

Ábrák jegyzéke

1.1. ábra. A thalidomide szerkezete (a nyugtató hatású R izomer).....	11
1.4.1. ábra. Az antibakteriális hatású gyógyszerek bevezetésének hatása a tüdőgyulladás, illetve tuberkulózis miatt elhunytak számára, százezer lakosra vetítve (PAS: para-amino-szalicilsav, INH: izonikoinsav-hidrazid).....	19
1.4.2. ábra. A magyar nők és férfiak várható élettartamának változása az 1990–2007 időszakban	20
1.4.3. ábra. A prontoszil, a deseptyl, a p-aminobenzoészav és a folsav szerkezete.....	21
1.4.4. ábra. A morfin és a koffein szerkezete	21
1.4.5. ábra. A gyógyszerkutatás egyre bővülő eszköztára és a gyógyszertervezés módszereinek fejlődése.....	22
2.1.1.1. ábra. Néhány egyszerű aminosav	30
2.1.1.2. ábra. A lizin, aszparaginsav és a cisztein szerkezete	30
2.1.1.3. ábra. A glutaminsav és az N-metil-(D)-aszparaginsav szerkezete.....	31
2.1.2.1. ábra. Peptidek általános szerkezete.....	32
2.1.2.2. ábra. A hemoglobin hemrésének dezoxi és oxo formája	32
2.1.2.3. ábra. A proteinek másodlagos szerkezeti elemeinek modelljei (α -hélix és β -redő)	34
2.2.1.1. ábra. Aldózok, ketózok nyílt és gyűrűs formája és néhány gyűrűs cukorszármazék szerkezete.....	36
2.2.1.2. ábra. A D-glükóz gyűrűzáródása α - és β -D-glükózzá egyensúlyi folyamatban (mutarotáció).....	36
2.2.3.1. ábra. A cellulóz fragmense.....	37
2.2.3.2. ábra. A heparin oligoszacharidegysége	38
2.3.1.1. ábra. Az arachidonsav, palmitinsav, sztearinsav, olajsav képlete	39
2.3.2.1. ábra. A glicerol egyszerű zsírsavakkal alkotott kétféle mono- és di-, valamint triészterei.....	40
2.3.3.1. ábra. A szteránváz és a gyűrűanellációk két változata.....	41
2.3.3.2. ábra. Néhány, az emberi szervezetben előforduló (endogén) szteránváz vegyület	41
2.3.4.1. ábra. A geraniol, a (+)-limonén, a kámfor, a mentol és a β -karotin	42
2.3.5.1. ábra. A foszfolipidek általános képlete és a foszfatidil-kolin.....	43

2.4.1. ábra. Lehetséges bázisok, nukleotidegység, a DNS- és RNS-molekulák vázlatos felépítése	44
2.4.2. ábra. Az ATP, ADP, AMP és cAMP szerkezete	45
2.4.1.1. ábra. A DNS kettős spirál.....	47
2.4.1.2. ábra. A génműködés szabályozásának két szintje: a DNS-hez transzkripciós faktorok (TF), az mRNS-hez miRNS-ek kapcsolódnak.....	49
2.4.2.1. ábra. Az RNS-ben található adenin-uracil bázispár és az RNS-hurkok (loopok)	51
3.1.1. ábra. A kis és nagy vérköri keringés fontosabb vércöveinek vázlati rajza. Az egyes helyeken feltüntetett százalékok a szervterületekre eső perctérfogat-megoszlásokat tüntetik fel nyugalmi állapotban. Ez a megoszlás a szöveti működések hatására jelentősen megváltozhat (J: jobb, B: bal, P: pitvar, K: kamra)	55
3.1.2. ábra. Digoxinkészítmények biológiai hasznosíthatósága.....	56
3.1.3. ábra. A piroxicam felszívódása bőrön keresztül, különböző típusú készítményekből.....	57
3.2.1. ábra. A hatóanyag sorsa a tablettától a véráramig.....	59
3.2.2. ábra. A szérumszintértékek ismételt szájon keresztül történő gyógyszeradagolásnál	60
3.2.3. ábra. Aminophylline vérszintértékek 0,5 g hatóanyag intravénás, illetve orális adagolását követően.....	61
3.2.4. ábra. Egykamrás OROS-rendszer	62
3.2.5. ábra. Kétkamrás OROS-rendszer.....	63
3.2.6. ábra. Transzdermális tapasz szerkezete.....	64
4.1.1. ábra. Dózis-hatás görbe folytonosan változó erősségű hatás mérésekor.....	73
4.1.2. ábra. Dózis-hatás összefüggés ábrázolása félogaritmikus diagramban	73
4.1.3. ábra. A letális strofantinadag (LD) meghatározása állatkísérletben, eloszlási hisztogram	74
4.1.4. ábra. Letális strofantinadag (LD) meghatározásának kumulatív eloszlási hisztogramja	75
4.1.5. ábra. Az Atoxyl és a Salvarsan hatóanyagok kémiai szerkezete	76
4.2.1. ábra. Gyógyszerhatóanyag koncentrációjának változása a vérplazmában egyszeri, szájon át történt bevitelét követően.....	80
4.2.2. ábra. Két, azonos hatóanyagot azonos dózisban tartalmazó gyógyszerforma (A és B) vérplazma-koncentráció-idő görbéje	81
4.2.3. ábra. A dietil-barbitursav és a dietil-tiobarbitursav szerkezete.....	81
4.2.4. ábra. Vérplazma-koncentráció-idő görbe ismételt intravénás gyógyszeradagolás során.....	83
4.3.1. ábra. A hisztamin különböző állatokon mért LD ₅₀ -értéke (g/testsúly kg)	84

