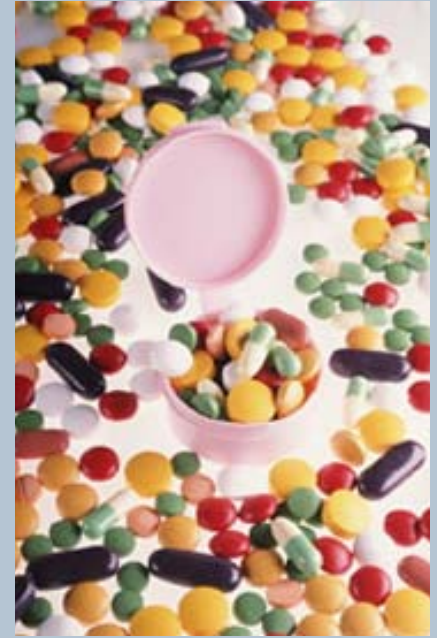


# GYÓGYSZEREK

Gyógyszernek tekintünk minden olyan anyagot, amelyet

- az élő szervezet befolyásolására gyógyászati céllal alkalmazunk, vagy
- a betegség megállapítása céljából az élő szervezetbe juttatunk, vagy
- a betegség megelőzése céljából használunk

**prevenció + diagnózis + terápia**



**A beteg azt mondja: - Fáj a torkom!**

**Erre az orvos:**

**Kr.e. 2000: Tessék, edd meg ezt a gyökeret!**

**Kr.u. 1000: Az a gyökér pogány dolog, mondj el egy imát!**

**Kr.u. 1850: Az az ima babonáság, idd meg ezt az elixirt!**

**Kr.u. 1940: Az az elixir kígyóolaj, nem tesz jót, nyeld le ezt a pirulát!**

**Kr.u. 1985: Az a pirula hatástalan, vedd be ezt az antibiotikumot!**

**Kr.u. 2003: Az az antibiotikum nem természetes! Tessék, itt egy gyökér.....**

# Gyógyszerek felosztása

## eredetük szerint

- ásványi (vazelin, paraffin, NaCl)
- állati (csukamájolaj, méhviasz)
- növényi (kamilla, csipkebogyó, stb.)
- szintetikus (kémiai, mikrobiológiai eá.)
- félszintetikus (természetes alapanyagból)

## hatáserősség alapján

- "nem erős hatású szerek"
- "erős hatású szerek"
- "altatószerek"
- "mérgek"
- "kábítószerek"

## hatásuk alapján

hatóanyag

## felhasználási terület

embergyógyászati

állatgyógyászati

## használat módja

gyógyszerforma: a hatóanyagból megfelelő technológiai eljárással közvetlen felhasználásra alkalmas készítmény



## A gyógyszerformák alkalmazási helye és módja

| alkalmazási hely                | alkalmazási mód                        | gyógyszerforma                             |
|---------------------------------|--|--|
| szájüreg                        | orális (szájban, pl. nyelv alatt)      | szublingvális tablettá                     |
| szájon át. a gyomor-bél traktus | per os, vagyis perorális alkalmazás    | oldatok, pirulák, drázsék, stb.            |
| végbél                          | per rectum, vagyis rektális alkalmazás | végbélkúpok, klizmák                       |
| hüvely (vagina)                 | vaginális                              | hüvelygolyó (globulus), hüvelykúp (ovulum) |
| izom                            | intramuszkuláris (i.m.)                | injekciós oldat                            |
| vivőér (vena)                   | intravénás (i.v.)                      | injekció vagy infúzió                      |
| hörgők és alveolusok            | inhaláció                              | inhalasolum, aerosolum                     |

injekció: ne legyen kellemetlen

kúp: ott olvadjon, ahol kell

tablettá: drázsé, kapszula

ne legyen rossz ízű

megfelelő helyen oldódjon

retard



## A gyógyszer megítélése

*hatásszélesség* (jó, ha nagy!) = káros következmény nélkül még eltűrhető adag - gyógyító adag

*terápiás index* (jó, ha kicsi!) = dosis curativa/dosis tolerata

A gyógyszer további sorsa a szervezetben, farmakokinetikai viselkedés

**L**iberáció (felszabadulás a gyógyszerformából)

**A**bszorpció (felszívódás)

**D**isztribúció (megoszlás a szövetnedvekben)

**M**etabolizáció (átalakulás, lebomlás van-e)

**E**limináció (kiürülés)

**R**esponse (biológiai válasz)

## Gyógyszergyártás

1. hatóanyag előállítása

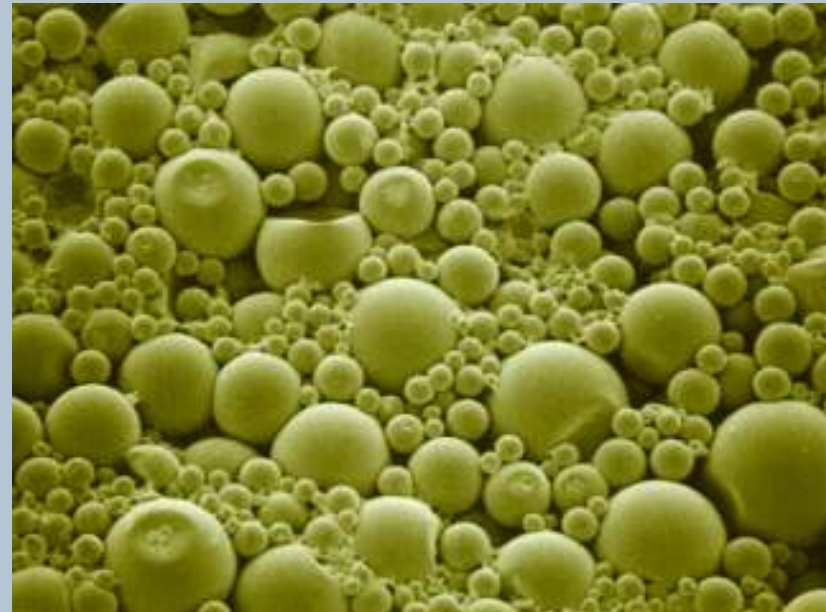
2. gyógyszerforma előállítása

segéd- és vivőanyagok (fiziológias hatásuk nincs,  
ugyanakkor fontosak)

• felszívódás → mikrokapszula

acetil-szalicilsav: ASPIRIN fájdalom- és lázcsillapító

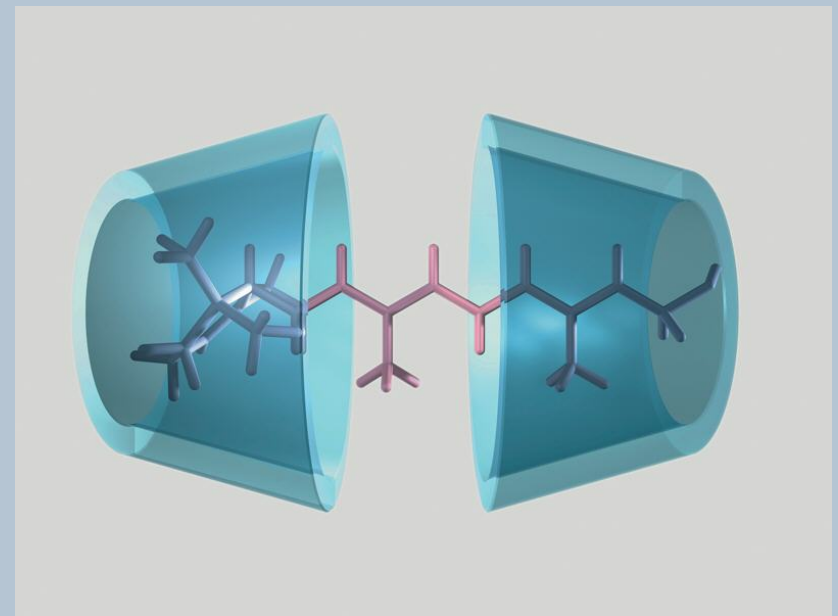
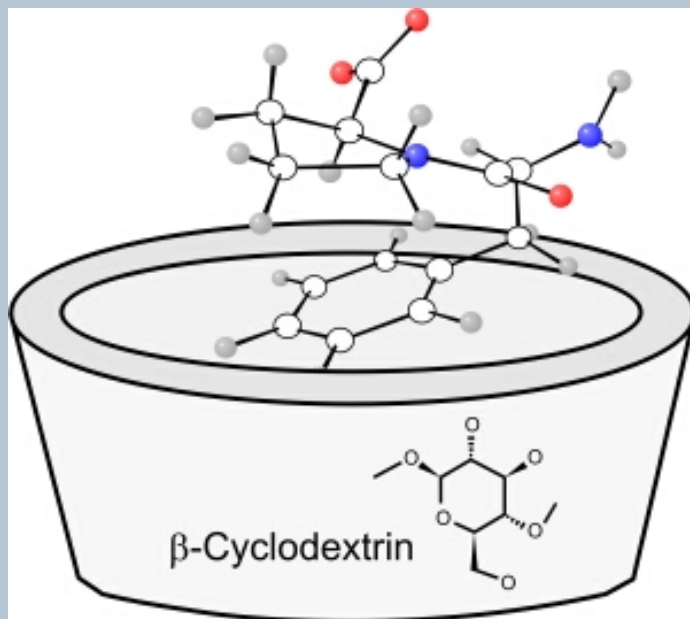
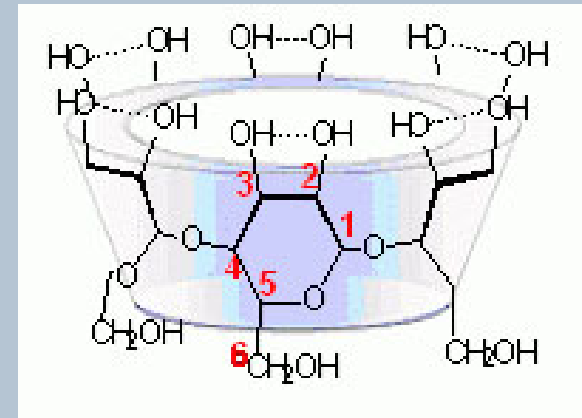
mikrokapszulás acetil-szalicilsav : COLFARIT trombózis ellen



- hatás elnyújtása → ciklodextrin

ciklodextrin szerepe  
(összekapcsolt glükóz gyűrűk)

