

Nazwa przedmiotu			Kod ECTS
Chemia leków			13.3.0737
Nazwa jednostki prowadzącej przedmiot			
Katedra Chemii Biomedycznej			
Studia			
wydział	kierunek	poziom	wszystkie
Wydział Chemii	Biznes chemiczny	forma	wszystkie
		moduł	wszystkie
		specjalnościowy	wszystkie
		specjalizacja	wszystkie
Nazwisko osoby prowadzącej (osób prowadzących)			
prof. dr hab. Franciszek Kasprzykowski; dr Regina Kasprzykowska; prof. UG, dr hab. inż. Aleksandra Kołodziejczyk			
Formy zajęć, sposób ich realizacji i przypisana im liczba godzin			Liczba punktów ECTS
Formy zajęć			3 zajęcia 45 godz. konsultacje 5 godz. praca własna studenta 20 godz. RAZEM: 75 godz. - 3 ECTS
Sposób realizacji zajęć			
zajęcia w sali dydaktycznej			
Liczba godzin			
Wykład: 15 godz., Ćw. laboratoryjne: 30 godz.			
Cykl dydaktyczny			
2018/2019 letni			
Status przedmiotu	Język wykładowy		
obowiązkowy	polski		
Metody dydaktyczne	Forma i sposób zaliczenia oraz podstawowe kryteria oceny lub wymagania egzaminacyjne		
	Sposób zaliczenia		
	Zaliczenie na ocenę		
	Formy zaliczenia		
	- egzamin pisemny z pytaniami (zadaniami) otwartymi - ustalenie oceny zaliczeniowej na podstawie ocen częściowych otrzymywanych w trakcie trwania semestru		
	Podstawowe kryteria oceny		
	• wykład: - warunkiem koniecznym dla przystąpienia do egzaminu jest uzyskanie pozytywnej oceny zaliczeniowej z ćwiczeń laboratoryjnych; - pozytywna ocena z egzaminu możliwa jest po uzyskaniu 51% maksymalnej liczby punktów (łącznie dla obu form egzaminu); • ćwiczenia laboratoryjne: oceny częściowe przyznawane są za: a) jakość i organizację indywidualnej pracy eksperymentalnej, b) wykazanie się umiejętnością planowania eksperymentu i rozwiązywania problemów analitycznych w oparciu o nabytą wiedzę (przygotowanie do ćwiczeń) oraz uzyskiwane wyniki eksperymentalne, c) zaliczenie jednego sprawdzianu z przygotowania się studenta do wykonania ćwiczenia z preparatyki określonego leku oraz dwóch kolokwii (z zakresu analizy jakościowej związków organicznych oraz analizy jakościowej wybranych grup leków), d) opracowanie i analizę wyników uzyskanych w części eksperymentalnej każdego z ćwiczeń (sprawozdania). Warunkiem koniecznym zaliczenia ćwiczeń jest: wykonanie wszystkich ćwiczeń objętych programem zajęć, opracowanie stosownych dla nich sprawozdań, zaliczenie w/wym. sprawdzianu i dwóch kolokwii.		
Sposób weryfikacji założonych efektów kształcenia			

Sposoby weryfikacji przyswojenia wiedzy:

Student potrafi opisać przyczyny np. niskiej trwałości chemicznej antybiotyków -laktamowych, pochodnych acetylecholiny, itp. Na wybranych przykładach leków potrafi przeanalizować wpływ zmian strukturalnych leków na ich stabilność chemiczną i podatność na metabolizm, a także na wybrane właściwości fizykochemiczne (hydrofobowość, właściwości kwasowo-zasadowe itp.) oraz ich wpływ na zdolność do pokonywania barier biologicznych przez lek i drogi usuwania substancji czynnej z organizmu. Zdaje sobie sprawę z wpływu np. izomerii geometrycznej substancji na aktywność biologiczną. Potrafi wskazać metody ilościowej i jakościowej analizy substancji czynnej występującej w leku. Na podstawie dostarczonych danych eksperymentalnych (np. wyników pomiarów kolorymetrycznych lub miareczkowania) potrafi obliczyć zawartość substancji czynnej w leku.

