

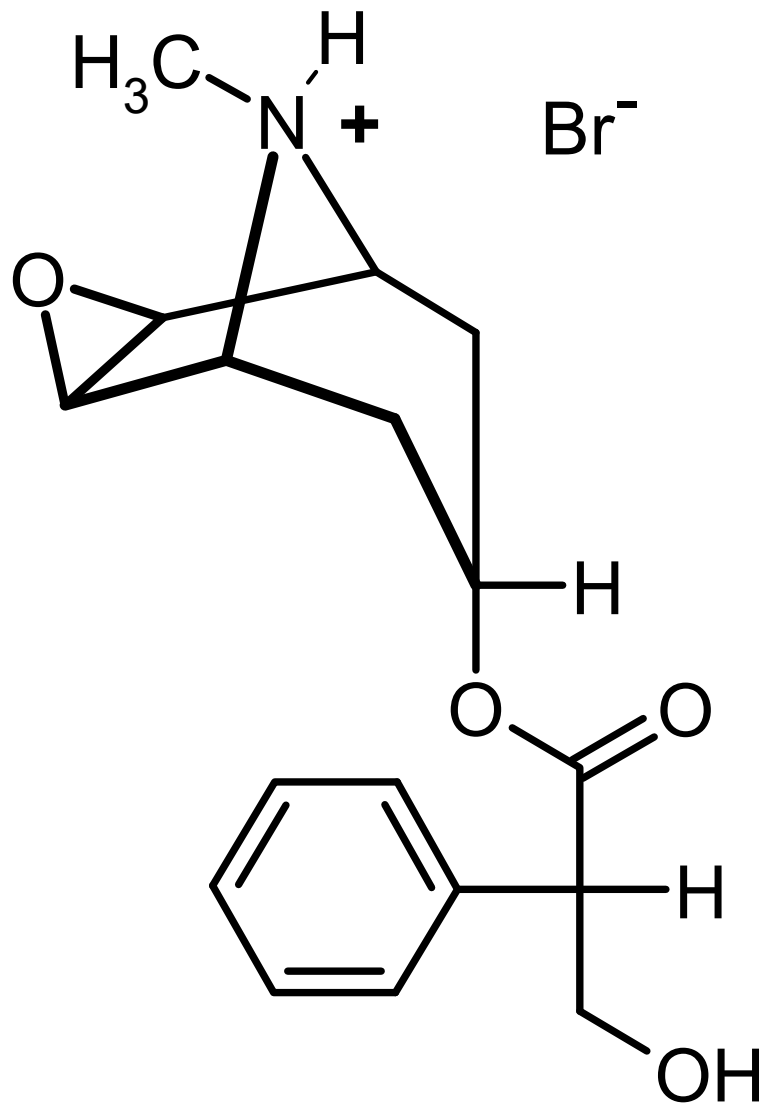
# Merkmale eines idealen Arzneistoffs

- 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:
  - strukturähnl. mit körpereigenen Substraten
  - spezif., d.h. Interaktion mit einem/wenigen molekularen Targets
  - idealerweise tägl. 10 mg → keine unsepszif. Tox., galen. gut verarbeitbar, einfachere Synthese/Reinigung;  $\leftrightarrow$  HWZ 5-8 h
  - Wirkung am Enzym/Rezeptor: Gewebekonz. Arzneistoff im mikromolaren Bereich → Wirkkonz. im nano- bis mikromolaren Bereich
- Synthetisierbarkeit:
  - wenige/keine Asymmetriezentren, auch weil jedes Enantiomer einzeln analyt., toxikol. u. pharmakodynam. getestet werden muß

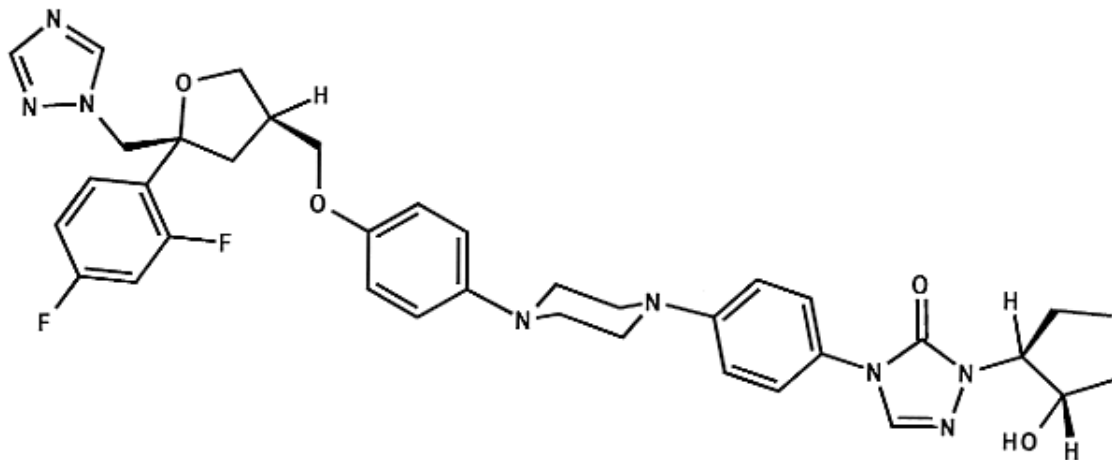
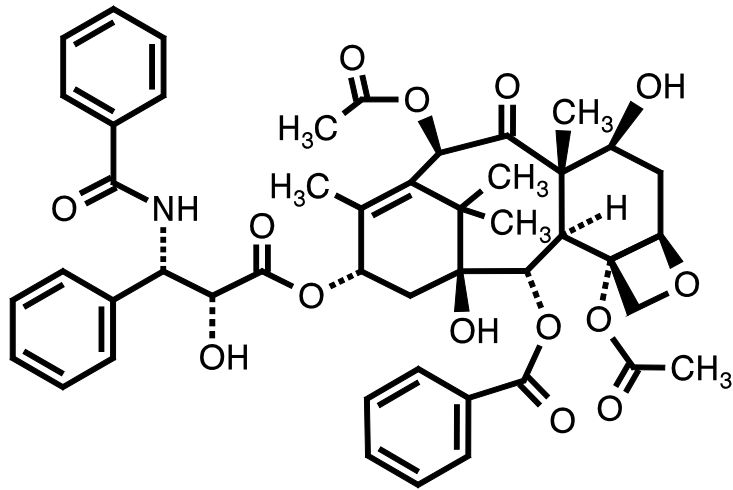
# Merkmale eines idealen Arzneistoffs

- 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