4.3.2.1. ábra. A chloramphenicol képlete	88
4.3.2.2. ábra. A paracetamol, acetilszalicilsav és a digitoxin szerkezete	90
4.3.2.3. ábra. A 8-azaguanin és 8-azaxantin szerkezete	91
5.2.1. ábra. A szalicilsav és az acetilszalicilsav szerkezete.....	95
5.2.2. ábra. A triptofán, a szerotonin és a melatonin szerkezete.....	96
5.2.3. ábra. A G-penicillin és allergén metabolitja, a penicilloinsav.....	97
5.3.1. ábra. Az A és B gyógyszerhatóanyag kölcsönhatásainak izobolikus ábrázolása (a: potenciózó szinergizmus, b: additív szinergizmus, c: antagonizmus)	98
5.3.2. ábra. Az A anyag dózis-hatás görbéje (b) és ennek változása a B anyaggal kialakuló szinergikus (a), illetve antagonista (c) kölcsönhatás esetén.....	99
5.3.3. ábra. A neostigmine szerkezete és a morfin LD ₅₀ -értékét befolyásoló hatása	99
5.3.4. ábra A kumarin, a dikumarol és szintetikus analogon warfarin szerkezete	100
5.3.5. ábra. Az acetilkolin és az atropin	101
5.3.1.1. ábra. A sulfamethoxazole és a trimethoprim szerkezeti képlete.....	103
5.3.1.2. ábra. Az amoxicillin és a klavulánsav szerkezeti képlete	103
5.3.1.3. ábra. A Quarelin tabletta hatóanyagai.....	104
6.1.1. ábra. A 141 µg/ml szérumsúcsérték eléréséhez szükséges ceftizoxime-adag különböző fajokban	105
6.1.2. ábra. Az emlősejt szerkezete.....	106
6.1.3. ábra. Az emlősejtmembrán szerkezete	107
6.1.4. ábra. Az emlősejtmembrán kettősréteg-szerkezete.....	108
6.1.5. ábra. A sejtmembránt alkotó lipoidok, foszfolipidek legfontosabb elemei.....	109
6.1.6. ábra. A sejtmembrán legfontosabb zsírsavalkotói	110
6.1.7. ábra. A sejtmembrán egyéb lipoidelemei (R: a zsírsavak szénhidrogénlánc).....	111
6.1.8. ábra. Egyes sejtípusok plazmamembránjának lipoid-összetevői.....	112
6.1.9. ábra. Néhány membrántípus összetétele.....	113
6.1.10. ábra. A mitokondrium elektronmikroszkópos képe és szerkezetének vázlata	113
6.1.11. ábra. Az adrenalin β ₂ -receptorának szerkezete	114
6.1.12. ábra. A sejt külseje és belseje közti potenciálkülönbség	115
6.1.13. ábra. Gram-negatív baktérium sejtfalának szerkezete	117
6.1.14. ábra. A Gram-pozitív baktériumok sejtfalának szerkezete.....	117
6.1.15. ábra. A Gram-pozitív baktériumok sejtfalában lévő peptidoglikánlanc szerkezete és a láncok összekötése	118
6.2.1.1. ábra. A 4-n-alkil-rezorcinok fenolkoefficiens-értékeinek változása az alkilcsoport szénatomszámának függvényében	121