Wykazuje

wiedzę co do metod analitycznych służących do oceny czystości substancji czynnej (metody separacyjne, np. wysokosprawna chromatografia cieczowa, chromatografia cienkowarstwowa, chromatografia gazowa) oraz służące do potwierdzenia struktury badanego związku (metody spektroskopowe – UVVis,

IR, NMR, MS). Student potrafi definiować i wskazać źródła tzw. struktur wiodących. Zna pojęcie proleku. Zna pojęcie dawki toksycznej (LD50), efektywnej dawki terapeutycznej (ED50), indeksu terapeutycznego. Potrafi określić znaczenie tych parametrów w ocenie (potencjalnego) leku. Zna pojęcie podstawienia izosterycznego i bioizosterycznego. Potrafi podać przykłady takich modyfikacji struktury związków biologicznie czynnych (struktur wiodących). Dla wybranych leków potrafi podać mechanizm ich działania biologicznego. Wykazuje znajomość problemu lekooporności patogenów, potrafi podać

przyczyny pojawienia się tego zjawiska (K_BCh_W05, K_BCh_W06, K_BCh_W07)

Sposoby weryfikacji nabycia umiejętności:

W ramach ćwiczeń laboratoryjnych, związanych z wykładem student wykonuje analizy jakościowe substancji aktywnych w dostępnych lekach prostych i złożonych, wykonuje syntezy prostych związków stosowanych jako substancje czynne leków. Potrafi znaleźć odpowiednie procedury syntezy w dostępnej literaturze. Sprawdza dostępnymi metodami czystość uzyskanych związków i potrafi przeanalizować wpływ ewentualnie popełnionych błędów w trakcie pracy laboratoryjnej na czystość i wydajność syntezy otrzymanych związków. Uzyskane wyniki eksperymentów przedstawia w formie pisemnego sprawozdania. W trakcie przygotowywania się do ćwiczeń laboratoryjnych i egzaminu student potrafi wybrać najistotniejsze informacje z podanej literatury (K_BCh_U02, K_BCh_U03, K_BCh_U05, K_BCh_U06, K_BCh_U08, K_BCh_U09).

Sposoby weryfikacji nabycia kompetencji społecznych:

Uzyskane wyniki eksperymentów przedstawia w formie pisemnego sprawozdania (K_BCh_K02, K_BCh_K03, K_BCh_K04)

Określenie przedmiotów wprowadzających wraz z wymogami wstępnymi

A. Wymagania formalne

Ukończone kursy „Chemii organicznej”, „Chemii ogólnej” i „Chemii analitycznej”

B. Wymagania wstępne

- podstawowe mechanizmy reakcji w chemii organicznej, podstawowe typy związków organicznych, grupy funkcyjne w związkach organicznych i sposoby ich przekształcania, kwasowość/zasadowość w chemii organicznej, znajomość efektów elektronowych (indukcyjny, mezomeryczny, nadsprężenia), izomerii, hydrofobowości, wiązań wodorowych, oddziaływań van der Waalsa dyspersyjnych i hydrofobowych, znajomość pojęcia katalizy;
- znajomość biologii na poziomie szkoły średniej;
- znajomość podstaw obliczeń stosowanych w chemii analitycznej;
- znajomość podstawowych zasad BHP w laboratorium chemicznym;
- umiejętność pracy z użyciem sprzętu, naczyń i podstawowej aparatury laboratoryjnej, stosowanej w preparatyce i analizie chemicznej.

Cele kształcenia

Wykład:

- Zapoznanie studentów z podstawowymi pojęciami stosowanymi w chemii leków, takimi jak np. indeks terapeutyczny, struktura wiodąca, cel działania leku, farmakokinetyka, a także podstawowymi badaniami prowadzonymi w trakcie opracowywania nowego leku.
- Zapoznanie studentów z podstawową wiedzą, dotyczącą drogi od struktury wiodącej do leku stosowanego w praktyce klinicznej, w tym również ze źródłami struktur wiodących i typowymi zmianami struktury wiodącej, mającymi na celu opracowanie nowego, klinicznie użytecznego związku.

Ćwiczenia:

- Zapoznanie studentów z zagadnieniami wymienionymi w treściach programowych ćwiczeń.
- Zaznajomienie studentów z techniką pracy laboratoryjnej w skali mikromolowej, stosowaną w chemii organicznej i analitycznej;
- Wyrobienie umiejętności samodzielnego planowania pracy eksperymentalnej, wykonywania analiz chemicznych i rozwiązywania problemów podczas ich realizacji.

