

A tantárgy neve:	magyarul:	Gyógyszerkémiai szintézisek						Kódja:	TTKME0324	
	angolul:	Organic Chemistry of Drug Synthesis								
A képzés 3. féléve (2. őszi félév)										
Felelős oktatási egység:		DE TTK, Szerves Kémiai Tanszék								
Kötelező előtanulmány neve:								Kódja:		
Típus		Heti óraszámok						Követelmény	Kredit	Oktatás nyelve
		Előadás		Gyakorlat		Labor				
Nappali	X	Heti	2	Heti	0	Heti	0	kollokvium	3	magyar
Levelező		Féléves		Féléves		Féléves				
Tantárgyfelelős oktató		neve:		Dr. Juhászné Dr. Tóth Éva				beosztása:	egyetemi adjunktus	
A kurzus célja, hogy a hallgatók										
<p>Megismerjék a gyógyszerkémia történetét, ezen belül a kémia, illetve a gyógyszerkémia fejlődése szempontjából fontos felfedezéseket, a magyar gyógyszeripar kialakulását. Ismeretet szerezzenek a farmakológia legfontosabb alapfogalmairól. A korábbi tanulmányaik során szerzett szerves kémiai ismereteikre alapozva megismerjék a gyógyszermolekulák előállítására alkalmazott reakciókat és azok mechanizmusait konkrét vegyületek részletes szintézisének elemzésén keresztül, ezáltal szélesítve és elmélyítve szerves kémiai tudásukat. A gyógyszerek csoportosítása a hatásuk alapján történik. Ismeretet szerezzenek a központi idegrendszerre ható gyógyszerek (narkotikumok, nyugtató-altatószerek, szorongásoldók, fájdalomcsillapítók), az antibiotikumok, a vírus és gomba ellenes készítmények, a természetes és szintetikus kemoterápiás készítmények, az inzulin, valamint a szintetikus hipoglikémiás szerek szerkezetére, alkalmazására és szintézisére vonatkozólag. A felsorolt szerkezetekből csak néhány gyógyszer szintézisének bemutatására kerül sor. A válogatás elsősorban a szerves kémiai szempontból fontosabb ismeretek alapján történik.</p>										
Tanulás eredmények, kompetenciák: a hallgató										
<i>Tudás:</i>										
A gyógyszerkémia fejlődésének története, a magyar gyógyszeripar kialakulása. A gyógyszerkutató, gyógyszerfejlesztés mai helyzete. A gyógyszerek hatásmechanizmusának alapjai. Farmakokinetikai és farmakodinamikai alapfogalmak. A központi idegrendszerre ható gyógyszerek (narkotikumok, nyugtató-altatószerek, szorongásoldók, fájdalomcsillapítók), az antibiotikumok, a vírus és gomba ellenes készítmények, a természetes és szintetikus kemoterápiás készítmények, az inzulin, valamint a szintetikus hipoglikémiás szerek szerkezete, alkalmazása és részletes szintézise általános szerves kémiai ismeretek alapján.										
<i>Képesség:</i>										
Képes a gyógyszerkémia fejlődését, a magyar gyógyszeripar kialakulását és jelen helyzetét érintő szakmai kommunikációban érdemben részt venni.										
Képes a tanultak alapján egyszerűbb szerkezetű gyógyszermolekulák előállítására vonatkozólag szintézisutat tervezni.										
Képes a gyógyszerkémiai ismereteinek kibővítésére/továbbfejlesztésére.										
<i>Attitűd:</i>										
Nyitott arra, hogy a témakörben új, tudományos ismereteket szerezzen és ennek a tudásnak a birtokában felismerje a megalapozatlan, esetleg hibás állításokat.										
<i>Autonómia és felelősség:</i>										
Szakmai irányítás mellett képes a kurzusban szereplő témakörök alapján megadott részfeladatokat önállóan elvégezni, szintézis tervet készíteni adott gyógyszermolekulák előállítására vonatkozólag irodalmi analógiák alapján.										
A kurzus tartalma, témakörei										
<ul style="list-style-type: none"> - A gyógyszerkémia fejlődésének története - A magyar gyógyszeripar kialakulása - A gyógyszerkutató mai helyzete - A farmakológia legfontosabb alapfogalmai - A központi idegrendszerre ható gyógyszerek (narkotikumok, nyugtató-altatószerek, szorongásoldók, fájdalomcsillapítók). - Az antibiotikumok csoportosítása, szerkezete, előállítása. - Antivirális készítmények szerkezete, előállítása. - Gombaellenes hatóanyagok szerkezete, előállítása. - Természetes és szintetikus kemoterápiás szerek szerkezete és előállítása. 										