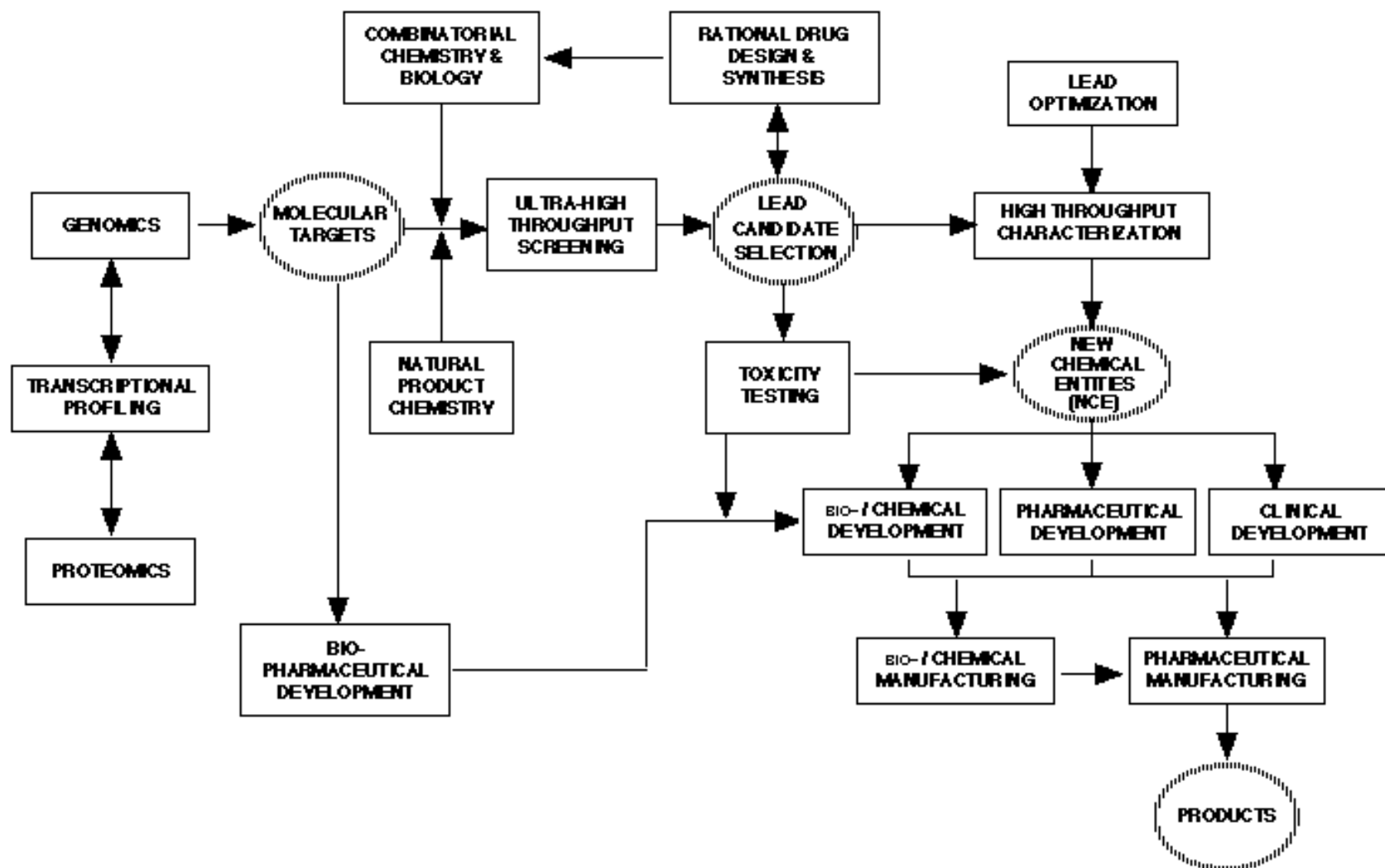
- bomlékony vegyületek stabilizálása
- folyadékból kristályos
- kellemetlen szagok eliminálása
- oldhatóság növelése (kívül poláros, belül apoláros)







# MODERN PHARMACEUTICAL DISCOVERY AND DEVELOPMENT PROCESS



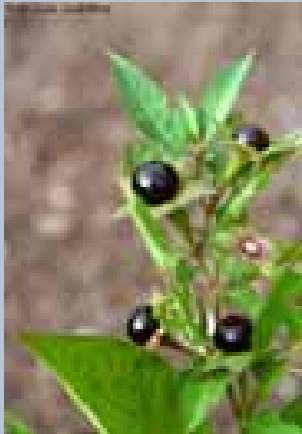


## Gyógyszerek csoportosítása hatásuk szerint

- központi idegrendszerre (érzéstelenítő, altató-, nyugtató- és izgatószer, relaxánsok)
- vegetatív idegrendszerre, izmokra (helyi érzéstelenítők, görcsoldók)
- vérkeringésre, légzésre (vérnyomás  $\uparrow, \downarrow$ ; értágítók, érszűkítők, köhögéscsillapítók)
- emésztésre (epehajtó, emésztést elősegítő)
- anyagcserére (vitaminok, hormonok (fogamzásgátló), cukorbetegség)
- bőrgyógyászati szerek
- kórokozókra (fertőtlenítő szerek, antibiotikumok, féreghajtók, antimikotikumok)
- daganatos betegségekre (citosztatikumok)

## Alkaloidok

- N-tartalmú, bázisos tulajdonságú szerves vegyületek
- hőre, fényre érzékenyek
- növények szekunder anyagcseréjének termékei
- fiziológias hatás    gyógyszerek, gyógyszer alapanyagok



**Atropa belladonna**

### *Atropin*

nadragulya növényből

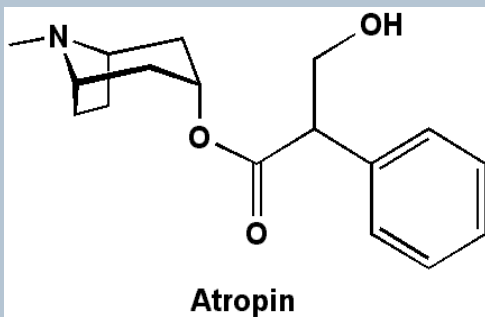
atroposz: élet fonalát elvágja → mérgező

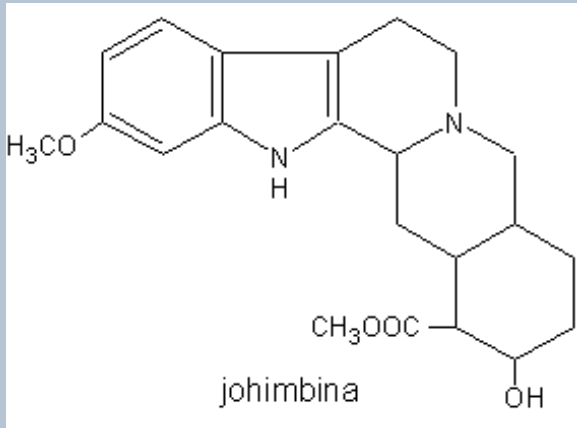
pupillatágító

nyugtató (betiltva!)

arcfesték volt (piros)

Származéka: Troparin, Meristin, Bilagit





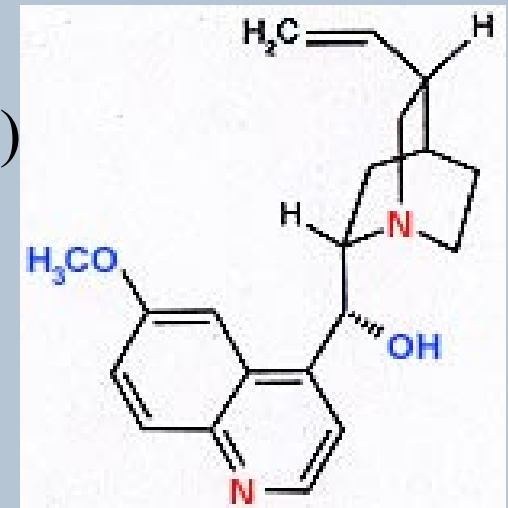
## ***Johimbin***

yohimbe fából  
szerelmi bájjal

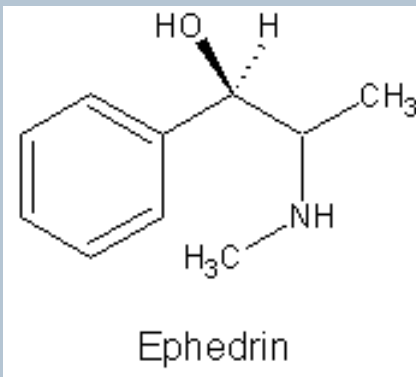


## ***Kinin***

kínafa alapon  
(kimain, cinkonin és cinkonidin is)  
malária ellenes szer  
(lázcsillapító)  
(fájdalomcsillapító)



# Efedrin

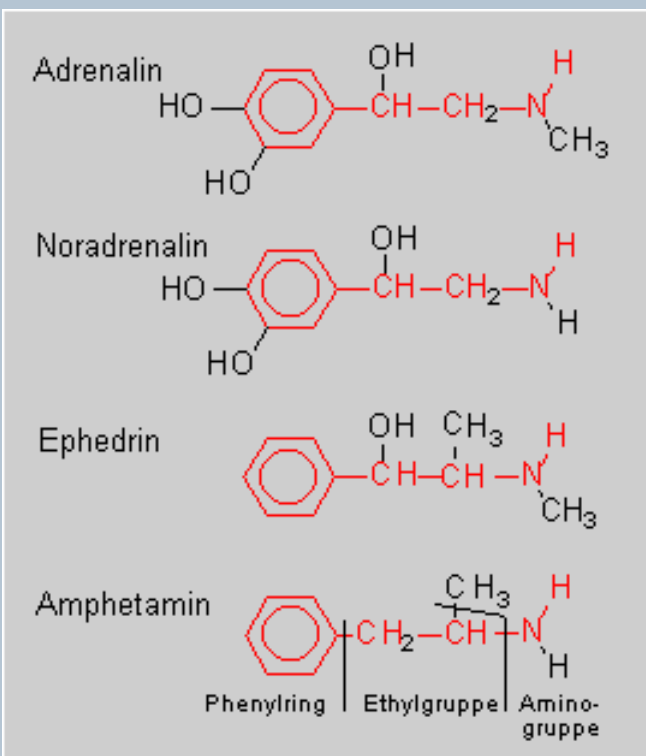


Ma Huang (*Ephedra distachya*)  
növényből v. bioszintézissel  
keringésre hat  
(orrcsepp)



# Amfetamin(ok)

Emeli a vérnyomást, növeli a pulzus-  
számot, fokozza az anyagcserét, csök-  
kenti a szellemi és  
fizikai fáradtságot,  
erős étvágycsökkentő  
hatása van  
Extasy, Speed



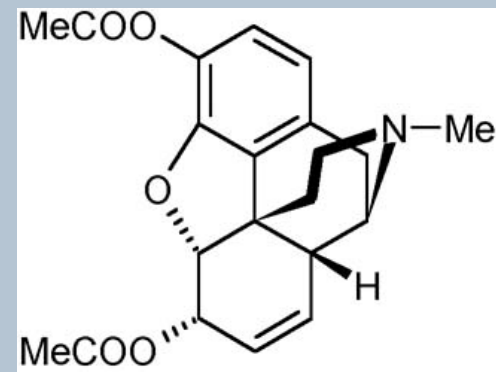
**Mák** (*papaver somniferum*) → **Ópium** (>25 alkaloid)

Görögországban nemcsak a legtöbbet használt orvosság volt, hanem kultikus célból templomokban füstölőként alkalmazták; kábítószerként pedig orgiákon, lakomákon, misztériumokon használták. A **mák** városa Mekon, az ópium-készítés központja Ciprus, Aphrodité szigete volt.

