

Gyógyszeripari kutatás és fejlesztés

1 félév, heti 2 óra

Tematika

1, A gyógyszerkutatási és fejlesztési folyamat

A gyógyszerkutatás-fejlesztés történeti áttekintése. Természetes hatóanyagok, szubsztrátalapú gyógyszerkutatás, analóg (mee too) kutatás, „racionális gyógyszerkutatás”. A gyógyszerkutatás-fejlesztés főbb mérföldkövei: a célpont meghatározása (genomika), kémiai kiindulópont azonosítása (szűrések), kötődési esszék (biofizikai módszerek), sejtes esszék, in vivo modellek. Kémiai optimálás (szerkezeti biológia, gyógyszertervezés, többparaméteres optimálás). Preklinikai fejlesztés (méretnövelés, toxikológia). Klinikai vizsgálatok.

2, Originális gyógyszerkutatás I – az ötlettől a programig

Betegség és/vagy célpont? Fenotipikus és célorientált megközelítések. A biológiai célpont kiválasztása, validálása (genomika, proteomika, epigenetikus jellemzés). A főbb célpont családok és jellemzőik. A megfelelő vizsgálati módszerek, modellek kidolgozása. Szűrési módszerek (HTS, MTS, virtuális szűrés, fragmens szűrés). A találatok validálása (biofizikai, biológiai és kémiai úton). Program indítás.

3, Originális gyógyszerkutatás II – a találattól a gyógyszerjelölt molekuláig

Korai gyógyszerkutatás: affinitás, szerkezet-hatás összefüggés, sejtes hatás. Általános jellemzés (ADME, IP). Szerkezeti biológia és modellezés (dokkolás, molekuladinamika). Nem kívánatos célpontok elkerülése. Lead kiválasztás és optimálás. Többparaméteres optimálás. In vivo modellek és vizsgálatok. Farmakokinetika és farmakodinámia. Biztonságosság.

4, Originális gyógyszerkutatás III – receptor gátlás (esettanulmány)

A gyógyszerkutatási-fejlesztési folyamat bemutatása egy receptorgátló molekula példáján keresztül

5, Originális gyógyszerkutatás IV –kinázok gátlása (esettanulmány)

A gyógyszerkutatási-fejlesztési folyamat bemutatása egy kinázgátló molekula példáján keresztül

6, Originális gyógyszerkutatás V – fehérje-fehérje kölcsönhatás gátlása (esettanulmány)

A gyógyszerkutatási-fejlesztési folyamat bemutatása egy fehérje-fehérje kölcsönhatást gátló molekula példáján keresztül

7, Generikus gyógyszerkutatás

A generikus gyógyszerkutatás főbb fázisai. „Célpont” azonosításának főbb szempontjai. Az optimálás szempontjai és főbb fázisai. Kiválasztási kritériumok. Esettanulmány(ok).

8, Preklinikai fejlesztés I – kémiai méretnövelés

A kémiai méretnövelés lépcsői. Az eljárás-optimálás főbb szempontjai az egyes fázisokban. Esettanulmány(ok).

9, Preklinikai fejlesztés II – készítményfejlesztés

A hatóanyag jellemzése – kristályszerkezet, termokémia, fizikai-kémiai jellemzők. A hatóanyag átalakítása készítménnyé. A főbb készítménytípusok és jellemzőik. A megfelelő készítményforma kiválasztása és kifejlesztése. Esettanulmány(ok).

10, Preklinikai fejlesztés III - toxikológia

A toxikológiai vizsgálatok szerepe. Toxicitás becslése in silico módszerekkel. In vitro toxicitási tesztek. In vivo toxicitás vizsgálat: akut, krónikus. Genotoxicitás (mutagenitás), karcinogenitás, immunotoxicitás. Toxikokinetika. Esettanulmány(ok).

11, Preklinikai fejlesztés IV – szabadalmaztatás és engedélyeztetés

Az ipari jogvédelem alapjai. Mit védhetünk és hogyan. A szabadalmi bejelentéstől a megadott szabadalomig. A szabadalmak életútja. Esettanulmány(ok).

12, Klinikai fejlesztés a piacra kerülésig és azon túl

A klinikai vizsgálatok főbb fázisai és azok jellemzői. A klinikai vizsgálatok eltérései különböző betegségtípusok esetében. Farmakovigilancia. Esettanulmány(ok).