Treści programowe

Wykład:

- Aktywność biologiczna; lek a trucizna. Indeks terapeutyczny.
- Podstawowe cele działania leków: białka, kwasy nukleinowe lipidy.
- Receptory i enzymy jako cele działania leku. Oddziaływania białko-lek. Peptydy i białka jako leki. Przeciwciała.
- Kwasy nukleinowe i ich oddziaływanie z lekami.
- Lek od pomysłu do wdrożenia. Badania biologiczne.
- Struktura wiodąca. Źródła struktur wiodących. Modyfikowanie struktury wiodącej

- Zależność pomiędzy strukturą a aktywnością biologiczną związku. Pojęcie grupy farmakoforowej. Metody badania ilościowej zależności pomiędzy strukturą a aktywnością biologiczną leków i ich zastosowanie w projektowaniu leków.
- Forma leku i metody podawania leku. Synergizm w działaniu leków.
- Farmakokinetyka. Trwałość chemiczna leku, jego odporność na metabolizm, pokonywanie barier biologicznych przez lek. Usuwanie leku z organizmu. Proleki i ich zastosowanie.
- Inhibitory konwertazy angiotensynowej (ACE) jako leki o działaniu hipotensyjnym
- Przykłady leków antybakteryjnych. Sulfonamidy i antybiotyki β -laktamowe. Antybiotyki zaburzające syntezę białek, transkrypcję i replikację kwasów nukleinowych.
- Lekooporność bakterii. Przyczyny pojawienia się szczepów lekoopornych.
- Leki cholinergiczne, antycholinergiczne, inhibitory acetylocholin esterazy
- Leki działające na układ adrenergiczny

Ćwiczenia laboratoryjne:

- Preparatyka prostych środków leczniczych. Analiza identyfikacyjna produktów syntezy. Ocena ich czystości.
- Identyfikacja substancji czynnych w nieznanach komercyjnych lekach prostych na drodze ich chemicznej analizy jako-ściowej.
- Ogólne metody identyfikacji substancji leczniczych z wybranych grup strukturalnych (pochodne alkaloidów, steroidy, tetracykliny, sulfonamidy, związki β -laktamowe, pochodne aniliny i kwasu salicylowego, barbiturany).
- Analiza jakościowa substancji czynnej w znanym leku prostym. Oznaczanie ilościowe jej zawartości w jednostkowej porcji komercyjnego leku jednoskładnikowego.

Wykaz literatury

A. Literatura wymagana do ostatecznego zaliczenia zajęć (zdania egzaminu):

A.1. wykorzystywana podczas zajęć

• R. Kasprzykowska, A.S. Kołodziejczyk, Chemiczna analiza środków leczniczych. Leki proste, Wydawnictwo Uniwersytetu Gdańskiego, Gdańsk 2009.

• R. Kasprzykowska, Preparatyka prostych środków leczniczych, materiały niepublikowane, udostępniane przez prowadzących ćwiczenia.

• R. Walczyna, J. Sokołowski, G. Kupryszewski, Analiza związków organicznych, Wydawnictwo Uniwersytetu Gdańskiego, Gdańsk 1996

A.2. studiowana samodzielnie przez studenta

• Graham L. Patrick. "Chemia medyczna. Podstawowe zagadnienia", wyd. WNT, Warszawa, 2003• Graham L. Patrick „Krótkie wykłady. Chemia leków”, wyd. PWN, Warszawa 2004.

• R.B. Silverman, „Chemia organiczna w projektowaniu leków”, wyd. WNT, Warszawa, 2004

• Praca zbiorowa pod red. K. Kieć-Kononowicz, „Wybrane zagadnienia z metod poszukiwania i otrzymywania środków leczniczych”, Wydawnictwo UJ, Kraków 2006.

B. Literatura uzupełniająca

• Zdzisław Markiewicz, Zbigniew A. Kwiatkowski „Bakterie antybiotyki lekooporność”, wyd. PWN, Warszawa 2001.

• Alojzy Zgierski, Roman Gondko „Obliczenia biochemiczne”, wyd. PWN, Warszawa 1998.

• Marianna Zająć, Ewaryst Pawełczyk „Chemia leków”, Wydawnictwo Akademii Medycznej im. Karola Marcinkowskiego, Poznań 2000.

• Alfred Zejca, Maria Gorczyca „Chemia leków”, wyd. PZWL, Warszawa 2004

Efekty kształcenia

(obszarowe i kierunkowe)

K_BCh_W05 opisuje cykl życia urządzeń, obiektów i systemów technicznych oraz nowoczesne środowiskowe rozwiązania techniczne

K_BCh_W06 wymienia podstawowe procesy jednostkowe oraz opisuje zagadnienia z zakresu technologii i inżynierii chemicznej

K_BCh_W07 opisuje budowę i zasady działania podstawowej aparatury naukowej, technologicznej i kontrolno-pomiarowej

K_BCh_U02 stosuje podstawowe metody, techniki i narzędzia w formułowaniu i rozwiązywaniu zadań inżynierskich z zakresu chemii