- fenantrén váz: morfin, kodein és tebain
- benzilizokinozil váz: papaverin, narkotin, narcein

**Morfin**: pszihésen könnyed, színes hallucinációkat idéz elő, eleinte serkeni a szellemi munkát is; hatása hamar elmúlik, majd mély alvásba torkollik; néhány hét alatt erős testi függőség.

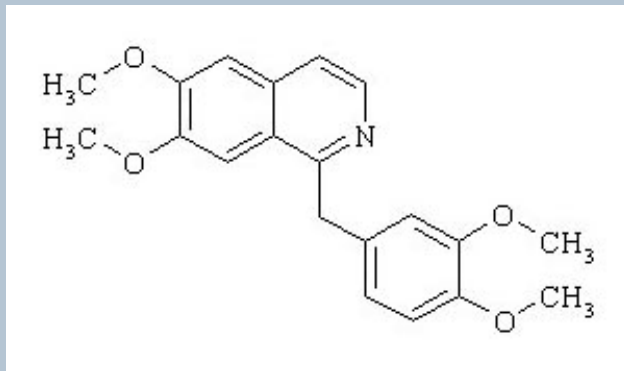
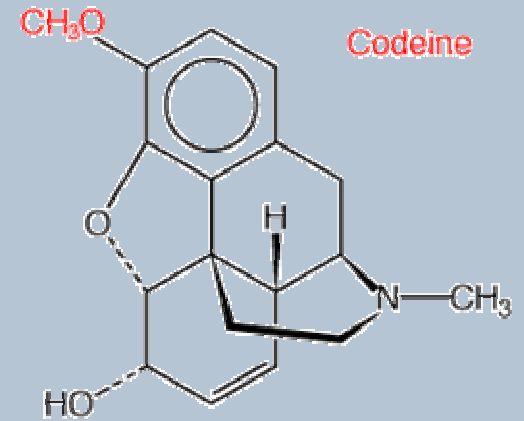
fájdalomcsillapító gyógyszer



heroin

## *Kodein*

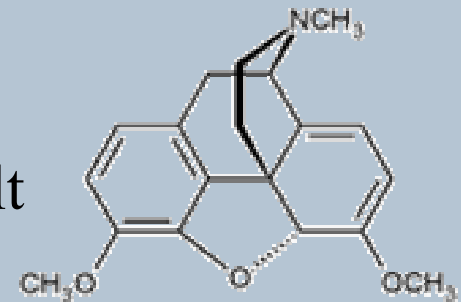
morfin metilétere  
gyengébb, kevésbé toxikus  
köhögéscsillapító  
Erigon szirup, Radipon tabl.  
Meristin kúp



## *Papaverin*

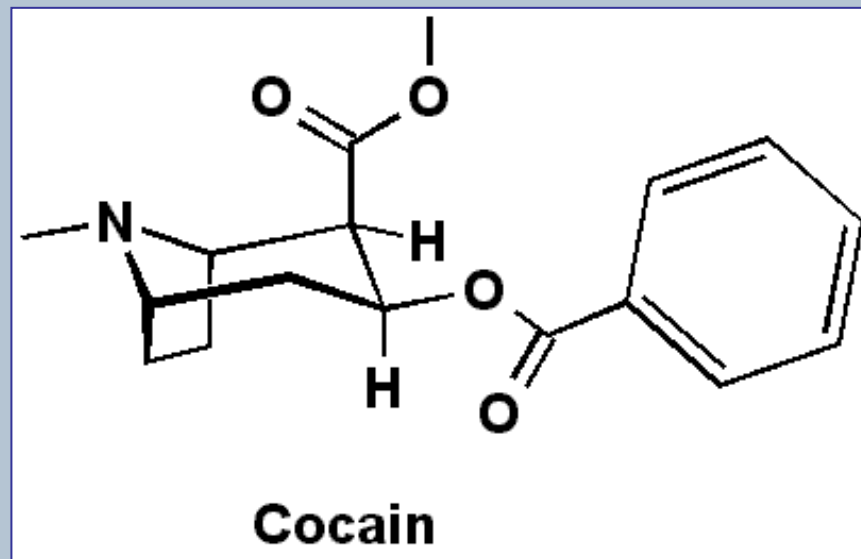
görcsoldó (gyomor, bél, epe, stb.)  
Troparin, Bilagit, Meristin  
impotencia kezelése

*Tebain*: elsősorban intermedierként használt



## *Kokain*

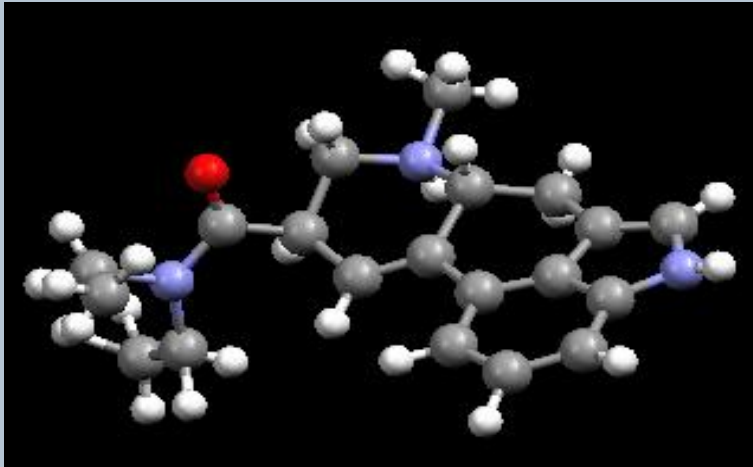
- forrás: kokacserje (Erythroxylon Coca)
- természetes lelőhelye: Peru, Bolívia, Brazília, Kolumbia
- már az inkáknál is léteztek kokaültetvények
- mai napig is használják az őshonos, magaslaton élő indiánok a munkaerő és munkakedv növelésére
- a drogok közül a legerősebb pszichikai függőség okozója
- hidrokloridja: anasztéziológia





*LSD (lizergsav-dietil-amid)*

mesterséges



1938-ban a Sandoz kutatólaboratóriumában szintetizálták először, ma is folynak gyógyszerkutatások



***Purin alkaloidok:*** koffein, teofillin, teobromin  
előfordul: tea, kávé, kakaó, cola

- központi idegrendszerre stimuláló hatás
  - relaxálja a simaizmot
  - fokozott gyomorsav kiválasztást eredményez
- felhasználás:
- élvezeti szerek
  - gyógyszerek (Quarelin, Saridon, Coldrex, Aspirin forte, stb.)



teacserje



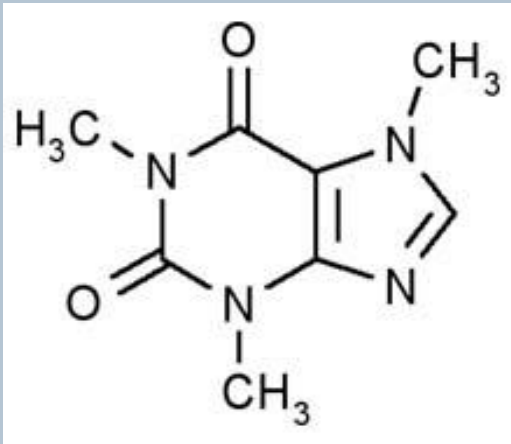
kakaóbab



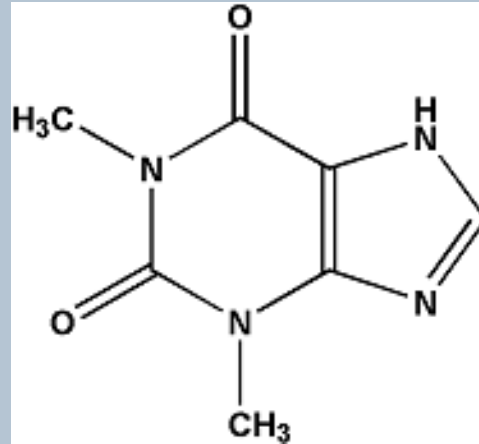
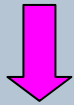
kávébab



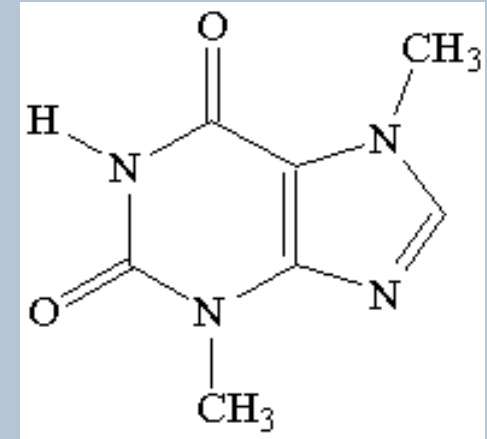
kóladió



**koffein**



**teofillin**



**teobromin**

koffeinfogyasztás: fele kávéban, fele gyógyszerben

terápiák: fejfájások, fájdalomcsillapítók kiegészítő hatóanyaga

kis súlyú újszülöttek légzésleállásakor

napi átlagos fogyasztás 250 mg, „nagyfogyasztók” >600 mg

5-10 g → azonnali halál ... szorongás, alvászavar

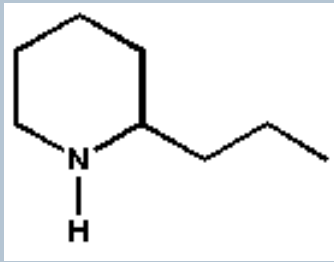
felszívódás nagyon jó: hatás 15-120 perc után maximális

félélettartam felnőtt – 2,5-4,5 óra

újszülött – 50-130 óra

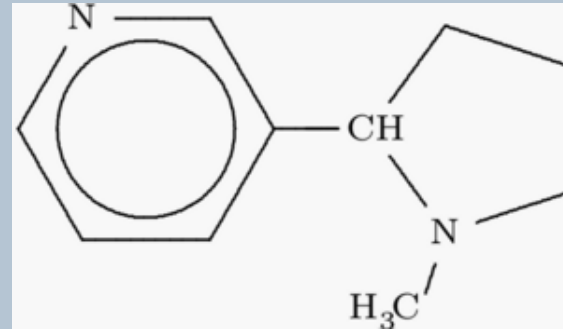
## *Koniin*

Conium maculatum (bőrök)  
halálos mérreg (0,15 g)  
Szókratész halála (i.e. 399)



