

## ElexoPharm - Lead-Optimierung

### Generelles Vorgehen

Nach der Weiterentwicklung von Hits zu Leitverbindungen werden diese mit Hilfe einer ähnlichen Vorgehensweise optimiert. Um einen sogenannten "drug candidate" zu erhalten, wird die Leitstruktur modifiziert, um Schwachpunkte zu beseitigen. Hierzu werden verschiedene medizinisch-chemische Strategien, wie z.B. der bioisostere Austausch, angewendet. Mögliche Schwachpunkte könnten z.B. eine zu kurze Halbwertszeit oder eine zu geringe metabolische Stabilität sein.

Nach der Bestimmung von Metaboliten mit Hilfe von ElexoPharms LC-MS/MS-Erfahrung können stabilere Derivate vorgeschlagen und synthetisiert werden. Die synthetische Arbeit beschränkt sich in dieser Phase in der Regel auf die Synthese einzelner Moleküle.

Die biologische Evaluierung durch *in-vivo*- und *in-vitro*-Assays endet entweder mit der Identifizierung eines "drug candidate", mit dem man in die klinischen Studien gehen kann, oder mit Hinweisen auf weiteren Verbesserungsbedarf.

