

Debreceni Egyetem Orvos- és Egészségtudományi
Centrum

Gyógyszerészi Kémiai Tanszék

Dr. Gunda Tamás

Dr. Sztaricskai Ferenc

A GYÓGYSZERÉSZI KÉMIA ALAPJAI III.

Fertőtlenítőszeres, antibiotikumok és
kemoterapeutikumok, tumorelleses gyógyszeres



Debrecen, 2007. november

TARTALOMJEGYZÉK

1	FERTŐTLENÍTŐSZEREK.....	1
1.1	Alkoholok.....	2
1.2	Aldehidek.....	3
1.3	Fenolok.....	3
1.4	Karbonsavak.....	6
1.5	Halogének és halogéntartalmú szerek, egyéb nemfémek és származékaik.....	8
1.6	Oxidálószerke.....	9
1.7	Nehézfémsók és -vegyületek.....	10
1.8	Szappanok és invertsappanok, felületaktív anyagok.....	11
1.9	Különbéféle festékek.....	13
2	KEMOTERÁPEUTIKUMOK ÉS ANTIBIOTIKUMOK.....	15
2.1	SZINTETIKUS ANTIMIKROBIÁLIS SZERKE.....	17
2.1.1	Szulfonamidok és folát redukáz inhibitorok.....	17
2.1.2	Kinolon-karbonsavak (fluorkinolonok).....	25
2.1.3	Nitrofurán származékok.....	32
2.1.4	Nitroimidazol származékok.....	33
2.1.5	Oxazolidinon származékok.....	34
2.1.6	Szintetikus antituberkulotikumok (antituberculotica).....	35
2.1.7	Szintetikus gombaellenes (antifungális) gyógyszerek.....	40
2.1.7.1	Egyszerű savak és savszármazékok.....	41
2.1.7.2	Imidazolgyűrűs antimikotikumok.....	42
2.1.7.3	Triazol-csoportot tartalmazó antimikotikumok.....	46
2.1.7.4	Allilamin származékok.....	48
2.1.7.5	Egyéb szerkezetű antimikotikumok.....	49
2.2	ANTIBIOTIKUMOK.....	52
2.2.1	Aminosav- és peptid-típusú antibiotikumok.....	55
2.2.1.1	Egyszerű aminosav származékok.....	55
2.2.1.2	Peptidek, ciklopeptidek, lipo-, gliko- és depsiptidek.....	56
2.2.2	Béta-laktám antibiotikumok.....	67
2.2.2.1	Természetes penicillinek.....	68
2.2.2.2	Félszintetikus penicillinek, 6-amino-penicillánsav.....	74
2.2.2.3	Penicillin aktívészterek.....	80
2.2.2.4	Béta-laktamáz enzimek és enzimgátlók.....	81
2.2.2.5	Természetes kefalosporinok.....	83
2.2.2.6	Félszintetikus kefalosporinok.....	85
2.2.2.7	Kefamicinek.....	96
2.2.2.8	1-Oxa-kefalosporinok.....	97
2.2.2.9	Monociklusos béta-laktámok.....	98
2.2.2.10	Karbapenémvázas antibiotikumok.....	99
2.2.2.11	Béta-laktám antibiotikumok és egyéb sejtfal szintézist gátló antibiotikumok hatásmechanizmusa.....	102
2.2.3	Aminoglikozid (aminociklitol) antibiotikumok.....	104
2.2.3.1	Oligoszacharid típusú aminoglikozidok.....	106
2.2.3.2	Pszedo-oligoszacharid szerkezetű aminoglikozidok.....	109
2.2.3.3	Egyéb aminoglikozid antibiotikumok.....	117
2.2.3.4	Az aminoglikozidok és egyéb fehérjeszintézist gátló antibiotikumok hatásmechanizmusa.....	117
2.2.3.5	Az aminoglikozid antibiotikumokkal szembeni rezisztencia.....	121
2.2.4	Linkozaminidek.....	123
2.2.5	Makrolid antibiotikumok.....	126