## *Nikotin*

dohány  
halálos mérreg (50 mg)  
a heroinhoz mérhető függőséget okoz  
növényvédőszer



# Láz- és fájdalomcsillapítók

## *Aspirin*

legelső ipari méretben előállított gyógyszer  
legnagyobb mennyiségben fogyasztottak egyike  
holdutazás (Apollo 11): egyetlen fájdalomcsillapító

### *Története:*

fűzfakéreg kivonat - 2400 éve Hippokratész

középkorban betiltották - kell a vessző (kosárfonás)

Napoleon blokádja - nincs kinin előveszik a fűzfakérget

1828 - tiszta szalicin

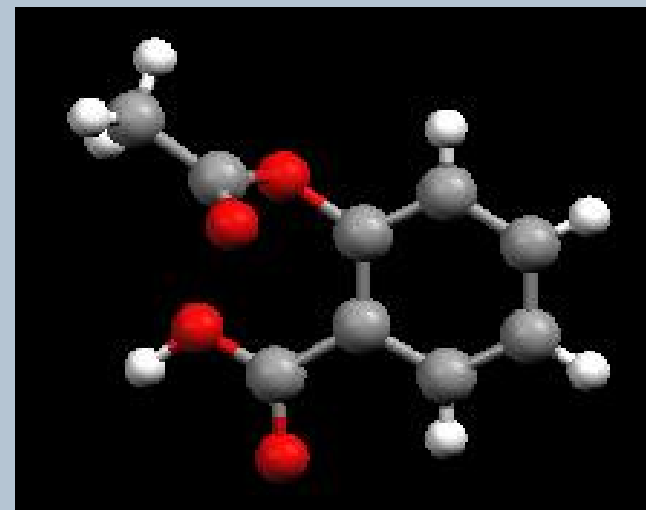
1838 - tiszta szalicilsav

1859 - szintetikus előállítás

1897 - acetyl-szalicilsav (Bayer)

Felix Hofmann (apja reumás)

1899 - szabadalom



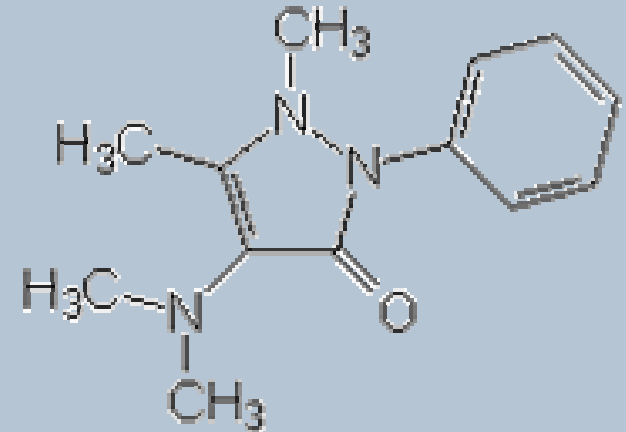


Hatás: láz- és fájdalomcsillapító  
reumaellenes szer (bélben oldódó)  
baktériumölő (tartósítás)  
késlelteti a véralvadást infarktus ellen  
rák ellen ???  
szalicilsav bőrgyógyászat (fertőtlenítés, hámlasztás)



## *Amidazophen, Aminophenazon*

Algopyrin, Quarelin, Novalgin stb.

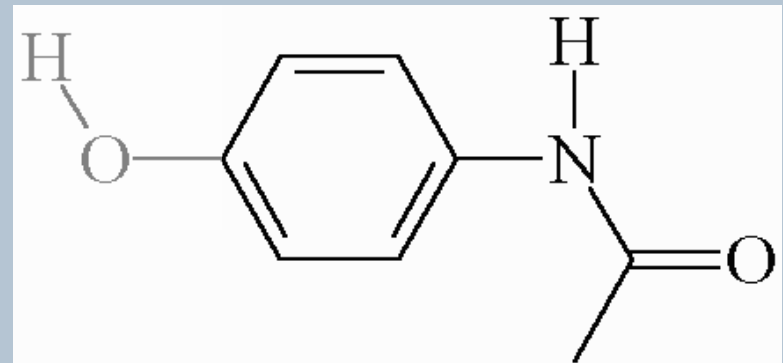


*Paracetamol* (Európa)

*Acetaminophen* (USA)

Rubophen, Panadol, Saridon, stb.

Acetanilid: kb 100 éve tévedésből keverték egy beteg gyógyszerébe  
→ fájdalomcsillapító, de toxikus  
→ OH-csoporttal módosított vegyület  
Tylenol: acetaminophen + kodein

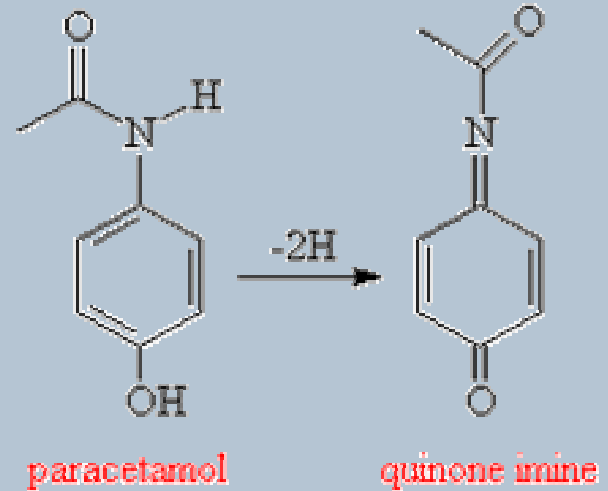


acetaminophen

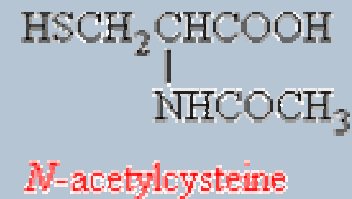
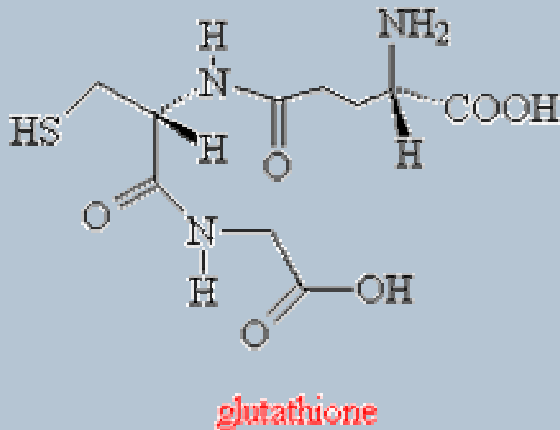


# Paracetamol túladagolás: májkárosodás

kinon imin: erősen toxikus  
eltávolítása: májban glutationnal  
(ha nincs elegendő → a máj szöve-  
teivel reagál → maradandó károsodás)



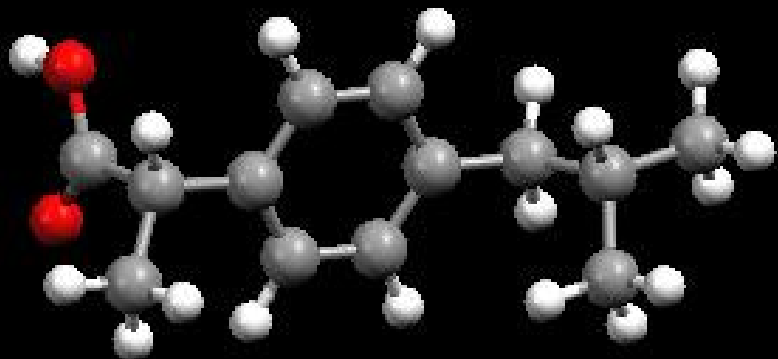
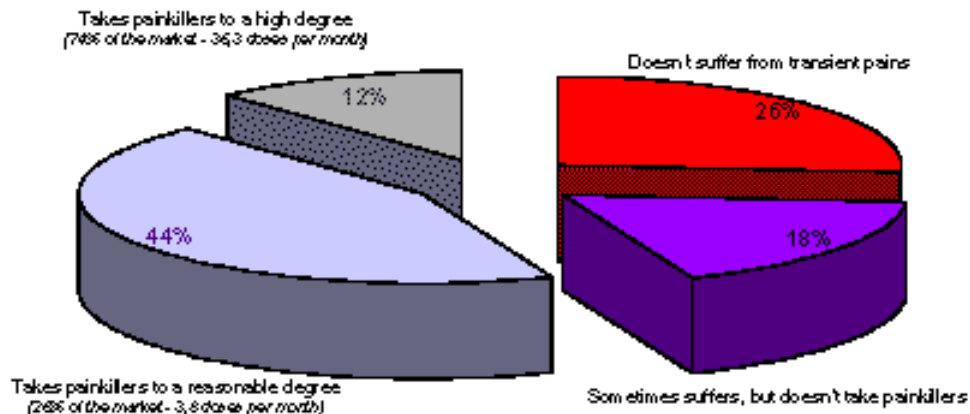
lebomlás első lépése



