

## Lærervejledning

# Lægemiddeludvikling

### Beskrivelse af undervisningsmateriale

I dette undervisningsmateriale gennemgås den langvarige proces, hvori lægemidler udvikles. Processen illustreres i første afsnit ved at tage udgangspunkt i en Leo Pharma case, hvori der udvikles et lægemiddel mod Psoriasis. Hele processen, der indebærer identifikation af en sygdom (og drug targets), identifikation af et passende lægemiddel, samt udvikling og optimering af lægemidlet, gennemgås dernæst. Til dette formål gennemgås den relevante biokemi (blandt andet enzymkinetik og enzymfunktioner), samt relevant organisk kemi (funktionelle grupper, syre-base egenskaber, mm.). Dernæst forklares det hvordan lægemidler fordeles og nedbrydes i kroppen (ADME), og hvorledes dette relaterer til den kemiske struktur af lægemidlet. Til sidst forklares det hvordan man, ud fra den allerede forklarede teori, målrettet kan optimere lægemidler baseret på deres fysikokemiske egenskaber (SAR).

Læringskomponenter	
Teori – grundteori om emnet	x
Det Virtuelle Laboratorium	x

### Anvendelse

Undervisningsmaterialet består af en indledende case, og en række dybdegående teori afsnit. Den indledende case kan læses uafhængigt af de andre afsnit. De øvrige teori afsnit bør læses i kronologisk rækkefølge, men grundet omfanget af undervisningsmaterialet, bør gennemgangen af materialet fordeles over flere undervisningsgange. Efter at have læst teori afsnittene igennem kan forsøget i Det virtuelle laboratorium (Vlab) igangsættes. [Vlab kan tilgås her.](#)

### Niveau

Undervisningsmaterialet er rettet efter 2./3.g elever, med Bioteknologi A, eller Kemi A/Biologi B. Eleverne bør være bekendt med organisk kemi, samt strukturen af proteiner/enzymer, før arbejdet med undervisningsmaterialet går i gang.

### Dækket kerne stof - jf. [Læreplan "Bioteknologi A – stx 2017"](#)

- Kemiske bindingstyper, opløselighedsforhold, struktur- og stereoisomeri
- Organisk kemi: navngivning, opbygning, isomeri. Egenskaber for alkoholer, carbonyler, aminer, amider.
- Makromolekyler: egenskaber og biologisk funktion af proteiner, herunder enzymer, transportproteiner, og receptorer
- Syre-basereaktioner

### Dækket supplerende stof - jf. [Læreplan "Bioteknologi A – stx 2017"](#)

- Sundhed, sygdom og medicin, herunder udvikling af medicin, fremstilling og virkemåde

## Overordnet indholdsbeskrivelse af de enkelte dele:

- **Teori**

### *Introduktion til lægemidler*

En indledende case der outliner udviklingen af vitamin D, som lægemiddel mod psoriasis. Afsnittet har til formålet at gennemgå de overvejelser man skal gøre sig, når nye lægemidler udvikles. De efterfølgende afsnit uddyber dette.

### *Identifikation af target og dets struktur*

Konceptet "target" introduceres, hvorefter strukturen og funktionen af enzymer/proteiner gennemgås. Der beskrives hvorledes små molekyler kan interragere med targets for at udøve en effekt, eksempelvis på G-protein koblede receptorer, transport-enzymmer og ionkanaler.

### *Organisk kemi og lægemidler*

Relationen mellem struktur og virkemåde af lægemidler gennemgås (SAR, structure activity relationship). Til dette formål gennemgås forskellige typer af stilladser (scaffolds), samt de forskellige funktionelle grupper der kan påsættes. Måden hvorpå lægemidler kan interragere med deres targets (via intermolekylære bindinger) gennemgås. Til sidst gennemgås strukturen af alkaner, alkener og alkyner, og isomeri beskrives.

### *Funktionelle grupper*

Strukturen og betydningen for almindelige funktionelle grupper, såsom alkoholer, halider og carbonyler, gennemgås. For hver funktionel gruppe gennemgås deres evne til at indgå i intermolekylære bindinger med eventuelle drug targets.

### *Lægemidlets vej gennem kroppen*

Den menneskelige anatomi gennemgås kort, for at forklare hvordan lægemidler optages, distribueres, omsættes, og udskilles (ADME). En beskrivelse af pKa og logP gives som eksempler på fysikokemiske egenskaber, der er relevante for ADME. Lipinski's rule of five, samt betydningen af disse, gennemgås.

### *Optimering af lægemidlet*

Konceptet SAR uddybes og eksempler gives på hvordan organiske molekyler kan modificeres, for at optimere deres interaktion med deres drug target. Derudover gennemgås metoder til at optimere lægemidlet, således at det optages i højest muligt grad, og udskilles i lavest mulig grad.

- **Øvelse i Det virtuelle laboratorium**

### *Lægemiddeludvikling*

I Vlab øvelsen kan eleverne prøve at optimere bindingen af et lægemiddel, til et drug target. En vejledning til øvelsen kan findes på [Lærervejledning siden](#).