

GYÓGYSZERÉSZET SUPPLEMENTUM

A MAGYAR GYÓGYSZERÉSZTUDOMÁNYI TÁRSASÁG LAPJA

Megőrzött hagyományok,
harmadik évezredi kihívások

CONGRESSUS
PHARMACEUTICUS
HUNGARICUS
XV.

1924 – 2014

Tempora mutantur
et nos mutamur in illis!

A TARTALOMBÓL

Elnöki köszöntő

*Az MTA elnökének
köszöntője*

*A Kongresszus
támogatói*

*Az előadótermek
elnevezése*

Az előadások jegyzéke

*Plenáris előadás
összefoglalók*

Előadás összefoglalók

*Posztterek
összefoglalói*

Előadói indexek

2014/4. Suppl. I.

LVIII. ÉVFOLYAM
2014. ÁPRILIS
SUPPLEMENTUM I.
ISSN 0017-6036



IRODALOM

1. F. Fülöp, I. Szatmári, J. Toldi, L. Vécsei: Modifications on the carboxylic function of kynurenic acid. *J. Neural. Transm.*, 119, 109-114 (2012). – 2. L. Vécsei, D. Zádori, P. Klivényi, F. Fülöp, I. Szatmári, J. Toldi, T. Freund, G. Nyíri, A. Szőnyi: Use of kynurenic acid amide derivatives for the treatment of Huntington's disease. *PCT Int. Appl.* (2012), WO 2012/001438 A1 – 3. L. Vécsei, L. Szalárdy, F. Fülöp, J. Toldi: Kynurenines in the CNS: recent advances and new questions. *Nature Rev. Drug Disc.* 12, 64-82 (2013). – 4. M. Pihlavisto, D. Smith, A. Juhakoski, F. Fülöp, L. Lázár, I. Szatmári, F. Miklós, Z. Szakonyi, L. Kiss, M. Palkó: New pyridazinone and pyridone compounds *PCT Int. Appl.* (2012), WO 2012/120195 A1 – 5. E. Bligt-Lindén, M. Pihlavisto, I. Szatmári, Z. Otwinowski, D. J. Smith, L. Lázár, F. Fülöp, T. A. Salminen: Novel pyridazinone inhibitors for vascular adhesion protein-1(VAP-1): Old target-new inhibition mode. *J. Med. Chem.*, 56, 9837-9848 (2013).

SZTE, Gyógyszerkémiai Intézet, Szeged

PI-4

**A gyógyító növényektől
a növényi eredetű gyógyszerekig:
hazai és nemzetközi trendek és perspektívák**

Hohmann Judit

A gyógynövények felhasználása a gyógyászatban és az egészségmegőrzésben rendkívüli népszerűségnek örvend napjainkban, a köztudatban azonban a gyógynövényekkel való gyógyítás elsősorban a gyógyszeres terápia alternatívájaként vagy kiegészítőjeként él. A nagyszámú étrendkiegészítőnek és MLM, valamint internetes csatornákon forgalmazott terméknek köszönhetően a közvélekedés a gyógynövényeket nem tekinti a gyógyszerek közé tartozónak, és gyakran még a szakemberek sem rendelkeznek pontos információval arról, hogy a gyógynövényekből fejlesztett készítmények között gyógyszerek is vannak. Ezek a termékek (gyógyszerek, hagyományos növényi gyógyszerek) lehetnek növényi extraktumot, tisztított vagy tiszta növényi hatóanyagot tartalmazó készítmények, melyek engedélyezésük során ugyanolyan szigorú gyógyszerhatósági értékelésnek mennek keresztül mint a szintetikumok. A (gyógy)növények közvetlen felhasználásán túlmenően a növényi vegyületek a gyógyszeripari kutatások területén is igen fontosak, mivel kiindulási anyagként vagy modellként szolgálnak a szintetikus kémia számára új gyógyszerek tervezésénél. A természetes vegyületek páratlan szerkezeti diverzitásuknak, meglepő, gyakran igen komplex szerkezetüknek köszönhetően mind a mai napig jelentős szerepet játszanak gyógyszerfejlesztésekben. Kutatásuk számos esetben etnofarmakológiai ismeretekből indul ki, és kromatográfiás elválasztások sora vezet el a hatáshordozó molekulák azonosításához. A növényekből, állatokból felfedezett vegyületek sokszor új kémiai prototípust képviselnek a gyógyszerkutatás számára, és farmakológiai vizsgálatuk gyakran eredményezi új hatásmechanizmusok felfedezését. Jelen előadás az utóbbi két évtizedben a növényi gyógyszerkutatás területén bekövetkezett új irányzatokról, eredményekről, specifikumokról és lehetőségekről kíván