6.2.1.2. ábra. Savas és bázisos gyógyszerek felszívódása az emberi gyomorból.....	122
6.2.1.3. ábra. Karrier által közvetített felszívódás kinetikája.....	123
6.2.1.4. ábra. A karrierprotein működése a facilitált diffúzióban	124
6.2.1.5. ábra. A cserediffúzió	125
6.2.2.1. ábra. Az ATP hidrolízisének felszabaduló energia (ADP: adenozin-difoszfát, AMP: adenozin-monofoszfát)	127
6.2.2.2. ábra. A nátriumpumpa vázlata.....	128
6.2.2.3. ábra. Az endocitózis vázlata.....	128
6.3.1. ábra. A tápcsatorna vázlata	130
6.4.1. ábra. A vizek szálalékos megoszlása az emberi szervezetben	135
6.4.2. ábra. Szulfonamidok és a phenylbutazon szerkezete.....	136
6.4.3. ábra. Szíviglikozidok	137
6.5.1. ábra. Az idegsejt és a gliasejt kapcsolata	141
6.5.2. ábra. A morfin és a heroin szerkezete.....	142
7.1.1. ábra. Szénhidrát típusú ozmotikus hashajtók.....	150
7.2.1. ábra. Az acetilkolin (1) és analógjainak – acetiltiokolin (2) és butirilkolin (3) – affinitása és specifikus aktivitása	153
7.2.2. ábra. Rákellenes alkilező szerek kötődése.....	154
7.2.3. ábra. Az acetilkolin nikotin típusú receptorához kapcsolódó néhány ligandum	155
7.2.4. ábra. Hárompontos illeszkedés a receptoron.....	157
7.2.5. ábra. A hárompontos receptor-szubsztrát illeszkedés kialakulása	157
7.2.6. ábra. A receptorprotein lehetséges mozgásainak vázlata.....	158
7.2.7. ábra. Beckett és Casy által elképzelt opiátreceptor vázlata	158
7.2.8. ábra. Az opiátreceptoron kötődő fájdalomcsillapító hatású gyógyszerek.....	159
7.2.9. ábra. A G-fehérje működésének vázlata.....	161
7.2.10. ábra. Ösztadiol- és stilbösztrolszármazékok.....	161
7.2.11. ábra. Enantiomerek eltérő biokémiai hatása	162
8.1.1. ábra. A DER és a SER mikroszkópos képe és vázlata	166
8.1.2. ábra. A CYP-450 oxidációs folyamatának vázlata és a vaskomplex szerkezetének változása	168
8.2.1.1. ábra. Aromás vegyületek és olefinok oxidációja.....	170
8.2.1.2. ábra. Alifás láncok oxidációja.....	171
8.2.1.3. ábra. Aminok oxidációs reakciói	172
8.2.1.4. ábra. Savamidok oxidációja	172
8.2.1.5. ábra. Kénvegyületek oxidációja.....	173
8.2.1.6. ábra. O- és N-alkil vegyületek oxidatív dezalkilezése	174
8.2.1.7. ábra. A MAO működése	175
8.2.1.8. ábra. A DAO működése	175
8.2.1.9. ábra. Az etanol detoxikációja.....	176

