



KAPITAŁ LUDZKI
NARODOWA STRATEGIA SPÓJNOŚCI

Projekt współfinansowany przez
Unię Europejską w ramach
Europejskiego Funduszu
Społecznego

UNIA EUROPEJSKA
EUROPEJSKI
FUNDUSZ SPOŁECZNY



Nazwa przedmiotu		Kod ECTS	
Chemia leków		13.3.0497	
Nazwa jednostki prowadzącej przedmiot			
Katedra Chemii Biomedycznej			
Studia			
wydział	kierunek	poziom	pierwszego stopnia
Wydział Chemii	Chemia	forma	stacjonarne
		moduł specjalnościowy	chemia biomedyczna
		specjalizacja	wszystkie
Nazwisko osoby prowadzącej (osób prowadzących)			
prof. dr hab. Franciszek Kasprzykowski			
Formy zajęć, sposób ich realizacji i przypisana im liczba godzin		Liczba punktów ECTS	
Formy zajęć		4	
Wykład, Ćw. laboratoryjne		zajęcia 60 godz.	
Sposób realizacji zajęć		konsultacje 5 godz.	
zajęcia w sali dydaktycznej		praca własna studenta 35 godz.	
Liczba godzin		RAZEM: 100 godz. - 4 ECTS	
Ćw. laboratoryjne: 30 godz., Wykład: 30 godz.			
Termin realizacji przedmiotu			
2021/2022 letni			
Status przedmiotu		Język wykładowy	
obowiązkowy		polski	
Metody dydaktyczne		Forma i sposób zaliczenia oraz podstawowe kryteria oceny lub wymagania egzaminacyjne	
<ul style="list-style-type: none"> - Projektowanie doświadczeń - Wykonywanie doświadczeń - Wykład z prezentacją multimedialną 		Sposób zaliczenia	
		Zaliczenie na ocenę	
		Formy zaliczenia	
		egzamin pisemny z pytaniami (zadaniami) otwartymi	
		Podstawowe kryteria oceny	
		<ul style="list-style-type: none"> • wykład: <ul style="list-style-type: none"> - 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: <ul style="list-style-type: none"> oceny częściowe przyznawane są za: <ol style="list-style-type: none"> 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 kolokwium (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). <p>Warunkiem koniecznym zaliczenia ćwiczeń jest: wykonanie wszystkich ćwiczeń objętych programem zajęć, opracowanie stosownych dla nich sprawozdań, zaliczenie w/wym. sprawdzianu i dwóch kolokwium.</p>	

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. (K_W02, K_W03)

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. wysokosprawną chromatografię cieczową, chromatografię cienkowarstwową, chromatografię gazową) oraz służące do potwierdzenia struktury badanego związku (metody spektroskopowe – UV-Vis, IR, NMR, MS). (K_W04)

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 biozosterycznego. 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_W05)

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 (K_U01, K_U02, K_U03, K_U04, K_U09). Uzyskane wyniki eksperymentów przedstawia w formie pisemnego sprawozdania.(K_U07, K_U08, K_U09). W trakcie przygotowywania się do ćwiczeń laboratoryjnych i egzaminu student potrafi wybrać najistotniejsze informacje z podanej literatury.(K_U09)

Sposoby weryfikacji nabrania kompetencji społecznych:

Uzyskane wyniki eksperymentów przedstawia w formie pisemnego sprawozdania.(K_K 01, K_K03, K_K05, K_K06, K_K08)

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 beta-laktamowe, pochodne aniliny i kwasu salicylowego, barbiturany).
 - Analiza jakościowa substancji czynnej w znanym leku prostym. Oznaczanie ilościowej 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 lecz-nicznych”, WSydawnictwo UJ, Kraków 2006.
- B. Literatura uzupełniająca
- Zdzisław Markiewicz, Zbigniew A. Kwiatkowski „Bakterie antybiotyki lekooporność”, wyd. PWN, Warszawa 2001.
 - Alojzy Zgirski, Roman Gondko „Obliczenia biochemiczne”, wyd. PWN, Warszawa 1998.
 - Marianna Zając, Ewaryst Pawełczyk „Chemia leków”, Wydawnictwo Akademii Medycznej im. Karola Marcinkowskiego, Poznań 2000.
 - Alfred Zejca, Maria Gorczyca „Chemia leków”, wyd. PZWL, Warszawa 2004

Kierunkowe efekty kształcenia

- K_W02: opisuje właściwości pierwiastków i najważniejszych związków chemicznych, wymienia metody ich otrzymywania oraz sposoby analizy;
- K_W03: wyjaśnia zależności pomiędzy strukturą materii a jej obserwowanymi właściwościami;
- K_W04: charakteryzuje podstawowe metody analizy związków chemicznych;
- K_W05: posiada podstawową wiedzę w zakresie studiowanej specjalności chemicznej
- K_U01: identyfikuje, analizuje i rozwiązuje problemy z zakresu szeroko pojętej chemii w oparciu o zdobytą wiedzę;
- K_U02: wykonuje analizy metodami eksperymentalnymi i na ich podstawie formułuje wnioski;
- K_U03: dobiera odpowiedni sprzęt oraz aparaturę laboratoryjną do przeprowadzania nieskomplikowanych eksperymentów chemicznych

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 wydalany 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 prak-tyce medycznej.
- Wymienia podstawowe źródła struktur wiodących i metody stosowane w ich poszukiwaniu. Opi-suje 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

<p>K_U04: planuje i wykonuje proste eksperymenty chemiczne oraz analizuje otrzymane wyniki;</p> <p>K_U07: przygotowuje udokumentowane opracowanie określonego problemu z zakresu wybranych zagadnień chemicznych i fizycznych;</p> <p>K_U08: przedstawia w sposób przystępny, językiem naukowym typowym dla nauk chemicznych podstawowe fakty z chemii;</p> <p>K_U09: umie uczyć się samodzielnie;</p> <p>K_K01: identyfikuje poziom swojej wiedzy i umiejętności, potrzebę ciągłego doskonalenia się oraz rozwoju osobistego;</p> <p>K_K03: ustala we właściwy sposób priorytety służące do realizacji określonego przez siebie i/lub innych zadania;</p> <p>K_K05: przestrzega ustalonych procedur w pracy laboratoryjnej i jest odpowiedzialny za bezpieczeństwo swojej pracy i innych;</p> <p>K_K06: podnosi swoje kompetencje zawodowe i osobiste poprzez korzystanie z informacji podawanych w różnych źródłach;</p> <p>K_K08: formułuje opinie z zakresu nauk ścisłych przy zachowaniu ostrożności i krytycyzmu w ich wyrażaniu;</p>	farmakologicznych z grup wyszczególnionych w treściach programowych.
	<p>Umiejętności</p> <ul style="list-style-type: none"> • Określa przypuszczalny typ oddziaływań pomiędzy grupami farmakoforowymi a celem działania leku. • Na przykładach wybranych grup leków podaje propozycje modyfikacji ich struktur chemicznych, prowadzących do pożądanych zmian profilu aktywności biologicznej (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 należących 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.
	<p>Kompetencje społeczne (postawy)</p> <ul style="list-style-type: none"> • 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.
<p>Kontakt</p> <p>franciszek.kasprzykowski@ug.edu.pl</p>	