áttekintést nyújtani. Példákkal illusztrálva bemutatja a természetesanyag-kutatáson alapuló gyógyszerfejlesztések főbb stratégiáit és beszámol olyan sikerekről, amelyek súlyos, korábban nem kezelhető betegségek hatékony terápiáját tették lehetővé. Rámutat arra, hogy a természetes anyagok kutatása számára még óriási tartalékok állnak rendelkezésre, hiszen a természet kémiai vizsgálatára igen alacsony mértékű.

SZTE, Farmakognóziái Intézet, Szeged

PI-5

**A célzott biológiai terápiaik térhódítása:
az oldallánc teória újrafelfedezése**

Holló Zsolt

A biológiai terápiaik széles tárházából az elmúlt 5 évben előretörő célzott terápiaikra, ezen belül is az antitest alapú célzott terápiaikra fókuszál ez az előadás. A célzott biológiai terápiaik alapját Paul Erlich vetítette előre elhíresült oldallánc teóriájával, amely szerint az antitoxinok kulcs-zár szerű illeszkedéssel, a toxinokkal összekapcsolódva fejtik ki védő funkciójukat. A legújabb kutatás-fejlesztési eredmények révén ehhez a klasszikus teóriához kanyarodunk vissza: hogyan tudjuk optimalizálni ezeket a kölcsönhatásokat a nagyobb specificitás vagy a funkcionalitás növelése érdekében? A terápiaik antitestek fejlesztése izgalmas és szerteágazó irányokba tart. A hagyományos antitesteket felváltják az antitest-toxin (ADC) konjugátumok, ezen belül is a célzott oldalláncokon és többszörösen konjugált antitestek. A kedvezőbb tulajdonságokkal rendelkező alapszerkezetek, ún. biobetter antitestek fejlesztői a terápiaik antitest kedvező tulajdonságait megtartva optimalizálják az egyéb (pl. kedvezőtlenebb immunogenitási) tulajdonságokat. Az antitestek glikozilációs helyeit ún. glycoengineering módszerekkel módosítják. A szerkezeti változatosság kihasználásával több epitóp kötésére alkalmas hibrid struktúrák hozhatók létre (pl. bispecifikus antitestek). Terápiaik célokra kiválóan alkalmazhatók 'csökkentett méretű' szerkezetek is, egy doménből álló antitestek (vagy Nanobody-k) klinikai kipróbálása számos hematológiai, gyulladáscsökkentő, neurológiai, infektológiai, onkológiai indikációban folyik. Megjelentek az Európai Gyógyszerügynökség szigorú elvárásainak megfelelő biohasonló antitestek is, számos képviselőjük a klinikai fejlesztés előrehaladott stádiumában van. A komplex fehérjék és antitestek fejlesztésében tapasztalható forradalmi újdonságokat az analitikai módszerek robbanásszerű fejlődése alapozta meg. Az elmúlt 3 évben minőségileg új szintet képviselő új folyadékromatográfiás, elektroforetikus és tömegspektroszkópiás rendszerek váltak hozzáférhetővé (pl. kapilláris elektroforézissel kombinált tandem tömegspektroszkópia /CESI MS/MS). Ezek a módszerek a teljes felfedezési, nem-klinikai és klinikai fejlesztési programot, valamint a gyártást is támogatják. Például az antitest-toxin konjugátumok esetében a célzottan végzett konjugáció ellenőrzése, a heterogenitás jellemzése; a stabilitásra, oldékonyagra és farmakokinetikára gyakorolt hatások jellemzése mind state-of-the-art analitikai módszereket igényelnek.

Egis Gyógyszergyár Nyrt., Budapest