8.2.1.10. ábra. Metabolizmus aromatizációval.....	177
8.2.1.11. ábra. Az oxidatív dehalogénezés sémája	177
8.2.2.1. ábra. Olefinek redukciója	178
8.2.2.2. ábra. Kénvegyületek reduktív metabolizmusa	178
8.2.2.3. ábra. Nitrogéntartalmú vegyületek metabolizmusa redukcióval.....	179
8.2.3.1. ábra. Néhány hasonló felépítésű, észter típusú vegyület.....	180
8.2.3.2. ábra. Szubsztituált benzooesamidok eltérő hidrolízissebessége.....	181
8.2.3.3. ábra. Nitrilek metabolizmusa	181
8.2.3.4. ábra. Hidantoinok metabolizmusa	182
8.2.3.5. ábra. Halogénvegyületek hidrolízise.....	182
8.2.4.1. ábra. A hesperidin metabolizmusa	183
8.2.4.2. ábra. Diosmetin és quercetin eltérő metabolitikus útja patkányban.....	184
8.2.4.3. ábra. A benzol humán metabolizmusa.....	184
8.2.4.4. ábra. A nikotin metabolizmusa	185
8.3.1. ábra. A konjugációs reakciók összefoglalása	186
8.3.1.1. ábra. A glükuronidképződés vázlata.....	187
8.3.1.2. ábra. A szubsztrát kapcsolódási helye a glükuronsavhoz O-glükuronidoknál.....	188
8.3.1.3. ábra. A szubsztrát kapcsolódási helye a glükuronsavhoz N-, S- és C-glükuronidoknál.....	189
8.3.1.4. ábra. A hem lebomlási sémája.....	190
8.3.2.1. ábra. A szulfátkonjugáció sémája.....	191
8.3.3.1. ábra. Az aminosav-konjugáció sémája.....	193
8.3.4.1. ábra. A glutationkonjugáció vázlata	194
8.3.4.2. ábra. Különböző glutationkonjugátumok.....	195
8.3.4.3. ábra. A naftalin konjugációja glutationnal.....	196
8.3.4.4. ábra. Szabadgyökök és szuperoxid-képződmények keletkezése	196
8.3.4.5. ábra. A paracetamol detoxikációja glutationnal	197
8.3.5.1. ábra. Az acetilkonjugáció vázlata	198
8.3.6.1. ábra. A metilezési konjugáció vázlata.....	198
8.4.1. ábra. A plazmaizoniazid- (INH-) koncentráció eloszlási hisztogramja 267 genetikailag sérült családból származó egyén adatai alapján	200
8.5.1. ábra. A proadifen szerkezete.....	203
8.6.1.1. ábra. Példák prodrug aktív anyaggá történő átalakulására.....	204
8.6.2.1. ábra. Példák lágy gyógyszerekre.....	206
9.1.1. ábra. A vese	210
9.1.2. ábra. A vese frontális metszete	210
9.1.3. ábra. Egy 27 éves férfi veséjének mikroszkopikus képe	211
9.1.4. ábra. A vese belső felépítésnek vázlata	212
9.1.5. ábra. A vesetestecske (Malpighi-test) vázlata	213

9.1.6. ábra. A tubulusok fontosabb transzportfolyamatai	215
10.2.1.1.1. ábra. Néhány vízdékonyságot növelő, sóképző karbonsav és amin. Szaggatott vonalakkal jelöltük a H-híd-akceptorokat (keskeny) és donorokat (széles)	225
10.2.1.1.2. ábra. A chloramphenicol nátrium-szukcinát származékának előállítása.....	227
10.2.1.1.3. ábra. Hidroxilcsoportokat tartalmazó oldalláncok beépítése teofillinbe	228
10.2.1.1.4. ábra. A metronidazole 4-morfolinometil-benzoátjának előállítása.....	228
10.2.2.1.1. ábra. Merev szerkezeti egységeket (keretekkel kiemelve) tartalmazó gyógyszerek hatóanyagok	229
10.2.2.1.2. ábra. Az acetilkolin és a receptorain kötődő muszkarin és nikotin szerkezete.....	230
10.2.3.1.1. ábra. A chlorpromazine és a clomipramine szerkezete.....	232
10.2.3.1.2. ábra. A paracetamol és gyűrűn dimetilezett származéka	232
10.2.3.1.3. ábra. A clonidine és analógiájának szerkezete, valamint ED ₂₀ -értékeik	233
10.2.3.2.1. ábra. Klasszikus izosztercsoportok (az egy sorban lévők helyettesíthetik egymást)	234
10.2.3.2.2. ábra. Néhány bioizoszter-csoport (az egy sorban lévők helyettesíthetik egymást)	234
10.2.3.2.3. ábra. A hipoxantin és a merkaptopurin képlete.....	235
10.4.2.1.1. ábra. Egy huszonhét tagú molekulakönyvtár létrehozása kombinatorikus kémiai módszerrel.....	246
11.1.1.1.1. ábra. Acetanilid típusú lázcsillapítók.....	250
11.1.1.1.2. ábra. A phenacetin metabolizmusa	251
11.1.1.2.1. ábra. Pirazolonszármazékok.....	252
11.1.1.3.1. ábra. Piridopirimidin típusú fájdalomcsillapító	253
11.1.2.1.1. ábra. A prosztaglandinok szerkezete és elnevezése	257
11.1.2.1.2. ábra. Az arachidonsav-kaszád néhány eleme.....	258
11.1.2.1.3. ábra. A gyulladás néhány mediátora	262
11.1.2.2.1.1. ábra. A szalicilsav metabolizmusa	265
11.1.2.2.1.2. ábra. Gyógyszerekben alkalmazott szalicilsav-származékok	266
11.1.2.2.1.3. ábra. A szalicilsav 5-(2,4-difluorfenil)-származéka.....	266
11.1.2.2.1.4. ábra. Néhány akril-alkánsav típusú gyulladáscsökkentő.....	267
11.1.2.2.1.5. ábra. Néhány fenamát típusú gyulladáscsökkentő	269
11.1.2.2.1.6. ábra. Fontosabb oxikámok.....	270
11.1.2.2.1.7. ábra. Pirazolonszármazékok.....	271
11.1.2.2.1.8. ábra. Néhány „coxib” típusú COX-2-gátló	273
11.1.2.2.1.9. ábra. Néhány gyulladáscsökkentő farmakológiai profilja	274

