

INFORMAČNÝ LIST PREDMETU

Vysoká škola: Univerzita Komenského v Bratislave	
Fakulta: Farmaceutická fakulta	
Kód predmetu: FaF.KFCh/06-Mgr/00	Názov predmetu: Farmaceutická chémia (2)
Druh, rozsah a metóda vzdelávacích činností: Forma výučby: prednáška / laboratórne cvičenie / seminár Odporúčaný rozsah výučby (v hodinách): Týždenný: 2 / 5 / 0 Za obdobie štúdia: 28 / 70 / 0 Metóda štúdia: prezenčná	
Počet kreditov: 7	
Odporúčaný semester/trimester štúdia: 6.	
Stupeň štúdia: I.II.	
Podmieňujúce predmety:	
Odporúčané prerekvizity (nepovinné): Odporúčanie. Pre úspešné absolvovanie predmetu Farmaceutická chémia (2) je odporúčané úspešné absolvovanie predmetov FaF.KCHTL/01-Mgr-00 Organická chémia (1), FaF.KCHTL/02-Mgr-00 Organická chémia (2), FaF.KBMBL/03-Mgr-00 Biochémia a FaF.KFCH/05-Mgr/00 Farmaceutická chémia (1).	
Podmienky na absolvovanie predmetu: a) Aktívna účasť na požadovaných formách výučby Absolvovanie prednášok – aktívna účasť (prednášky sú povinná forma výučby!); Absolvovanie praktických cvičení – študent je povinný absolvovať praktické cvičenia v celom rozsahu, a to podľa harmonogramu zverejneného na oficiálnej výveske Katedry farmaceutickej chémie (100%-účasť na praktických cvičeniach). Osobitne odporúčaná je aktívna účasť na prednáškach z Farmaceutickej chémie (2) študentom, ktorí majú tento predmet opakovane zapísaný vo vyššom ročníku štúdia (bez ohľadu na to, či majú alebo nemajú udelené priebežné hodnotenie). Ak má študent predmet Farmaceutická chémia (2) zapísaný opakovane, teda nemá udelené finálne hodnotenie A–E, musí sa v AIS-2 zapísať do rozvrhu praktických cvičení (a aj prednášok). V prípade, ak má študent opakovane zapísaný predmet Farmaceutická chémia (2) a má splnenú požiadavku 100% účasti na praktických cvičeniach, musí písomne požiadať vedúceho Katedry farmaceutickej chémie o verifikovanie, resp. uznanie absolvovania týchto cvičení. Študent s opakovaným zapísaním predmetu Farmaceutická chémia (2) musí absolvovať obe kontroly priebežného hodnotenia (oba testy), a to aj v prípade, že ich úspešne absolvoval pri prvom zapísaní predmetu. Tieto kontroly (testy) musí teda absolvovať aj vtedy, ak (i) mal 100%-účasť na praktických cvičeniach a (ii) dosiahol požadovanú percentuálnu úspešnosť (60% a viac z celkového bodového hodnotenia každého testu). b) Absolvovanie všetkých predpísaných kontrol priebežného hodnotenia s dosiahnutím adekvátnej percentuálnej úspešnosti Na praktických cvičeniach budú písomne overené vedomosti študentov (dva testy); koncipovanie testov, ich oprava a aj udeľovanie priebežného hodnotenia bude v kompetencii vyučujúcich – vedúcich praktických cvičení.	

Pre úspešné absolvovanie praktických cvičení je nevyhnutné, aby študent získal z každého priebežného hodnotenia (z každého testu) minimálne 60% z maximálneho bodového hodnotenia (t.j. 60% a viac).

Účasť študenta na skúške z predmetu Farmaceutická chémia (2) je podmienená splnením všetkých požiadaviek, ktoré sú uvedené v častiach a) a b).

Skúška z predmetu Farmaceutická chémia (2) bude prebiehať písomnou formou, t.j. študent písomne vyplní test, ktorý bude pozostávať z 25 otázok a z ktorých každá bude hodnotená 2 bodmi. Súbor testových otázok bude koncipovaný zo všetkých tématických celkov, ktoré sú uvedené v sylabuse prednášok a aj praktických cvičení, t.j. budú v ňom obsiahnuté (i) definície, „chemické“ klasifikácie konkrétnych farmakoterapeutických skupín (s prezícnym „chemickým“ zaradením a vymenovaním príslušných liečiv), (ii) znázornenia chemických štruktúr vybraných liečiv, (iii) detailné hodnotenia vzťahov medzi chemickou štruktúrou a biologickou aktivitou (vrátane prehľadnej všeobecnej chemickej štruktúry liečiv príslušnej skupiny a aj chemickej štruktúry minimálne jedného relevantného liečiva) a s využitím vedomostí zo „všeobecnej“ farmaceutickej chémie a aj (iv) poznatky o biotransformačných cestách aplikované na konkrétnych liečivách.

