerkémiai alapismeretek. A gyógyszerkutatás folyamata; a biológiailag aktív, új molekulák szintézise. Az új szerek engedélyeztetése. Iparjogvédelmi ismeretek. 2. A gyógyszerek csoportosítása hatásmechanizmusuk szerint. A központi idegrendszerre ható szerek, jellemzésük példák alapján. 3. Általános érzéstelenítők, altatók, minor és major trunkvillánsok, szintézisük és alkalmazásuk. 4. Láz- és fájdalomcsillapítók, természetes és félszintetikus morfinszármazékok. Pszichostimulánsok, pszichoenergetikumok, hallucinogének. 5. Helyi érzéstelenítők, görcsoldók, izomrelaxánsok, mozgató végkészülék bénítók. A vérkeringésre, a légzésre és az emésztésre ható szerek. 6. Az anyagcserére ható szerek, a vitaminok szerepe, a szteroid hormon háztartás. 7. A kemoterápiás szerek; az antibiotikumok működése és legfontosabb képviselőik. 8. Esettanulmányok: hogyan állítható elő benzolból antibiotikum? A chlorocid szintézis technológiai folyamatának részletes áttekintése. 9. Toxikológiai alapismeretek; gyógyszeripari hulladékok, melléktermékek feldolgozása. 10. A szintézisút tervezés lényege: a "gyengén meghatározott igénytől a megelégedett fogyasztóig". A tervezés hierarchiája, költségmegoszlás, megvalósítási valószínűség különböző szinteken. 11. Irodalmi és szabadalmi helyzet. Az eljárás specifikus és külső jellemzői. Az eljárás határai. Laboratóriumi és ipari eljárások. 12. Molekula felépítése: szinton elmélet. Alapmolekula. Elektrofil-, nukleofil centrumú molekulák reakciói. Egyszerű szintézisek felépítése. Komplex szintézisek tervezése. Funkciós csoportok bevitele és átalakítása. Szénváz kialakítások. 13. Munkamódszerek az eljárások kidolgozása során: Heurisztika, expert rendszerek, logisztika. Az eljárás struktúrájának kidolgozása. Eljárás minősítése: Wagner-, Pattern rendszer, minősítési kritériumok. Ipari példák. 14. Reaktor kiválasztás szempontjai. Kísérlettervezés. Faktoriális kísérlettervezés: teljes, egyfaktoros analízis, szűkített analízis, Placket-Burman módszer; kiértékelésük. Optimálás: Simplex módszer. Kinetikai leírás-, mechanizmus vizsgálati szintek, szűrőpróba vizsgálatok. 15. Kísérleti üzem típusai: "miniplant", "pilot plant", feladataik, méretek, lépték növelés, költségek, felépítési szabályok. Biztonsági intézkedések.

Számonkérési és értékelési rendszere:

Gyakorlat látogatása kötelező.

Félévközi beadandó feladatok: 1 db tanulmány (10-15 oldal) Beszámoló az anyagból.



Tárgytematika

Félév:	2012/13/2
Tárgynév:	Gyógyszerkémia és szintézistervezés
Tárgykód:	VEMKOT4244A
Felelős szervezet neve:	Szerves Kémia Intézeti Tanszék
Felelős szervezet kódja:	MKOK
Tárgyfelelős neve:	Dr. Tőrös Szilárd

Számonkérési és értékelési rendszere:

Zárthelyik száma: 1

Zárthelyik pótlásának lehetősége: igazolt hiányzás esetén a vizsgaidőszak első napján.

-ha igazoltan hiányzott: 1 alkalom

-ha igazolatlanul hiányzott: 1 alkalom

Leckekönyv aláírás feltétele: 1 db évközi zh megírása legalább elégséges eredménnyel, tanulmány beadása és ismertetése

Vizsgára bocsátás feltétele: aláírás

Vizsgajegy kialakításának módja: az évközi zh jegy (30 %), tanulmány (40 %) és az írásbeli vizsga (30 %) eredménye alapján

Hiányzások pótlására lehetőség biztosított az oktatóval való megegyezés értelmében.

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-inermedier 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?

Kötelező és ajánlott irodalom:



Tárgytematika

Félév:	2012/13/2
Tárgynév:	Gyógyszerkémia és szintézistervezés
Tárgykód:	VEMKOT4244A
Felelős szervezet neve:	Szerves Kémia Intézeti Tanszék
Felelős szervezet kódja:	MKOK
Tárgyfelelős neve:	Dr. Tőrös Szilárd

Kötelező és ajánlott 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.