11.1.2.2.1.10. ábra. A rutin szerkezete	275
11.1.2.2.2.1. ábra. Antireumatikumok	276
11.1.2.2.3.1. ábra. A húgysav bioszintézise és metabolizmusa.....	277
11.1.2.2.3.2. ábra. Köszvényellenes gyógyszerek	278
11.2.1.1. ábra. A fájdalom fontos mediátoranyagai.....	281
11.2.1.2. ábra. Macska bőrrafferenséről levezethető akciós potenciálok fokozódó erősségű ingerek hatására. A: 3 g; B: 43 g; C: 99 g súllyal terhelt tű szúrása után	282
11.2.2.1.1. ábra. A morfin és az enkefalin szerkezeti hasonlósága	283
11.2.2.1.2. ábra. Az endorfinok és a β -lipotropin kapcsolata.....	284
11.2.2.1.3. ábra. Az opiátoreceptorok főbb típusai	285
11.2.2.1.4. ábra. A fájdalomküszöb szabályozása a gerincvelőben.....	285
11.2.2.1.5. ábra. A morfin és néhány származéka.....	286
11.2.2.2.1. ábra. A morfin kémiai szerkezetéből levezethető erős hatású fájdalomcsillapítók.....	289
11.3.1. ábra. A Salvarsan feltételezett szerkezete felül és a 2005-ben publikált trimer és pentamer molekulák felépítése	292
11.3.1.1. ábra. A hexachlorophene-, neomagnol- és betadin- hatóanyagok.....	295
11.3.2.1.1. ábra. A folsavciklus	297
11.3.2.1.2. ábra. Szulfonamid típusú gyógyszerhatóanyagok	297
11.3.2.1.3. ábra. A trimethoprim szerkezete	298
11.3.2.2.1. ábra. A penicillin alapváza és néhány félszintetikus származékban található módosító csoport.....	299
11.3.2.2.2. ábra. A klavulánsav szerkezete	300
11.3.2.2.3. ábra. A cefalosporin és származékai.....	301
11.3.2.2.4. ábra. Monobaktámok általános szerkezeti képlete	302
11.3.2.5.1. ábra. A doxycycline és oxytetracycline szerkezete.....	303
11.3.2.7.1. ábra. A nalidixsav, norfloxacin, ciprofloxacín, levofloxacin és moxifloxacin szerkezete.....	304
11.3.2.8.1. ábra. A metronidazole szerkezete	305
11.3.2.9.1. ábra. Néhány egyszerű szerkezetű, a tbc kórokozója ellen használatos hatóanyag.....	306
11.4.1. ábra. Az ergoszterin szerkezete	308
11.4.1.1. ábra. A gombák sejtfalába épülő ergoszterin bioszintézise és a szintézist befolyásolni képes hatóanyag típusok.....	308
11.4.1.2. ábra. A terbinafine és a naftifine szerkezete.....	309
11.4.1.3. ábra. A ketoconazole, a fluconazole és a voriconazole szerkezete	310
11.4.3.1. ábra. Néhány gombaölő hatású fenolszármazék szerkezete	311

Táblázatok jegyzéke

1.1. táblázat. A forgalomba került akirális és királis gyógyszer-hatóanyagok megoszlása az 1983–2000 közötti időszakban	11
1.5.1. táblázat. Egy gyógyszer fejlesztési költsége 2001-ben (2000-es árfolyamon, millió dollárban)	26
1.5.2. táblázat. A hagyományos kismolekulák és a biotechnológiai gyógyszerek K+F összköltségei 1995-ben és 2005-ben (milliárd dollárban).....	26
9.1.1. táblázat. Gyógyszerek fehérjekötődése és ürülési sebessége.....	215
10.2.3.3.1. táblázat. Néhány jellegzetes szubsztituens π -hidrofobitás paraméterei különböző alapvegyületekben	237