- A cukorbetegség kezelésében alkalmazható hatóanyagok szerkezete és előállítása.
Tervezett tanulási tevékenységek, tanítási módszerek
- Aktív részvétel az órákon
Értékelés
Órai munka (10 %) Kollokvium (90 %) Jeles: 90 %, jó: 75 %, közepes 60 %, elégséges: 50 %, 50 % alatt elégtelen - A tantárgyat írásbeli kollokvium zárja. A kollokvium sikertelensége esetén javítás, utóvizsga keretében történhet, a TVSZ-ben meghatározottak szerint.
Kötelező olvasmány:
Az előadás ábra anyaga.
Ajánlott szakirodalom:
1. Tőke László, Szeghy Lajos: Gyógyszerkémia I-II, Tankönyvkiadó, Budapest, 1992 2. Szász György, Takács Mihály, Végh Antal: Gyógyszerészi kémia 1-2 kötet, Medicina, Budapest, 1990 3. Bernáth Gábor: Gyógyszerészi kémia I-III, Egyetemi jegyzet, Szeged, 1990-1992 4. Sztaricskai Ferenc: A gyógyszerészi kémia alapjai I-III. Debrecen University Press, Debrecen, 2007 5. M. J. Neal: Rövid farmakológia, A 3. átdolgozott, bővített kiadás magyar kiadása, B+V (medical&technical) Lap- és Könyvkiadó kft., 2000 6. Ruben Vardanyan and Victor Hruby: Synthesis of Essential Drugs Elsevier, 2006

Heti bontott tematika	
1. hét	A gyógyszerkémia fogalma. A gyógyszerkémia története, fejlődése. <hr/> TE: A gyógyszerkémia fejlődés történetének ismerete.
2. hét	A magyar gyógyszeripar és gyógyszerkutatás. A gyógyszerkutatás mai helyzete és problémái. A gyógyszerek előállítása. A gyógyszeres terápia kockázata, költségei. <hr/> TE: A magyar gyógyszeripar kialakulásának és a gyógyszerkutatás mai helyzetének ismerete.
3. hét	A gyógyszerek hatásmechanizmusának alapjai. Farmakokinetikai és farmakodinamikai alapfogalmak; Gyógyszer-receptor kölcsönhatás Gyógyszerfelszívódás, -megoszlás és -kiválasztás Gyógyszermetabolizmus A gyógyszerek felosztása és megítélése szempontjából fontos fogalmak definiálása. A gyógyszerek csoportosítása hatásuk szerint. <hr/> TE: A gyógyszerek hatásmechanizmusára vonatkozó fogalmak ismerete. A gyógyszerek felosztása és megítélése szempontjából fontos fogalmak és a gyógyszerek hatás szerinti csoportosításának ismerete.
4. hét	A központi idegrendszer gyógyszerei; nyugtatók. Az emberi idegrendszer anatómiai-funkcionális felosztása. Az idegrendszeri elváltozások, betegségek okai. A narkotikumok alkalmazásának történeti áttekintése. Sebészeti narkotikumok: inhalációs és injekciós narkotikumok szerkezete. Inhalációs narkotikumok szintézise. <hr/> TE: Az emberi idegrendszer anatómiai-funkcionális felosztásának, az idegrendszeri elváltozások, betegségek okainak ismerete. A sebészeti narkotikumok szerkezetének és néhány inhalációs narkotikum szintézisének ismerete.