K_BCh_U03 planuje, dobiera właściwy sprzęt i aparaturę badawczo-pomiarową oraz wykonuje proste eksperymenty chemiczne; dokonuje analizy wyników i na ich podstawie formułuje wnioski

K_BCh_U05 dokonuje oceny przydatności i sposobu

Wiedza

- Definiuje podstawowe pojęcia z zakresu chemii leków, zawarte w treściach programowych.
- Opisuje podstawowe źródła i procedury poszukiwania nowych struktur wiodących i metodykę badań prowadzonych w celu uzyskania substancji użytecznej w praktyce klinicznej.
- Orientuje się, na jakie przeszkody napotyka lek na drodze do właściwego miejsca działania, oraz w jaki sposób lek może być przekształcany i wydalaný z organizmu.
- Zdaje sobie sprawę z wpływu metabolizmu, zdolności do pokonywania barier biologicznych przez substancję biologicznie czynną na sposób administracji leku i jego przydatność w praktyce medycznej.
- Wymienia podstawowe źródła struktur wiodących i metody stosowane w ich poszukiwaniu. Opisuje podstawowe modyfikacje struktury wiodącej prowadzone we wstępnej fazie poszukiwania leków.
- Wymienia techniki ułatwiające projektowanie nowych struktur związków o pożądanym działaniu biologicznym.
- Opisuje ogólne sposoby wykrywania i identyfikacji pojedynczych związków farmakologicznych z grup wyszczególnionych w treściach programowych.

Umiejętności

- Określa przypuszczalny typ oddziaływań pomiędzy grupami farmakoforowymi a celem działania leku.
- Na przykładach wybranych grup leków podaje propozycje modyfikacji ich struktur chemicznych, prowadzących do pożądaných zmian profilu aktywności biologicznej

funkcjonowania w przemyśle chemicznym istniejących rozwiązań inżynieryjno-technicznych oraz metod badawczo-pomiarowych K_BCh_U06 proponuje i wykonuje proste urządzenia, operacje lub procesy jednostkowe związane z realizacją procesu technologicznego stosowanego w przemyśle chemicznym z uwzględnieniem bilansów materiałowych i energetycznych K_BCh_U08 właściwie posługuje się nomenklaturą chemiczną i terminologią inżynieryjną K_BCh_U09 wykorzystując nabytą wiedzę, umiejętności oraz różnorodne źródła informacji naukowej samodzielnie przygotowuje prace pisemne oraz wystąpienia ustne K_BCh_K02 pracuje indywidualnie wykazując inicjatywę i samodzielność w działaniach oraz efektywnie współdziała w zespole, pełniąc w nim różne role K_BCh_K03 samodzielnie ustala lub realizuje ustalony plan działania określając priorytety służące jego realizacji K_BCh_K04 wykazuje odpowiedzialność za bezpieczeństwo pracy własnej i innych	(np. selektywności), zdolności do pokonywania barier biologicznych, trwałości chemicznej i podatności na metabolizm. • Przeprowadza złożoną syntezę związku organicznego o właściwościach leczniczych korzystając z polskojęzycznej procedury literaturowej. • Przewiduje prawdopodobny mechanizm reakcji syntezy związku organicznego otrzymywanego wg realizowanej procedury. • Ocenia czystość otrzymanego preparatu w oparciu o wskazane w przepisie syntezy badania fizykochemiczne, chromatograficzne lub/i spektroskopowe. • Projektuje ścieżki rozróżniania pojedynczych substancji leczniczych w serii kilku związków na-leżących do różnych grup strukturalnych. • Oznacza zawartość substancji czynnej w komercyjnym leku prostym, wykorzystując farmakopealne procedury analizy ilościowej i podstawy obliczeń chemicznych. • Wykonuje eksperymenty chemiczne w skali mikromolowej. • Na podstawie zebranych wyników eksperymentalnych argumentuje sądy i wyprowadza wnioski na drodze logicznego rozumowania.
	Kompetencje społeczne (postawy) • Zdaje sobie sprawę z ekonomicznego i społecznego znaczenia badań mających na celu poszukiwanie i opracowywanie nowych leków. • Docenia wpływ staranności pracy na jakość uzyskiwanych wyników i trafność wyprowadzanych wniosków; • Zachowuje ostrożność w formułowaniu wniosków. • Zachowuje ostrożność przy pracy laboratoryjnej z substancjami o potencjalnym działaniu farmakologicznym.
Kontakt	
franciszek.kasprzykowski@ug.edu.pl	