

RTU studiju kurss "Medicīnas ķīmijas izmeklētās nodaļas"

32000 Dabaszinātņu un tehnoloģiju fakultāte

Vispārējā informācija

Kods	ĶOS750
Nosaukums	Medicīnas ķīmijas izmeklētās nodaļas
Studiju kursa statuss programmā	Brīvās izvēles
Atbildīgais mācībspēks	Aigars Jirgensons - Doktors, Profesors
Mācībspēks	Māra Jure - Doktors, Profesors
Apjoms daļās un kredītpunktos	1 daļa, 12.0 kredītpunkti
Studiju kursa īstenošanas valodas	LV, EN
Anotācija	Studiju kursā tiek apskatīts zāļvielu atklāšanas process no koncepta līdz klīniskajam kandidātam: zāļvielu mērķi; līdersavienojumu atklāšanas un attīstīšanas metodes, ieskaitot modernās zāļvielu atklāšanas pieejas.
Mērķis un uzdevumi, izteikti kompetencēs un prasmēs	Studiju kursa mērķis ir sniegt padziļinātas zināšanas par jaunu zāļvielu atklāšanas pamatposmiem un principiem, kas balstīti uz mūsdienīgiem pētījumiem. Studiju kursa uzdevums ir sniegt zināšanas, kas ļauj sekmīgi piedalīties jaunu zāļvielu atklāšanas projektos.
Patstāvīgais darbs, tā organizācija un uzdevumi	Veikt literatūras analīzi un sagatavot prezentāciju par brīvi izvēlētu bioloģisko mērķi, tā farmakoloģisko nozīmi, uzbūvi, zināmajiem ligandiem. Piedāvāt jaunu ligandu atklāšanas pieejas dotajam molekulārajam mērķim, izmantojot visas studiju kursa ietvaros apskatītās metodes.
Literatūra	Obligāta/Obligatory: 1. Camille-Georges Wermuth. The Practice of Medicinal Chemistry. 3rd ed. 2008. 2. Graham L. Patrick. An Introduction to Medicinal Chemistry. 2001. Papildu/Additional: 1. Povl Krogsgaard-Larsen, Tommy Liljefors, Ulf Madsen. Textbook of Drug Design and Discovery. 3rd ed. 2002. 2. Rick Ng. Drugs-From Discovery to Approval. 2004. 3. Thomas L. Lemke, David A Williams. Foye's Principles of Medicinal Chemistry. 2007. 4. Scientific journals: Journal of Medicinal Chemistry, Drug Discovery Today, Nature Reviews Drug Discovery.
Nepieciešamās priekšzināšanas	Bioķīmija, organiskā ķīmija.

Studiju kursa saturs

Saturs	Pilna un nepilna laika klātienes studijas		Nepilna laika neklātienes studijas	
	Kontakt stundas	Patstāv. darbs	Kontakt stundas	Patstāv. darbs
Galvenie zāļvielu atklāšanas un attīstīšanas posmi.	4	5	0	0
Intelektuālā īpašuma aizsardzība.	8	5	0	0
Klīnisko pētījumu fāzes, reģistrēšana un mārketing.	4	5	0	0
Zāļvielu mērķi: lipīdi, ogļhidrāti, proteīni un nukleīnskābes.	4	5	0	0
ADMET īpašību uzlabošana: aizvietotāju nomaiņa, cikla izmēri.	5	5	0	0
Zāļvielu mērķi: proteīnu struktūra un struktūras noteikšanas metodes.	8	5	0	0
Zāļvielu mērķi: ligandu - proteīnu mijiedarbība.	6	5	0	0
Zāļvielu mērķi: ligandu saistīšanās pie jonotropajiem un metabotropajiem receptoriem.	8	5	0	0
Funkcionālie efekti: agonisti, antagonistu, parciālie antagonistu, inversie agonisti.	6	5	0	0
In vitro un in vivo bioķīmiskie testi: radioligandu un fluorescences metodes, funkcionālie testi, šūnu testi.	6	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: augstas caurlaidības skrīnings (HTS).	6	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: virtuālais HTS.	6	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: zāļvielu atklāšanas fragmentu pieeja.	6	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: dabasvielas un to atvasinājumi.	6	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: endogēno receptoru ligandu atvasinājumi.	6	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: enzīmu inhibitoru atklāšana.	6	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: blakusefektu pastiprināšana.	5	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: me too pieeja un repourpusing.	5	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: bāzes struktūras nomaiņa.	5	5	0	0
Līdersavienojumu atklāšana un attīstīšana: ligandu un proteīnu mijiedarbības modelēšana.	5	25	0	0
ADMET īpašību uzlabošana: bioloģiskās membrānas.	5	5	0	0
ADMET īpašību uzlabošana: metabolās stabilitātes uzlabošana, toksicitātes mazināšana, šķīdības uzlabošana, šūnu caurlaidības uzlabošana.	5	5	0	0

ADMET īpašību uzlabošana: prozāles.	5	5	0	0
ADMET īpašību uzlabošana: bioizostēri, bioizostērā aizvietošana.	5	5	0	0
Modernās zāļu atklāšanas pieejas: fotofarmakoloģija.	5	10	0	0
Modernās zāļu atklāšanas pieejas: proteīnu degradējošās himēras (PROTACs).	5	10	0	0
Modernās zāļu atklāšanas pieejas: antivielu-zāļu konjugāti (ADC).	5	10	0	0
Kopā:	150	170	0	0

Sasniedzamie studiju rezultāti un to vērtēšana

Sasniedzamie studiju rezultāti	Rezultātu vērtēšanas metodes
Apguvis pamatiemaņas zāļu datormodelēšanā.	Praktiskais darbs - konkrēta receptora un tā liganda mijiedarbības datormodelēšana.
Spēj analizēt un novērtēt literatūrā pieejamo informāciju saistībā ar doto slimības indikāciju, tajā iesaistītajiem bioloģiskajiem mērķiem.	Projekta izstrāde un prezentācija.
Pārzina jaunu zāļu atklāšanas un attīstīšanas metodes.	Kontroldarbi.
Spēj izstrādāt zāļu izveidošanas stratēģiju, izmantojot mūsdienīgās aktīvo savienojumu atklāšanas pieejas.	Eksāmens.

Studiju rezultātu vērtēšanas kritēriji

Kritērijs	% no kopējā vērtējuma
Kontroldarbs	20
Kontroldarbs	20
Praktiskais darbs	20
Projekts un tā prezentācija	20
Eksāmens	20
Kopā:	100

Studiju kursa plānojums

Daļa	KP	Stundas			Pārbaudījumi			Brīvās izvēles pārbaudījumi		
		Lekcijas	Prakt d.	Laborat	Ieskaite	Eksām.	Darbs	Ieskaite	Eksām.	Darbs
1.	12.0	7.5	0.5	0.0		*			*	