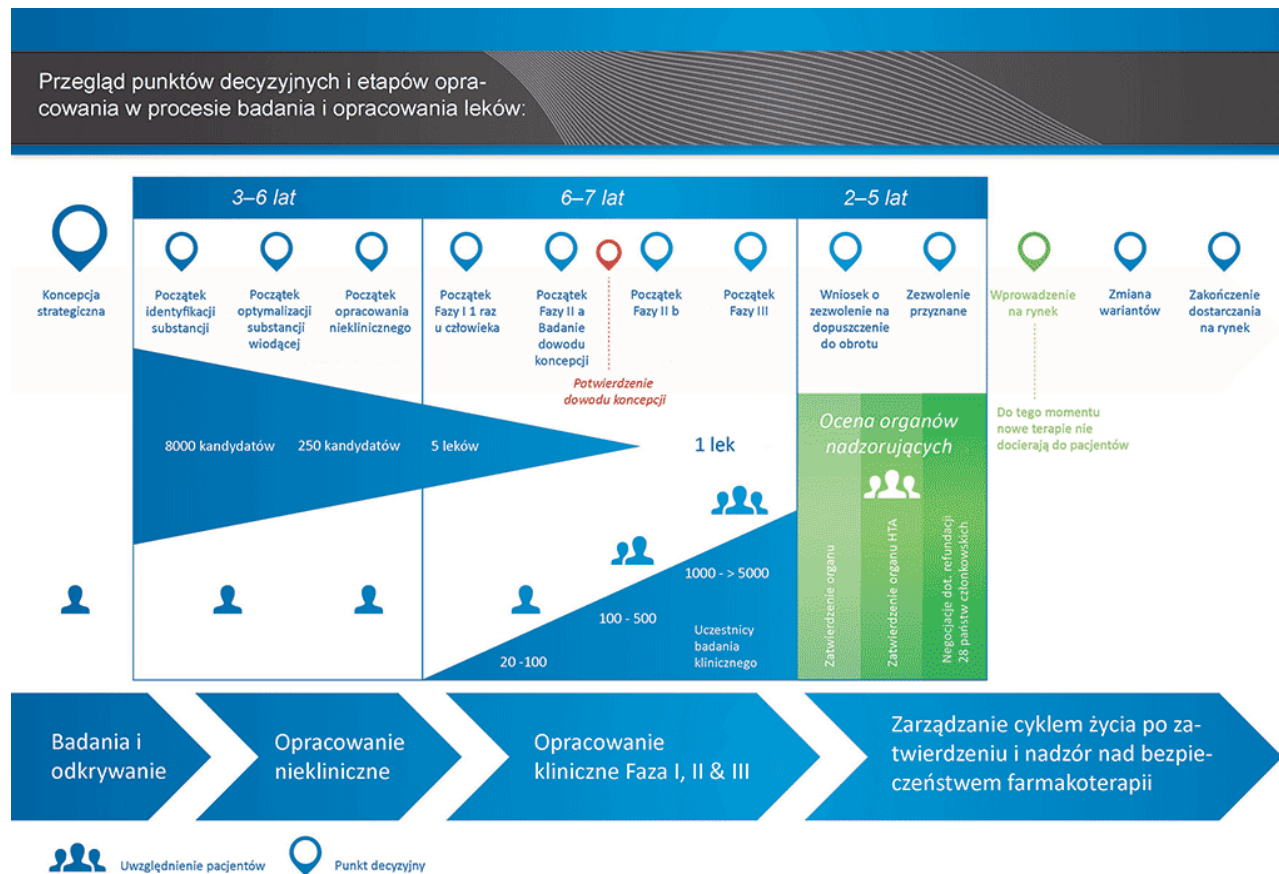


Tworzenie leków. Etap 2: wybór celu

Przeprowadzenie wszystkich badań i prac koniecznych do wprowadzenia nowego leku na rynek zajmuje ponad 12 lat i kosztuje średnio ponad 1 mld euro.

Odkrywanie nowych leków jest przedsięwzięciem o wysokim ryzyku. Większość (około 98%) opracowywanych substancji nie trafia na rynek w postaci nowych leków. Zwykle powodem tego jest fakt, że korzyści i ryzyko (negatywne działania niepożądane) ujawniane w procesie rozwoju nie wytrzymują porównania z lekami już dostępnymi dla pacjentów.

Opracowanie nowego leku można podzielić na 10 etapów. Ten artykuł dotyczy etapu 2: wybór celu.



Proces opracowania leku zajmuje ponad dziesięć lat

planowania i badań pozwalających przejść od cząsteczki do dostępnego na rynku leczenia.

Czym jest cel?

Choroby występują, kiedy normalne procesy organizmu ulegają zmianom lub przestają prawidłowo przebiegać. Podczas opracowywania leku trzeba dokładnie wiedzieć (na poziomie cząsteczek), gdzie wystąpiła nieprawidłowość. Dzięki temu można skupić się na nieprawidłowym procesie i poprawić jego przebieg. „Cel” może być: cząsteczką, która wytwarzana w nadmiarze zaburzyła normalne funkcje organizmu; jest wytwarzana w nieprawidłowej ilości albo ma nieprawidłową strukturę. Na przykład w przypadku cukrzycy organizm nie wytwarza insuliny albo komórki na nią nie reagują, a w przypadku raka może występować zbyt wiele przekaźników chemicznych dających komórkom sygnały do nieprawidłowego rozrostu.