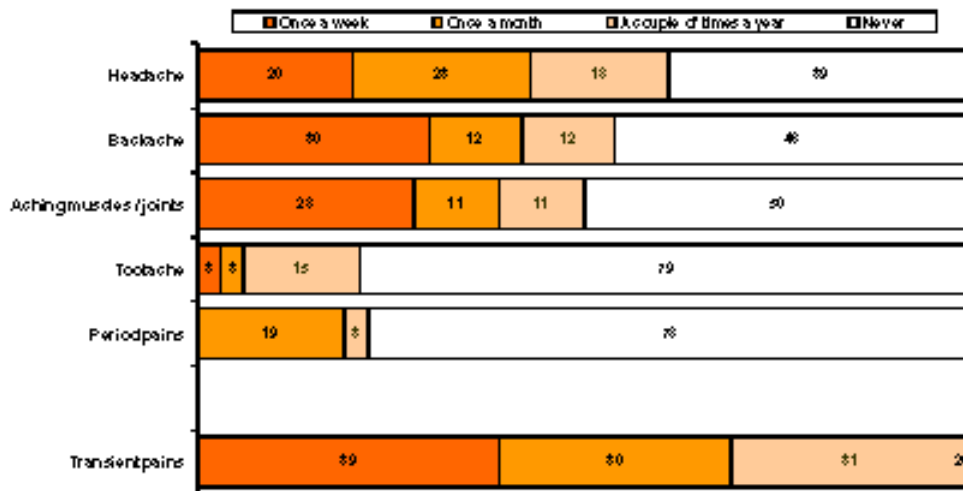
megemelik a glutation szintet a májban  
újabb gyógyszerekben együtt található

# Ibuprofen

Huma-Profen, Advil, stb.  
gátolja a prosztaglandin  
képződését  
gyulladáscsökkentő is



VARIATION IN THE FREQUENCY FOR EACH TYPE OF PAIN



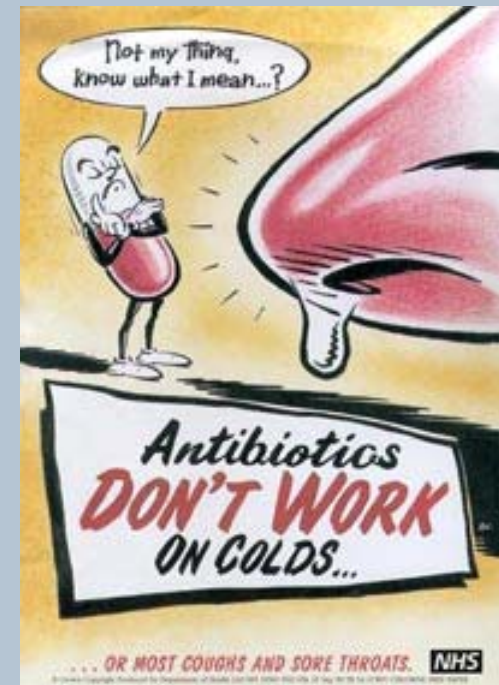
# Antibiotikumok

Különböző mikroorganizmusok vagy más élő rendszerek anyagcseréjének közti- vagy végtermékei, melyek már kis koncentrációban képesek baktériumok és más mikroorganizmusok növekedését gátolni, vagy azokat megölni.

1928 Flemming: penicillin → 1941: humán használat

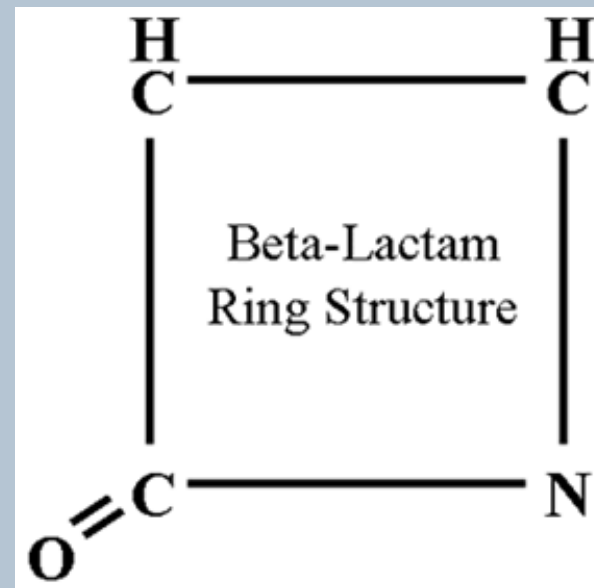
## Elnevezésük:

1. kémiai nómenklatúra szabályai szerint
2. generikus név, ált. rövidebb, tudományos irodalomban alkalmazott
3. márkanev, a gyártó által adott (védett)

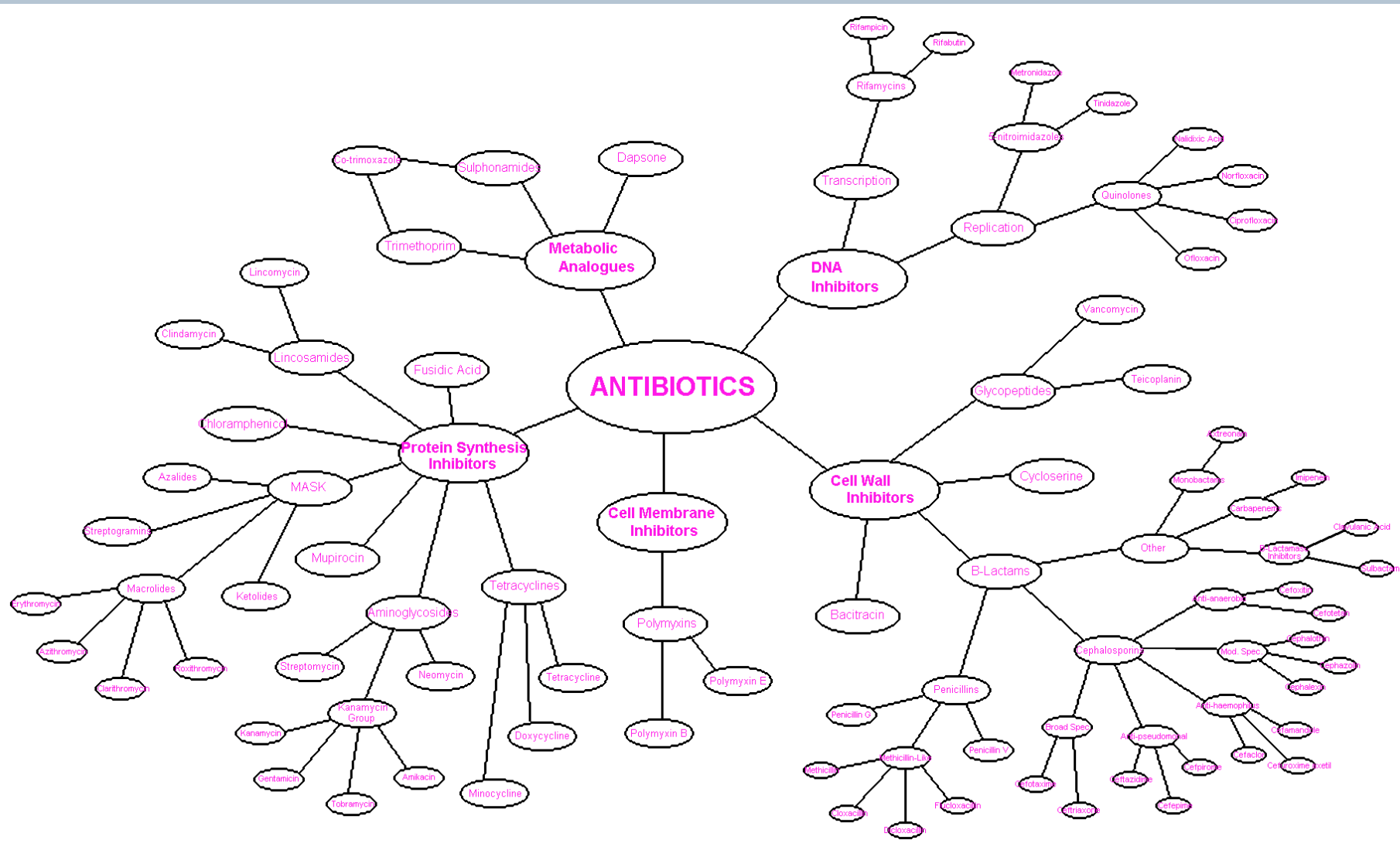


(egy lehetséges) Csoportosításuk:

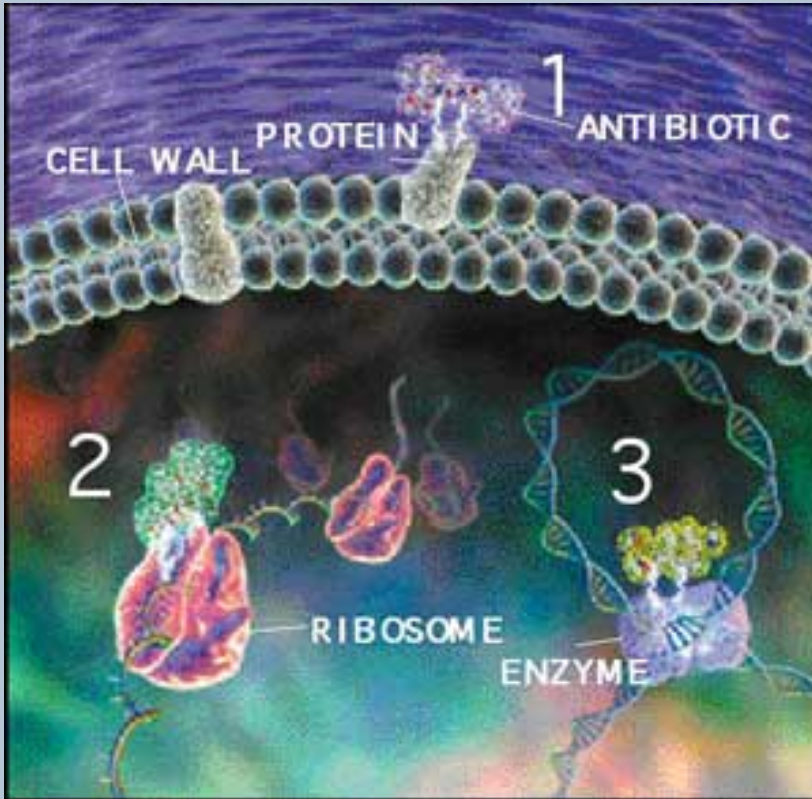
- Penicillin és származékai (béta-laktám gyűrű)
  - penicillinek
  - béta-laktámok
  - cefalosporinok
- Aminoglükozidok (neomicin, sztreptomycin, ...)
- Tetraciklinek (doxiciklin, oxytetraciklin, ...)
- Makrolidok (eritromicin, spiromicin, ...)
- Glükopeptidek (vancomicin, ramoplanin)
- Szulfonamidok
- Egyebek
  - klóramfenikol (sokféle mikroorganizmus ellen, de mellékhatások → életmentő esetekben (+kenőcs, szemcsepp))
  - clindamycin, stb.