Celkové trvanie písomnej skúšky z predmetu Farmaceutická chémia (2) je 120 min; termíny, časy a miestnosti pre skúšky budú uvedené v AIS-2.

Finálne hodnotenie predmetu Farmaceutická chémia (2): 50–47 bodov (hodnotenie „A“), 46–44 bodov („B“), 43–39 bodov („C“), 38–35 bodov („D“), 34–30 bodov („E“), menej ako 30 bodov („FX“; neprospel).

Váha priebežného / záverečného hodnotenia: 0 / 100

Výsledky vzdelávania:

Farmaceutická chémia (predmet Farmaceutická chémia (2)) je jednou z centrálnych vedeckých disciplín, ktorá premostňuje vedomosti základnej vedeckej biológie a klinické znalosti medicíny. Projekcia liečiv môže byť fázovaná so zreteľom na dva aspekty, t.j. fundamentálne poznatky o: a) liečivách, receptoroch, interakciách liečivo–receptor; b) komplexných interakciách liečivo–receptor, ktoré sú využiteľné pre terapiu ľudských ochorení. Farmaceutická chémia je interdisciplinárna; veľmi vhodne integruje poznatky z teoretickej chémie, organickej chémie, analytickej chémie, molekulovej biológie, farmakológie a biochémie do jedného celku. Farmaceutická chémia má však aj vlastnú zreteľnú líniu – projekcia a syntéza liečiv s komplexnou a precíznou charakterizáciou ich vlastností so zreteľom na (i) štruktúrnú integritu liečiv (vo farmaceutickej, farmakodynamickej a farmakokinetickej fáze), (ii) ich štruktúrne fragmenty (farmakofór, toxikofór, metabofór; vzájomne zameniteľné bioizostéry), (iii) ich štruktúrne vlastnosti, (iv) ich fyzikálno-chemické vlastnosti (rozpusťnosť, povrchová aktivita, acidobázické a lipohydrofilné vlastnosti), (v) ich tvarové vlastnosti (geometrické, konformačné, topologické, stericke), (vi) ich stereochemické vlastnosti (optické izoméry, enantioméry, geometrické izoméry), (vii) elektrónové vlastnosti. V kontexte týchto poznatkov sú komplexne skúmané vzťahy medzi chemickou štruktúrou a biologickou aktivitou.

Stručná osnova predmetu:

Prednášky

1. TÝŽDEŇ: Kardiaká. Vazodilatancia (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)

2. TÝŽDEŇ: Antihypertenzíva. Venofarmaká (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)

3. TÝŽDEŇ: Liečivá regulujúce zrážanie krvi. Krvné náhrady. Antihyperlipidemiká (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
4. TÝŽDEŇ: Expektoranciá. Liečivá ovplyvňujúce acidózu. Antacída a antiulceróza. Cholagogá a cho-lelitolýtiká. Hepatoprotektíva (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
5. TÝŽDEŇ: Laxatíva. Antidiaroidiká. Diuretiká. Antidiuretiká (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
6. TÝŽDEŇ: Dezinficienciá a antiseptiká. Anthelmintiká. Insekticída (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
7. TÝŽDEŇ: Antimykotiká. Antiprotozoiká (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
8. TÝŽDEŇ: Antimalariká. Antituberkulotiká. Antileprotiká (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
9. TÝŽDEŇ: Antibakteriálne chemoterapeutiká/Antibiotiká, časť 1. beta-Laktámové antibiotiká. Amfenikoly. Tetracyklíny. Makrolidy. Aminoglykozidy. Linkozamíny (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
10. TÝŽDEŇ: Antibakteriálne chemoterapeutiká/Antibiotiká, časť 2. Antibiotiká odvodené od aminokyselín. Peptidové antibiotiká. Steroidové antibiotiká. Ortozomycíny. Streptogramíny. Ansamycíny. Antibiotiká rôznych štruktúr. Sulfónamidy a diaminopyrimidíny. Oxacíny (Inhibítory gyráz). Oxazolidinóny. Nitrofurány (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
11. TÝŽDEŇ: Antivirotiká (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
12. TÝŽDEŇ: Cytostatiká, časť 1. Alkylujúce zlúčeniny. Zlúčeniny vytvárajúce komplexy s DNA. Rádiomimetiká. Antimetaboly. Inhibítory syntézy proteínov. Antimitotické liečivá (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)
13. TÝŽDEŇ: Cytostatiká, časť 2. Hormóny a antihormóny. Zlúčeniny ovplyvňujúce imunitnú odpoveď. Inhibítory angiogenézy. Inhibítory históndeacetylázy a iných proteínových deacetyláz. Inhibítory histónmetyltransferáz. Monoklonálne protilátky. Inhibítory tyrozínkináz. Inhibítory serín-treonínkináz (Definície, mechanizmus pôsobenia, systematické „chemické“ rozdelenie, chemické štruktúry vybraných liečiv, hodnotenie vzťahov „štruktúra–aktivita“, biotransformácia)

