

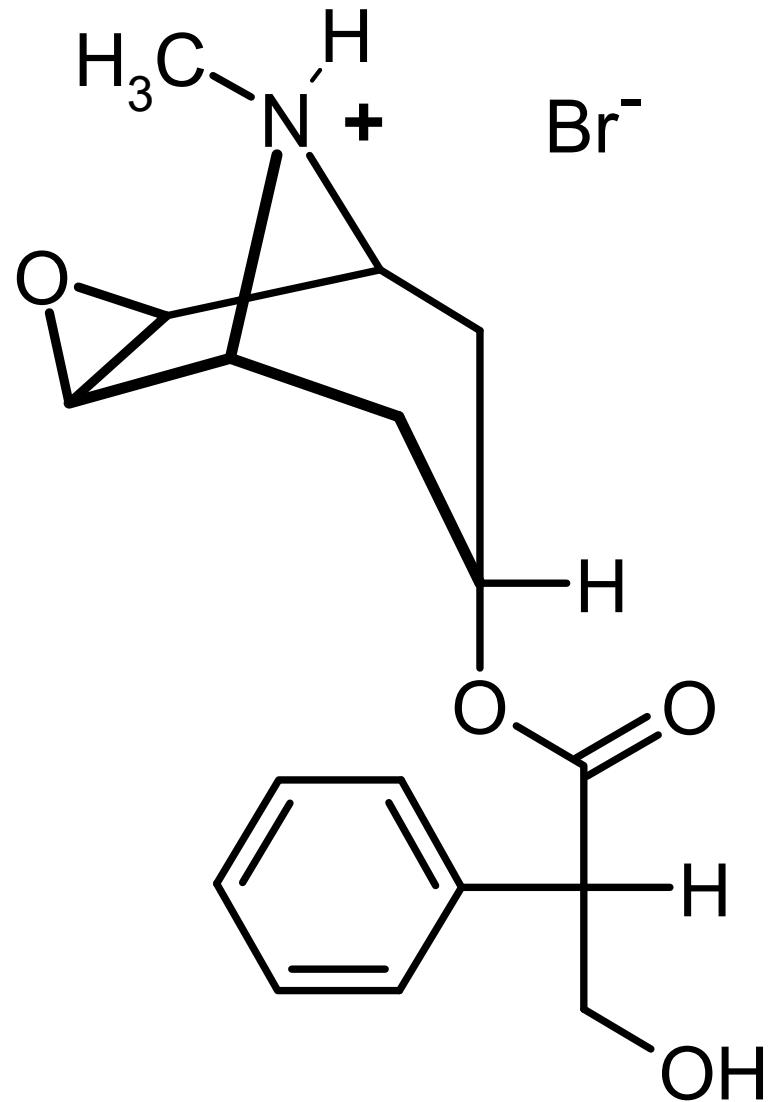
Merkmale eines idealen Arzneistoffs

- Stabilität:
 - nicht oxidationsempfindlich, luftstabil; licht/UV-stabil
 - säurestabil; nicht hydrolyseempfindl.
- Pharmakokinetik:
 - amphiphil wg. Lösl.keit im Wäßrigen u. in Zellmembranen
 - nicht zu schnelle Metabolisierung oder gar nicht, aber er muß ausscheidbar sein
 - keine tox. Abbauprodukte (in-vitro- u. in-vivo-Metabolismusstudien mit Herstellung der Metabolite)
- Pharmakodynamik:
 - strukturähnл. mit körpereigenen Substraten
 - spezif., d.h. Interaktion mit einem/wenigen molekularen Targets
 - idealerweise tägl. 10 mg → keine unsepfzif. Tox., galen. gut verarbeitbar, einfachere Synthese/Reinigung; ↔ HWZ 5-8 h
→ Wirkung am Enzym/Rezeptor: Gewebekonz. Arzneistoff im mikromolaren Bereich → Wirkkonz. im nano- bis mikromolaren Bereich
- Synthesierbarkeit:
 - wenige/keine Asymmetriezentren, auch weil jedes Enantiomer einzeln analyt., toxikol. u. pharmakodynam. getestet werden muß