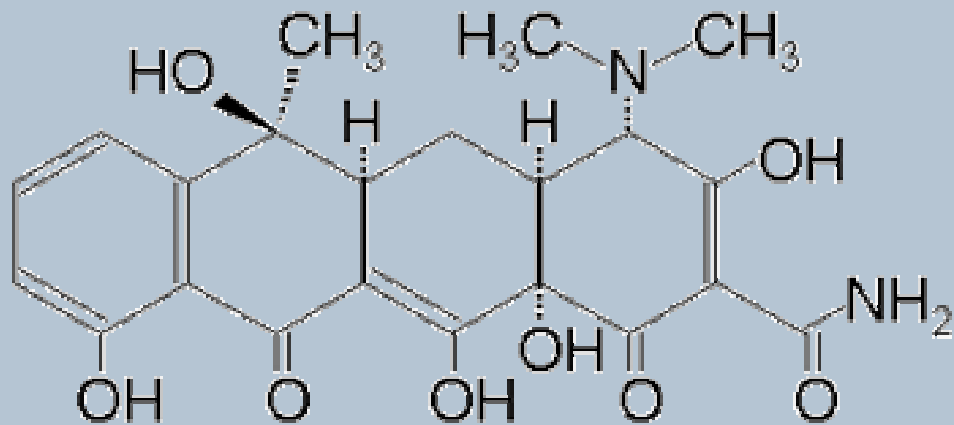
# Csoportosítás hatás szerint:



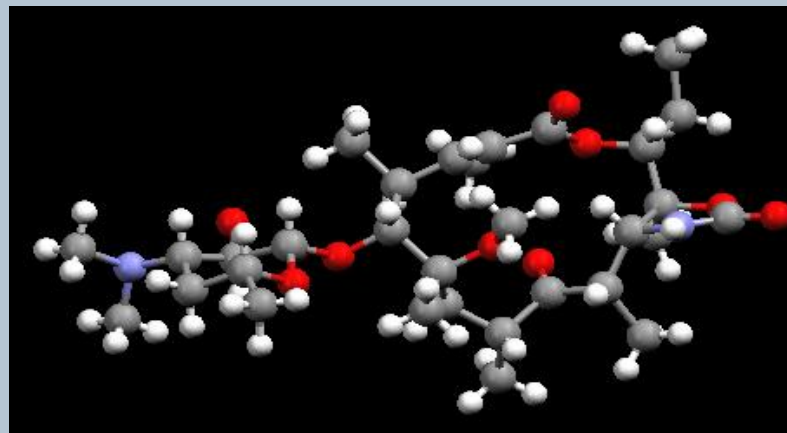
## Hogyan működnek az antibiotikumok?



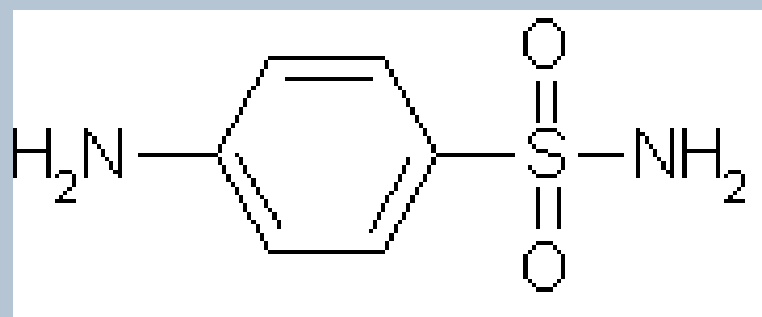
1. A sejtfal szintézisét gátolják (béta-laktámok)  
rezisztencia → béta-laktamáz  
antibiotikum-adalék: inhibitor (Augmentin)
2. A proteinszintézist rombolja a riboszómánál (Erythromycin, tetracyclin)
3. Gátolja a DNS-szintézist (szulfonamidok)



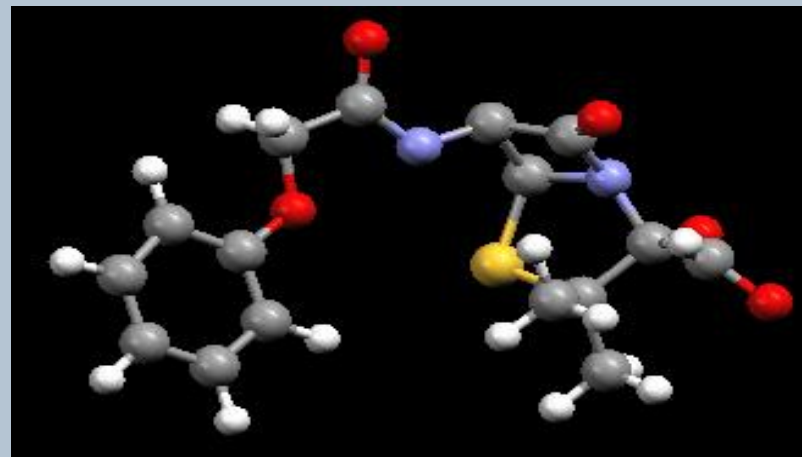
tetraciklin



erytromycin



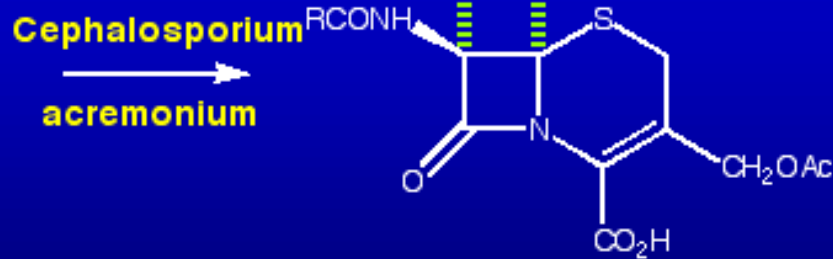
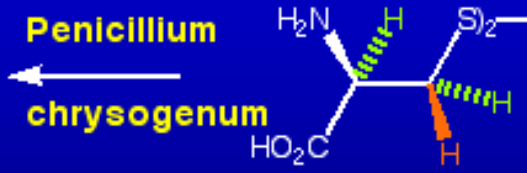
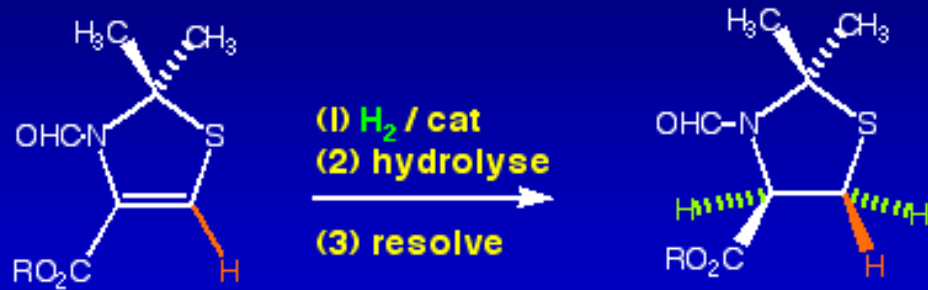
szulfanil-amid



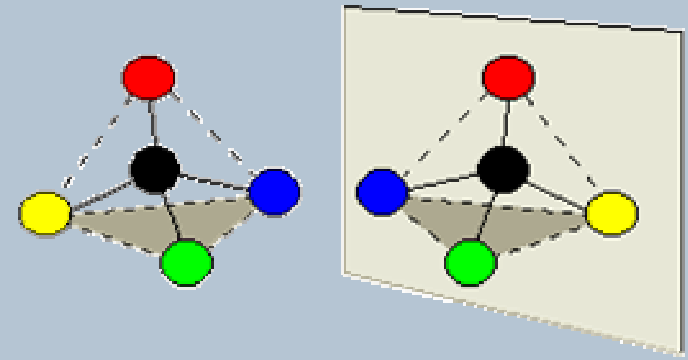
penicillin



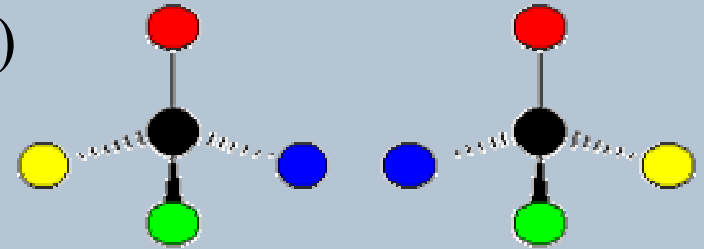
(egy lehetséges) Előállítás:



Tükörképi molekulák – gyógyszerként



királis vegyületek → két enantiomer (R,S)

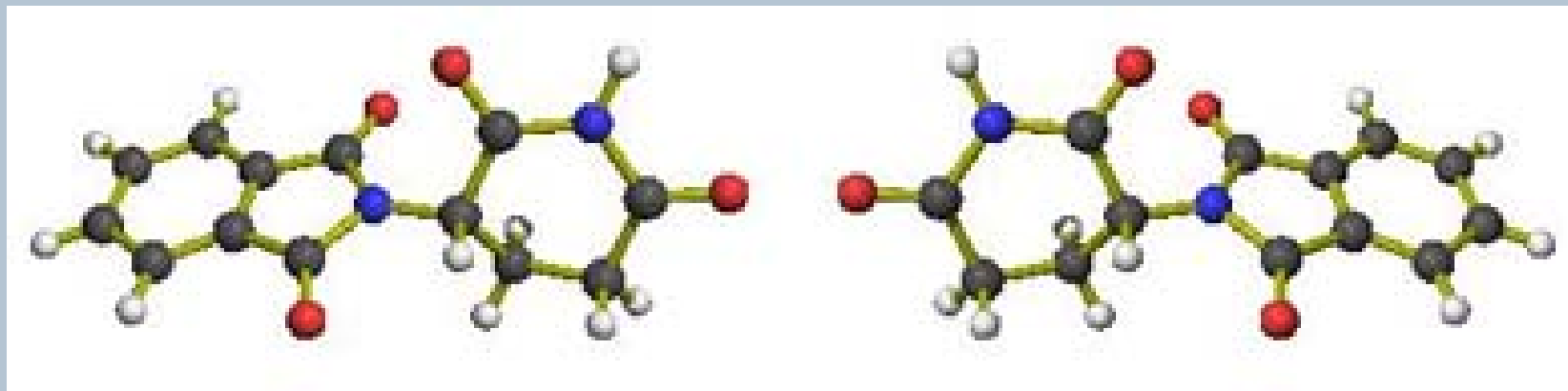


*Contergan botrány*

'50-es évek, enyhe nyugtatószerként forgalmazták  
terhes nőknek reggeli hányinger csillapítására



torzszülöttek



a thalidomid (alfa-ftálimido-glutártárimid) két tükörképi párja



Thalidomid hatóanyag

R → kívánt hatás

S → teratogén hatás

Contergan mindkettőt tartalmazta  
DE! Tiszta izomer sem jó, mert a  
szervezetben spontán racemizálódik

