



Ontwerp en synthese

Course

2022-2023

Toegangseisen

Adequate kennis van de organische chemie wordt bekend verondersteld.

Beschrijving

Deze collegeserie biedt een veelzijdig overzicht van het medicijnonderzoek dat doorgaans plaatsvindt in de vroege preklinische fase. De verschillende onderdelen van de farmacochemie worden uitgelicht en geïllustreerd met voorbeelden.

Drie aspecten komen bij dit vak met name aan de orde:

- Target finding: eiwitten en hun functie, het selecteren van 'drug targets'.
- Hit finding: de natuur als inspiratiebron, synthese, 'high-throughput screening'.
- Hit-to-lead en Lead optimization: (kwantitatieve) structuur-activiteitsrelaties, synthetische aspecten ('ease of synthesis'), analyse van ligandbindingsplaatsen, 'drug likeliness'.

Leerdoelen

Aan het einde van het vak kan de student

1. gegeven farmacologische/fysisch chemische/structurele data van meerdere liganden op een receptor interpreteren en gebruiken om de "drug likeness" van een ligand te evalueren.

- 2. de waarde van een kristalstructuur voor het medicijnonderzoek beschrijven en de algemene structuurkenmerken en belangrijke ligand-receptor interacties herkennen in de structuur van de A2A receptor.
- 3. verschillende veel gebruikte bio-assays binnen de receptor farmacologie en de onderliggende principes beschrijven voor verschillende typen liganden en hun (in)activatie mechanismen.
- 4. enkele veelvoorkomende antibiotica en antivirale agents herkennen en hun werkingsmechanisme toelichten aan de hand van hun structuur/eigenschappen en relevante fysiologische/pathologische processen.
- 5. een gegeven syntheseroute evalueren op efficiëntie, de reacties die veel gebruikt worden in de farmacochemie er in herkennen en structurele analyse van simpele producten uitvoeren met behulp van NMR-analyse.
- 6. de stappen die in het laboratorium plaatsvinden in een farmacochemische setting herkennen en het belang van die stappen toelichten met resultaten behaald uit die stappen.

Rooster

In MyTimetable (na login) kun je alle vak- en opleidingsroosters vinden, waarmee je het grootste deel van je rooster (zalen en tijden) kunt samenstellen. Onderwijsactiviteiten waarvoor je je via MyStudymap hebt ingeschreven, worden automatisch in je rooster getoond. Daarnaast kun je MyTimetable gemakkelijk koppelen aan een agenda-app op je telefoon en worden roosterwijzigingen automatisch in je agenda doorgevoerd; bovendien ontvang je desgewenst per e-mail een notificatie van de wijziging (stel in onder 'Instellingen' na login).

Vragen over MyTimeTable? Bekijk de video, lees de instructie of neem contact op met de ISSC helpdesk

LET OP:

In MyTimeTable kunnen we op dit moment niet álle roosterinformatie weergeven, dus **CHECK ALTIJD ÓÓK**

- *het overzichtsrooster op de Brightspace module 'Bachelor Bio-Farmaceutische Wetenschappen'* voor een compact overzicht van de opbouw van ieder studiejaar, incl. timing van herkansingen en studiegerelateerde activiteiten zoals voorlichting, symposia, etc.. **ÉN**
- *het detailrooster op de Brightspace module van ieder vak (na inschrijving)*, 2-3 weken voor een vak begint. Jouw persoonlijke detailrooster kan nl. afwijken bijv. vanwege opsplitsen in groepen, tussentijdse deadlines, gastdocenten, etc.. **Het detailrooster van het vak op Brightspace is leidend**.

Onderwijsvorm

College, werkcollege, studieopdrachten.

Toetsing en weging

• De beoordeling van het schriftelijk tentamen dient minimaal 5,5 te bedragen.

Voor studenten die vóór 1 september 2019 al aan één of meer van de onderdelen van het vak Ontwerp &
Synthese hebben deelgenomen (Practicum, Tentamen of Portfolio) geldt dat het cijfer voor het tentamen
minimaal 5,0 moet bedragen en voor het Practicum en Portfolio minimaal een 6,0 gehaald moet worden
om de ECTs toegekend te krijgen.

Literatuurlijst

• G.L. Patrick. *An introduction to medicinal chemistry* (6de editie). Uitgever: Oxford. ISBN: 9780198749691.

Inschrijven

Om deel te kunnen nemen aan dit vak is *inschrijving in uSis verplicht*, gebruik daarvoor My StudyMap. **LET OP**:

- Het tentamen van Ontwerp & Synthese valt in het 2e semester en dat is nog niet geroosterd. De
 inschrijving voor het tentamen gaat dan ook pas op 15 december 2022 open; je moet JEZELF vanaf 15
 december DUS ÓÓK nog INSCHRIJVEN VOOR HET TENTAMEN Ontwerp & Synthese via My
 StudyMap
- Inschrijving voor (her)tentamens betreft slechts een vóóraanmelding, **je (her)tentameninschrijving is pas definitief als je deze via My StudyMap hebt bevestigd.**
- Inschrijven en bevestigen van deelname aan het (her)tentamen kan tot 10 kalenderdagen vóór het (her)tentamen; daarna kun je alleen deelnemen als er sprake is van zwaarwegende persoonlijke omstandigheden.
- Voor dit vak geldt de standaard inschrijftermijn van 14 kalenderdagen vóór de eerste activiteit van het vak.
- *Schrijf je alleen in voor de onderdelen die je daadwerkelijk gaat volgen*, ook uitschrijven als je niet deelneemt is verplicht.

Contact

Dhr. Dr. D. van der Es

Opmerkingen

Niet van toepassing.