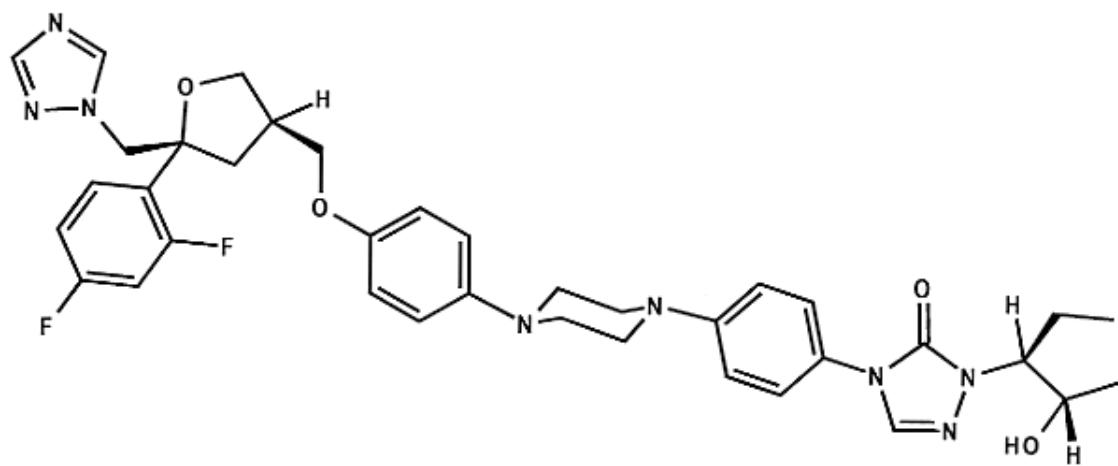
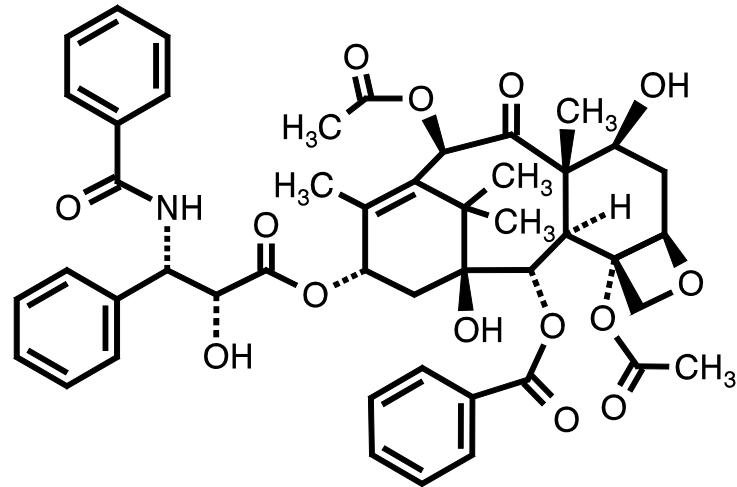
Merkmale eines idealen Arzneistoffs

- einigermaßen wasserlöslich, vor allem bei ca. pH 7 (Blut, Körperflüssigkeiten)
- löslich in Membranen (Lipophilie)
- Verteilungskoeffizient Wasser/Octanol
- geeignete Metabolisierungsgeschw.keit zB Leberzellpräparationen, HPLC; Ziel: HWZ für 1-2mal tägl. Einnahme, d.h. ca. 5-6 h
- nicht toxisch
- wirksam: Organpräparation od. Zellmodell od. Zellorganellpräparation od. Enzyme/Rezeptoren/Ionenkanäle etc. (= in-vitro-Assays) liefert Daten über Wirksamkeit → wirksame Konzentrationen: im Blut bei normalen Arzneistoffen ca. 1-50 µg/mL. Ziel bei in-vitro-Assays: ca. 1 ng/mL biochemische "Wirksamkeit".
- Biochem. Wirksamkeit:
 - bei Organpräparationen eine sichtbare/meßbare Veränderung od. eine Konz.-änderung eines physiolog. Stoffes
 - bei Enzymen, Rezeptoren: Änderung einer Konz. od. Bildungsgeschwindigkeit eines Stoffes

Scopolamin-HBr



Naturstoff oder synthetisch?



Körpereigene Moleküle, die "Vorlage" für Arzneistoffe sein können

Biomimetische Arzneistoff-Strukturen