„Contergan bábik”

## Tükörképi vegyületek – gyógyszerként

- egyik izomer hatásos, másik nem

Ibuprofen: S aktív

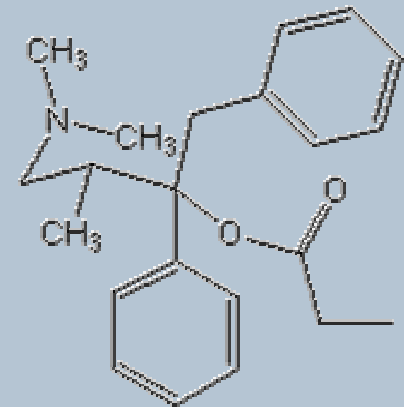
mégis racém gyógyszer, mert az R formát az enzimek átalakítják

- azonos hatásúak, csak nem egyforma mértékben
- teljesen azonosak
- különböző hatásúak (nem kívánatos mellékhatás esetén a tiszta izomer előállítása kívánatos)

– különböző terápiás hatás

fájdalomcsillapító DARVON  $\Leftrightarrow$  NOVRAD köhögéscsillapító

– kompenzáló hatás

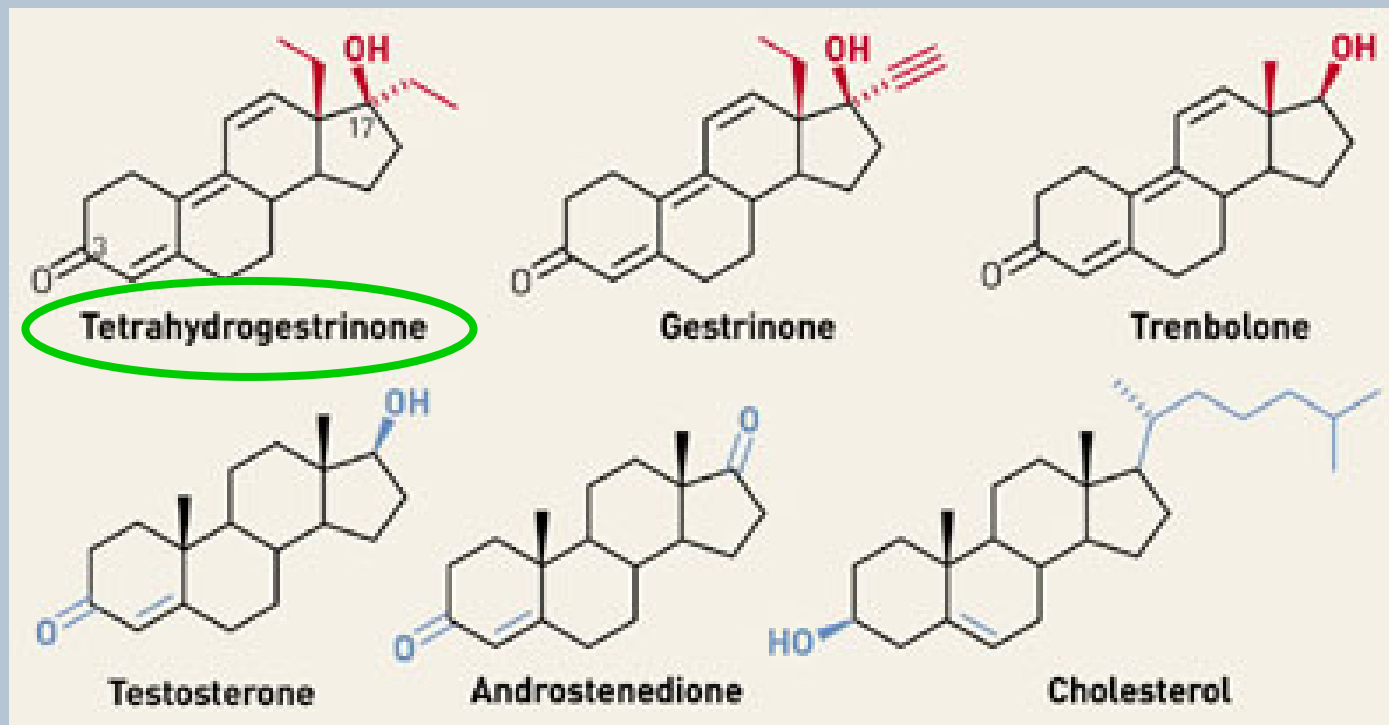
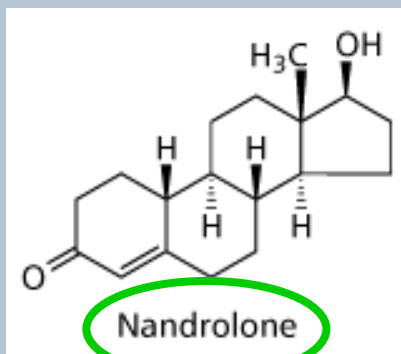


Darvon

# Doppingszerek

## *Történet*

- a holland 'dop' kifejezésből (zulu harcosok egyfajta erjesztett itala volt ez, amely növelte a bátorságukat a csatában)
- ókori görögök (diéta)
- 19. század (koffein, a kokain, sztrichnin vagy az alkohol)
- 1928: Nemzetközi Amatőr Atlétikai Szövetség tiltott szerek listája
- 1950-1970: ephedrin, amfetamin (több haláleset)
- 1966-tól nemzetközi versenyeken doppingtesztek
- '70-es évektől: szteroidok (nandrolon és tetrahydrogesztrionon (THG))
- vérdopping (gyakorlatilag még most is kimutathatatlan)
- EPO (erythropoietin) egy hormon: (a vesében termelődik és arra készíti a csontvelőt, hogy több vörösvértestet termeljen (megnövekedett hemoglobin koncentráció és hematokrit szint formájában mutatható ki))



Hatásai: izomnövekedés  
erőteljes testszörzet  
agresszív viselkedés

A NOB előírásai szerint a határérték 2 ng/ml.

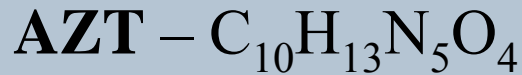
## *Tiltott szerek*

- **stimulánsok:** kábítószeres és izgatószeres, növelik az éberséget, csökkentik a fáradtságot, fokozzák a versenyzési készséget, de az agresszivitást is
- **narkotikumok:** pl. morfin és származékai, doppingszerként való felhasználásuk kábítószerrel való visszaélésnek számít
- **anabolikus szerek:** mellékhatások heresorvadás, csökkenő spermatermelés, rendszeres használatot követően magas vérnyomás, máj- és vesedaganatok  
nők esetében elférfiasodás, a petefészek működésének megszűnése, menstruáció elmaradása, terméketlenség
- **vizelethajtók:** gyors súlycsökkenés (komoly teljesítménycsökkenéssel párosulhat) + vizeletkiválasztás forszírozása (gyógyszer koncentráció csökkentése a vizeletben, illetve a szer kiválasztásának gyorsítása)  
keringési, illetve hormonális megterhelés



## Bejelentésre kötelezett szerek

| VEGYÜLETNÉV             | ATC-kód     | KÉSZÍTMÉNY                    | megjegyzés                |
|-------------------------|-------------|-------------------------------|---------------------------|
| Vcortison               | H02A        | Adreson tbl.                  | lokálisan alkalmazható    |
| oxymetazolin            | R01A        | Afrin spray                   | lokálisan alkalmazható    |
| dexamethason            | R03B        | Auxison                       | lokálisan alkalmazható    |
| terbutalin              | R03C        | Bricanyl inj., tbl., spray    | inhalációban alkalmazható |
| betamethason            | H02         | Celestone inj. és tbl.        | lokálisan alkalmazható    |
| triamcinolon            | H02         | Delphicort                    | törzskönyvből törölve     |
| mazipredonium           | H02A        | Depersolon inj. és csepp      | lokálisan alkalmazható    |
| methylprednisolon       | H02 A       | Depo-medrol inj.              | lokálisan alkalmazható    |
| prednisolon             | H02A        | Di-adreson F aquosum inj.     | lokálisan alkalmazható    |
| betamethason            | H02         | Diprophos inj.                | lokálisan alkalmazható    |
| prednisolon             | H02A        | Hemipred H inj.               | lokálisan alkalmazható    |
| insulin                 | A10A        | Humalogok                     | diabetesben adható        |
| somatropin (HGH)        | H01         | Humatrope inj.                |                           |
| gonadotropin (LH)       | G03G        | Humegon                       |                           |
| insulin                 | A10A        | Humulinok                     | diabetesben adható        |
| hydrocortison           | H02A        | Hydro-adreson aquosum inj.    | lokálisan alkalmazható    |
| hydrocortison           | H02A        | Hydrocortison microcr. inj.   | lokálisan alkalmazható    |
| insulin                 | A10A        | Insulinok                     | diabetesben adható        |
| triamcinolon            | H02         | Kenalog inj.                  | lokálisan alkalmazható    |
| adrenalin (epinephrin)  | N01B        | Lidocain-adrenalin injekciók  | lokálisan alkalmazható    |
| epinephrin (adrenalin ) | N01B        | Lidocain-adrenalin injekciók  | lokálisan alkalmazható    |
| adrenalin (epinephrin)  | N01B        | Marcain-adrenalin injekciók   | lokálisan alkalmazható    |
| epinephrin (adrenalin ) | N01B        | Marcain-adrenalin injekciók   | lokálisan alkalmazható    |
| dexamethason            | H02A        | Mephamesone-4 inj.            | lokálisan alkalmazható    |
| methyl-prednisolon      | H02 A       | Metypred inj. és tbl.         | lokálisan alkalmazható    |
| oxymetazolin            | R01A        | Nasivin csepp és spray        | lokálisan alkalmazható    |
| dexamethason            | H02A        | Oradexon inj. tbl.            | lokálisan alkalmazható    |
| triamcinolon            | H02         | Polcortolone tbl. és TC spray | lokálisan alkalmazható    |
| prednisolon             | H02A        | Prednisolon tbl.              | lokálisan alkalmazható    |
| salbutamol              | R03C + B532 | Salbutamol tbl., spray, sirup | inhalációban alkalmazható |
| salmeterol              | R03A        | Serevent spray                | inhalációban alkalmazható |
| hydrocortison           | H02A        | Solu-cortef inj.              | lokálisan alkalmazható    |
| methylprednisolon       | H02 A       | Solu-medrol inj.              | lokálisan alkalmazható    |
| prednisolon             | H02A        | Ultracorten H inj.            | lokálisan alkalmazható    |
| salbutamol              | R03A        | Ventolin spray                | inhalációban alkalmazható |
| salbutamol              | R03C        | Volmax tbl.                   | inhalációban alkalmazható |