Odporúčaná literatúra:

- Abraham, D.J., & Rotella, D.P. (2010). *Burger's Medicinal Chemistry and Drug Discovery*, 8 Volume Set. 7th Ed. Wiley, Hoboken, NY, USA, 6416 s.
- Avendaño, C., & Menéndez, J.C. (2015). *Medicinal Chemistry of Anticancer Drugs*. 2nd Ed. Elsevier, Amsterdam, the Netherlands; Elsevier, Kidlington, Oxford, Veľká Británia; Elsevier, Waltham, MA, USA, 744 s.
- Desai, M.C., Meanwell, N.A., Thurston, D.E., Ganellin, R., Fox, D., Guccione, S., Martinez, A., Rotella, D., Belema, M., Sperandio, D., Shi, P.-Y., Jordan, R., Halcomb, R., Roberts, Ch., Johns,

B.A., Griffin, S., Beaulieu, P.L., McCauley, J.A., Sofia, M., Xu, L., Guyer, B., & Peel, M.R. (2013). Successful Strategies for the Discovery of Antiviral Drugs: RSC (Drug Discovery). Drug Discovery Series No. 32, Royal Society of Chemistry, Cambridge, Veľká Británie, 533 s.

Firestine, S.M., Lister, T., Abel-Santos, E., Hedstrom, L., Melander, Ch., Fisher, S., Khursigara, C., Lazarides, L., Garneau-Tsodikova, S., & Balibar, C.J. (2017). Antibiotic Drug Discovery: New Targets and Molecular Entities. 1st Ed., Kindle Ed. Drug Discovery Series No. 58, Royal Society of Chemistry, Cambridge, Veľká Británie, 285 s.

Hartl, J., Doležal, M., Miletín, M., Opletalová, V., & Zimčík, P. (2012). Farmaceutická chemie IV (chemoterapeutika), Karolinum, Praha, ČR, 168 s.

Hartl, J., Doležal, M., Krinková, J., Miletín, M., & Opletalová, M. (2012). Farmaceutická chemie III (oběhová a krevní soustava, trávicí a vylučovací soustava), Karolinum, Praha, ČR, 117 s.

Patrick, G.L. (2013). An Introduction to Medicinal Chemistry. 5th Ed. Oxford University Press, New York, USA, 789 s.

Wermuth, C., Aldous, D., Raboisson, P., & Rognan, D. (2015). The Practice of Medicinal Chemistry. 4th Ed. Academic Press (Elsevier), San Diego, CA, USA; Kidlington, Oxford, Veľká Británie, 903 s.

Jazyk, ktorého znalosť je potrebná na absolvovanie predmetu:

Slovenský jazyk

Poznámky:

Hodnotenie predmetov

Celkový počet hodnotených študentov: 2475

A	B	C	D	E	FX
24,48	17,82	23,31	15,47	14,55	4,36

Vyučujúci: doc. Mgr. Fils Andriamainty, PhD., doc. PharmDr. Ivan Malík, PhD., PharmDr. Vladimír Garaj, PhD., doc. PharmDr. Miroslava Sýkorová, PhD., PharmDr. Iva Kapustíková, PhD., PharmDr. Matej Maruniak, PhD., PharmDr. Lenka Stopková, PhD., PharmDr. Jana Čurillová, PharmDr. Kamila Chomaničová, PharmDr. Miroslav Kemka, PharmDr. Mária Pecháčová, PharmDr. Eva Salanci, PharmDr. Zuzana Štiffelová

Dátum poslednej zmeny: 13.02.2020

Schválil: prof. PharmDr. Pavel Mučaji, PhD.