Jak działa „wyznaczanie celu”?

Rysunek poniżej przedstawia prosty obraz komórki, z jądrem i receptorem na powierzchni.

- Jądro stanowi dla komórki „centrum sterowania” – zawiera materiał genetyczny.
- Receptor umożliwia przekaźnikom chemicznym komunikowanie się z jądrem.

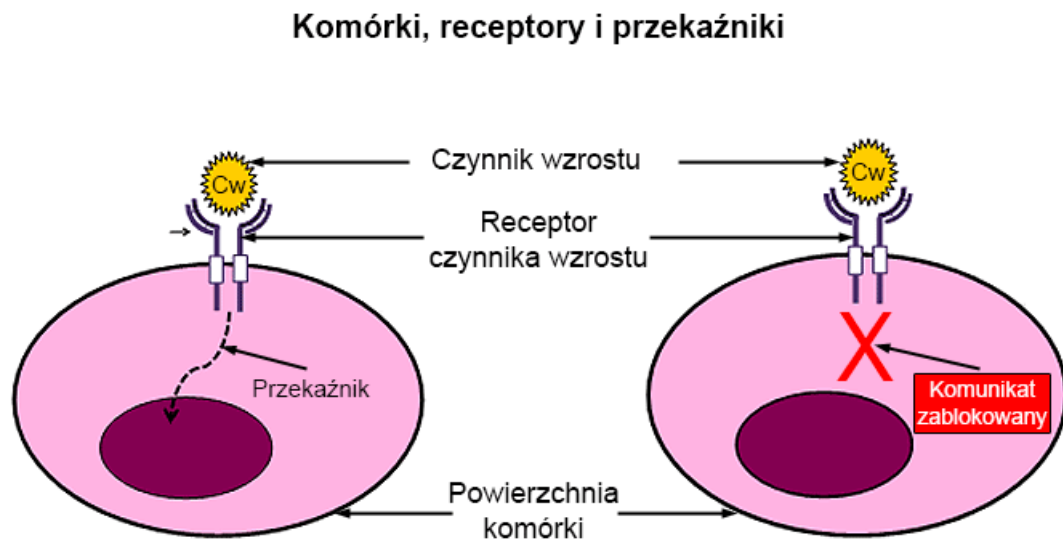
Kiedy przekaźnik chemiczny, w tym wypadku „czynnik wzrostu” łączy się z receptorem czynnika wzrostu na powierzchni komórki, wewnątrz niej jest generowany komunikat. Komunikat trafia do jądra, które z kolei pobudza komórkę do podziału. Jeśli sygnały są niekontrolowane, rozrost komórki prowadzi do raka. Zablokowanie receptora w komórkach nowotworowych zapobiega przekazywaniu komunikatu do jądra, a w konsekwencji

niekontrolowanemu rozrostowi komórki.

Zablokowanie receptora w komórkach nowotworowych ma następujące skutki:

- przerwanie wysyłania komunikatu i
- zapobieżenie niekontrolowanemu rozrostowi komórki.

„Celem” w tym wypadku jest zatem receptor czynnika wzrostu.



Optymalizacja indometacyny do funkcji silnego antagonisty receptora CRTH2. W trakcie rozwoju leku pierwotna cząsteczka po lewej stronie (indometacyna) została chemicznie zmieniona (zmiany zaznaczone czerwonymi kółkami) w celu przekształcenia jej w kandydata na lek.

Znaczenie wyboru celu

W wielu wypadkach nie da się jednak określić, co przebiega nieprawidłowo. Często chorobę cechuje występowanie kilku nieprawidłowości lub „celów”, ale naukowcy nie są w stanie stwierdzić jednoznacznie, który z nich odpowiada za jej wystąpienie. Może się także zdarzyć, że te nieprawidłowości nie są przyczyną choroby, toteż skorygowanie ich nie spowoduje

wyleczenia. W taki wypadku projekt opracowania leku może zmierzać w złym kierunku, a ostatecznie zakończyć się niepowodzeniem. Oznacza to, że wybór właściwego celu prac projektowych ma kluczowe znaczenie.

Piśmiennictwo

1. Edwards, L., Fox, A., & Stonier, P. (Eds.). (2010). *Principles and practice of pharmaceutical medicine* (3rd ed.). Oxford, UK: Wiley-Blackwell.

Załączniki

- Arkusz informacyjny: odkrywanie leków

Size: 1,208,398 bytes, Format: .docx

Ten arkusz informacyjny dotyczy etapów procesu odkrywania i rozwoju leków występujących zanim związek będzie mógł zostać zastosowany w testach z udziałem ludzi – od okresu poprzedzającego odkrycie leku (gromadzenie informacji o chorobie) do nieklinicznych badań bezpieczeństwa na zwierzętach.

- Prezentacja: Podstawowe zasady dotyczące odkrywania i rozwoju leków

Size: 920,260 bytes, Format: .pptx

Podstawowe zasady dotyczące odkrywania i rozwoju leków. Przeprowadzenie wszystkich badań i prac koniecznych do wprowadzenia nowego leku na rynek zajmuje ponad 12 lat i kosztuje ponad 1 mld euro. W tej prezentacji szczegółowo przedstawiono proces od odkrycia nowego leku do wprowadzenia go na rynek oraz późniejsze działania.