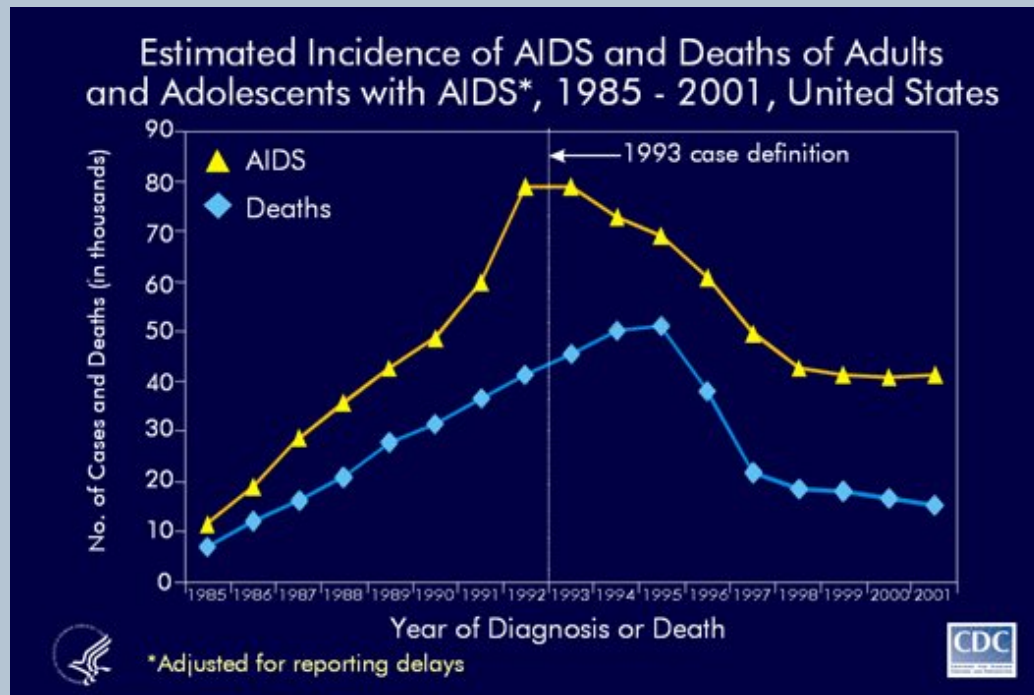
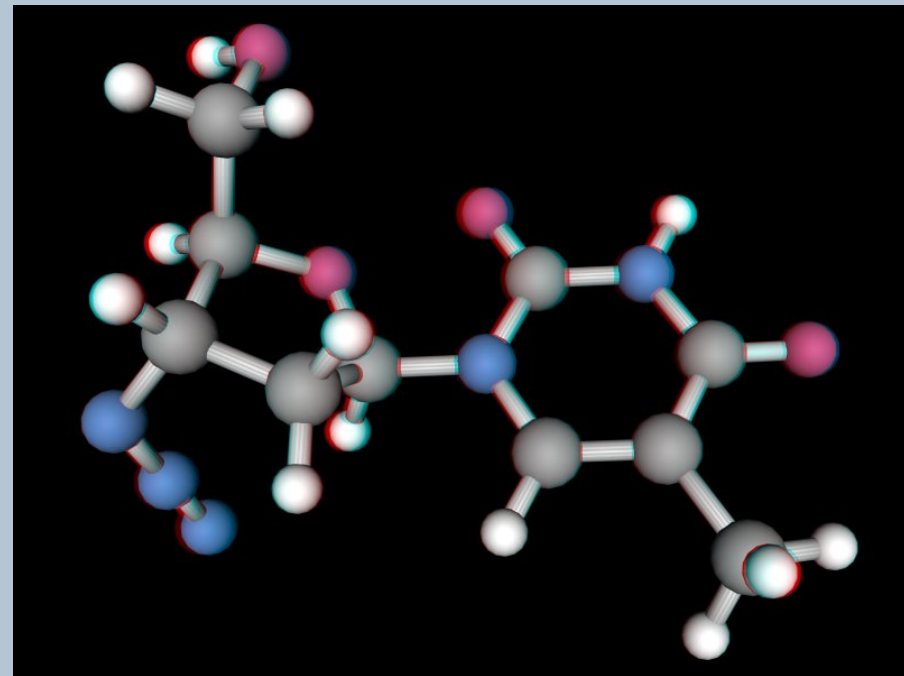


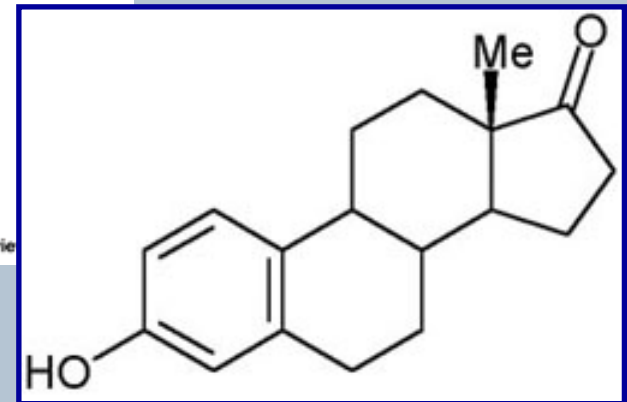
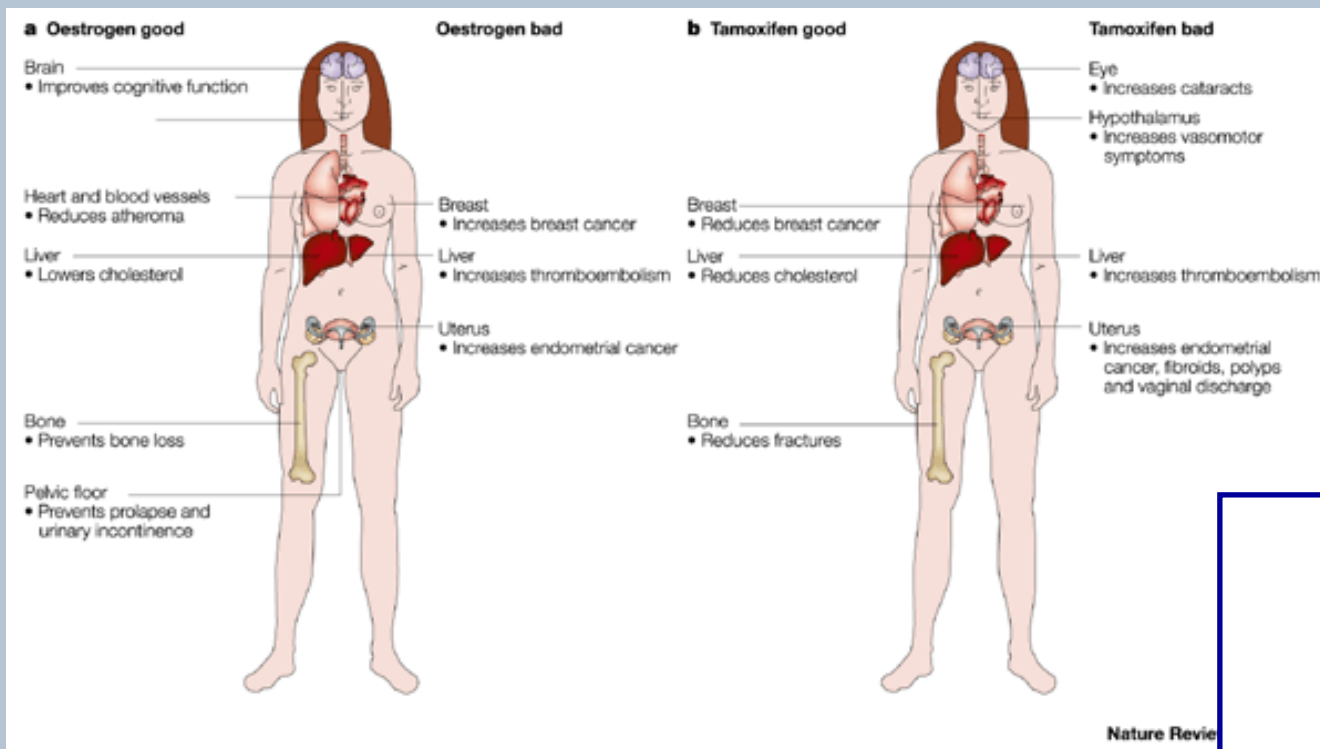
(azido-timidin)

eredetileg kemoterápiás céllal  
kutatták

ma: legjelentősebb HIV  
gyógyszer

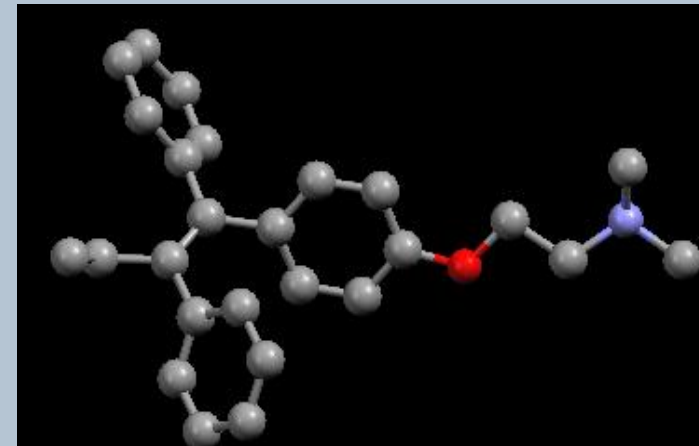
- erős vírusölő
- képes gátolni a sejtosztódást





## Tamoxifen

mellrák kezelésében (eredetileg fogamzásgátló hatását kutatták) (szintetikus nem-szteroid anti-ösztrogén) ösztrogén aktivitását gátolja → rákos sejtek növekedését, illetve terjedését gátolja vagy megszünteti





*"Give it to me straight, Doc.  
How long do I have to ignore your advice?"*