5. hét	<p>Barbitursav származékok, szteroidok, benzodiazepinek és egyéb szerkezetű injekciós narkotikumok szintézise.</p> <hr/> <p>Néhány injekciós narkotikumok szerkezetének és előállításának ismerete.</p>
6. hét	<p>Nyugtató-altatószerek; alkaloidok, alkoholok, glikolok, polialkoholok, aldehidek, uretánok, ureidek szerkezete és szintézise.</p> <hr/> <p>TE: A nyugtató-altatószerként alkalmazott alkaloidok, alkoholok, glikolok, polialkoholok, aldehidek, uretánok, ureidek szerkezetének és szintézisének ismerete.</p>
7. hét	<p>Nyugtató-altatószerek; Barbitursav származékok szerkezete, legfontosabb hatás-szerkezeti összefüggései és előállítása. Dioxo-piperidinek előállítása. A Thalidomid „botrány” Nyugtató-altatószerek, szorongásoldók; benzodiazepinek szerkezete és szintézise.</p> <hr/> <p>TE: A nyugtató-altatószerként alkalmazott barbitursav származékok szerkezetének, legfontosabb hatás-szerkezeti összefüggéseinek és előállításának ismerete. A szorongásoldóként alkalmazott benzodiazepinek szerkezetének és szintézisének ismerete.</p>
8. hét	<p>Fájdalomcsillapítók; major és minor analgetikumok fogalma, hatása. A morfinnak és társalkaloidjainak a mákszalmából történő előállítása (Kabay János világtalálmányá vált felfedezése). Az opioidok hatásának megértésével kapcsolatos fontos felfedezések. Fájdalomcsillapítók; erős fájdalomcsillapítók (opioidok, morfin és félszintetikus származékai, szintetikus morfin analógok) csoportosítása és előállítása.</p> <hr/> <p>TE: Fájdalomcsillapítók; major és minor analgetikumok fogalmának, hatásának ismerete. A morfinnak és társalkaloidjainak a mákszalmából történő előállításának (Kabay János féle módszer) ismerete. Az opioidok hatásának megértésével kapcsolatos fontos felfedezések ismerete. Fájdalomcsillapítók; erős fájdalomcsillapítók (opioidok, morfin és félszintetikus származékai, szintetikus morfin analógok) csoportosításának és előállításának ismerete.</p>
9. hét	<p>Antibiotikumok fogalma, csoportosítása. A β-laktám vázas antibiotikumok: penicillinek, cefalosporinok, monobaktámok szerkezete, hatásmechanizmusa. A penicillinek felfedezése, csoportosítása (természetes és félszintetikus származékok), szintézisük.</p> <hr/> <p>TE: Antibiotikumok fogalmának, csoportosításának ismerete. A β-laktám vázas antibiotikumok: penicillinek, cefalosporinok, monobaktámok szerkezetének, hatásmechanizmusának ismerete. A penicillinek felfedezésének, természetes és félszintetikus származékok előállításának ismerete.</p>
10. hét	<p>Penicillin rezisztencia. Aminoglikozidok, peptid-, makrolid- és policiklusos antibiotikumok szerkezete, hatásmechanizmusa és előállítása.</p> <hr/> <p>TE: Aminoglikozidok, peptid-, makrolid- és policiklusos antibiotikumok szerkezetének, hatásmechanizmusának és előállításának ismerete.</p>
11. hét	<p>Gombaellenes készítmények (poliének, imidazolok, triazolok, allilaminok és egyéb molekulák) hatásmechanizmusa, szerkezete és előállítása.</p> <hr/> <p>TE: Gombaellenes készítmények hatásmechanizmusának, szerkezetének és előállításának ismerete.</p>
12. hét	<p>Vírusok, vírusfertőzések és kezelési lehetőségeik. Vírusellenes készítmények (amantadine, vidarabine, ribavirin stb.) szerkezete és előállítása.</p> <hr/> <p>Vírusellenes készítmények hatásmechanizmusának, szerkezetének és előállításának ismerete.</p>
13. hét	<p>A természetes (növényekből izolált) és szintetikus (purin-, pirimidin származékok, különböző alkilezőszerek, antibiotikumok) kemoterápiás készítmények szerkezete és előállítása.</p> <hr/> <p>TE: Néhány természetes (növényekből izolált) és szintetikus (purin-, pirimidin származékok, különböző alkilezőszerek, antibiotikumok) kemoterápiás készítmény szerkezetének és előállításának ismerete.</p>
14. hét	<p>A cukorbetegség típusai, kialakulásának biológiai háttere, terápiás lehetőségek. Az inzulin és a szintetikus hipoglikémiás szerek szerkezete és előállítása.</p> <hr/> <p>TE: A cukorbetegség típusai, kialakulásának, terápiás lehetőségeinek ismerete. Az inzulin és a szintetikus hipoglikémiás szerek szerkezetének és előállításának ismerete.</p>