2.2.5.1	Nem polién szerkezetű makrolidok	127
2.2.5.2	Polién szerkezetű makrolidok	137
2.2.5.3	Anza-makrolid antibiotikumok	141
2.2.6	Tetracén (naftacén)-vázis antibiotikumok.....	146
2.2.7	Egyéb szerkezetű antibiotikumok.....	153
2.3	VÍRUSELLENES GYÓGYSZEREK	157
2.3.1	Herpeszvírusok családja elleni szerek	162
2.3.2	Hepadnavírusok elleni szerek.....	169
2.3.3	Flavi- és paramyxovírusok elleni szerek	170
2.3.4	Influenzavírus ellenes szerek.....	171
2.3.5	Retrovírusok – AIDS (HIV) elleni vegyületek	173
2.3.5.1	Adszorpciógátló szerek	175
2.3.5.2	Nukleozidanalóg típusú reverz transzkriptáz gátlók.....	176
2.3.5.3	Nem nukleozid-analóg típusú reverz transzkriptáz-gátlók	178
2.3.5.4	HIV-proteáz gátlók.....	179
2.3.6	Interferon	181
2.4	PROTOZOONOKRA HATÓ SZEREK	182
2.4.1	Malária.....	183
2.4.1.1	Kinin és rokon alkaloidok	184
2.4.1.2	Aminokinolin és aminoakridin származékok	186
2.4.1.3	Biguanidinek és diamino-pirimidinek, szulfa-anyagok, antifolátok	190
2.4.1.4	Egyéb antimaláriás szerek.....	191
2.4.2	Tripanosomiázis.....	193
2.4.3	Leishmaniázis.....	194
2.4.4	Amőbiázis.....	195
2.4.5	Trichomoníázis	196
2.4.6	Toxoplazmózis	196
2.4.7	Kriptosporidiózis, giardiázis.....	196
2.5	FÉREGŰZŐ ÉS FÉREGÖLŐ SZEREK (ANTELMINTIKUMOK)	197
2.5.1	Fonalféreg (nematoda) fertőzések gyógyszerei	198
2.5.2	Szalag- és galandférgek (cestodák) és szívóférgek, mótelyek (trematodák) elleni szerek.....	203
2.6	EKTOPARAZITA ELLENES SZEREK	205
3	A DAGANATOS BETEGSÉGEK GYÓGYSZEREI	207
3.1	ANTIMETABOLITOK – A NUKLEINSAV ANYAGCSERÉRE HATÓ SZEREK	211
3.1.1	Folsav-analógok	211
3.1.2	Purin-analógok	213
3.1.3	Pirimidin-analógok	213
3.2	BIOLÓGIAI ALKILEZŐSZEREK.....	218
3.2.1	Nitrogénmustár származékok	219
3.2.2	Nitrózourea származékok és hasonló hatású anyagok	222
3.2.3	Egyéb alkilezőszer típusú anyagok.....	224
3.3	HORMONHATÁSÚ TUMORELLENES SZEREK.....	225
3.3.1	Antiandrogének:	226
3.3.2	Ösztrogének	227
3.3.3	Antiösztrogének:.....	227
3.3.4	Aromatáz inhibitorok:	229
3.3.5	Gesztrogének:	230
3.4	KOMPLEXKÉPZŐ HATÁSÚ CITOTOXIKUS ANYAGOK	232
3.4.1	Mikrotubulusokra ható szerek	232
3.4.1.1	Kolchicin.....	232
3.4.1.2	Vinka-alkaloidok.....	232

3.4.1.3	Taxánok.....	233
3.4.1.4	A kolchicin, a vinka-alkaloidok és a taxánok hatásmechanizmusa	235
3.4.2	DNS komplexképzők.....	235
3.4.2.1	Platinakomplexek.....	235
3.4.2.2	DNS interkalátorok	238
3.5	ANTITESTEK, IMMUNKONJUGÁTUMOK, SPECIFIKUS SZIGNÁLTRANSZFER INHIBITOROK.....	247
3.5.1	Tirozinkináz enzim gátlása	248
3.5.2	Angiogenezis inhibitorok	253
3.5.3	Immunkonjugátumok	255
3.6	SPECIFIKUS VÉDŐANYAGOK, SZUPPORTÍV TERÁPIA.....	255
4	INDEX.....	257