

Politechnika Wrocławska  
**WYDZIAŁ CHEMICZNY**

### KARTA PRZEDMIOTU

Nazwa w języku polskim	<b>Projektowanie związków biologicznie czynnych</b>
Nazwa w języku angielskim	<b>Design of biologically active compounds</b>
Kierunek studiów (jeśli dotyczy):	<b>Biotechnologia</b>
Specjalność (jeśli dotyczy):	<b>Biotechnologia molekularna i biokataliza</b>
Stopień studiów i forma:	<b>II stopień, stacjonarna</b>
Rodzaj przedmiotu:	<b>obowiązkowy</b>
Kod przedmiotu	<b>BTC023036</b>
Grupa kursów	<b>NIE</b>

\*niepotrzebne usunąć

	Wykład	Ćwiczenia	Laboratorium	Projekt	Seminarium
Liczba godzin zajęć zorganizowanych w Uczelni (ZZU)	30			30	
Liczba godzin całkowitego nakładu pracy studenta (CNPS)	90			60	
Forma zaliczenia	egzamin			zaliczenie na ocenę	
Dla grupy kursów zaznaczyć kurs końcowy (X)					
Liczba punktów ECTS	3			2	
w tym liczba punktów ECTS odpowiadająca zajęciom o charakterze praktycznym (P)				2	
w tym liczba punktów ECTS odpowiadająca zajęciom wymagającym bezpośredniego kontaktu (BK)	1			1	

### WYMAGANIA WSTĘPNE W ZAKRESIE WIEDZY, UMIEJĘTNOŚCI I INNYCH KOMPETENCJI

1. Znajomość podstaw chemii organicznej
2. Znajomość podstaw biologii

### CELE PRZEDMIOTU

C1	Zapoznanie studentów z podstawami projektowania związków biologicznie aktywnych.
C2	Zapoznanie studentów ze sposobami doboru celu projektowania.
C3	Poznanie ekonomicznych aspektów projektowania związków biologicznie czynnych.
C4	Nauczenie procesu projektowania substancji aktywnej.
C5	Poznanie czipów diagnostycznych i urządzeń mikroprzepływowych.

### PRZEDMIOTOWE EFEKTY KSZTAŁCENIA

**Z zakresu wiedzy:**

Osoba, która zaliczyła przedmiot:

PEK\_W01 – zna podstawowe zasady projektowania leków,

PEK\_W02 – rozumie aspekty ekonomiczne i czasowe procesu projektowania,

PEK\_W03 – ma podstawową wiedzę o technikach projektowania leków,

PEK\_W04 – rozumie sposoby terapii celowanej,

PEK\_W05 – potrafi analizować bieżącą literaturę naukową z tematu wykładu.

**Z zakresu umiejętności:**

Osoba, która zaliczyła przedmiot:

PEK\_U01 – potrafi zaprojektować lek dla konkretnej, wybranej choroby.

### TREŚCI PROGRAMOWE

Forma zajęć - wykład		Liczba godzin
Wy1	<b>Ekonomiczne aspekty projektowania leków.</b> Koszty i czas potrzebny na wprowadzenie nowego leku na rynek. Przegląd wiodących firm farmaceutycznych i najlepiej sprzedających się leków na tle przemysłu chemicznego. Przegląd firm produkujących pestycydy. Globalizacja.	2
Wy2	<b>Skryning jako technika poszukiwania nowych substancji biologicznie czynnych.</b> Ilustrowana przykładami historia odkrycia leków metodą skryningu. Ilustracja powiedzenia Ludwika Pasteura „Tylko umysły przygotowane są zdolne do dokonywania prawdziwych odkryć”. Zrandomizowane odkrycia pestycydów.	2
Wy3	<b>Produkty naturalne jako źródło nowych leków i środków ochrony roślin.</b> Historia odkrycia aspiryny, morfiny, artemizyniny, chininy, penicyliny i taksolu jako przykłady długotrwałych procesów prowadzących do substancji biologicznie aktywnej. Nowoczesne metody poszukiwania leków i pestycydów wśród substancji naturalnych - allelopatia.	2
Wy4	<b>Wybór celu projektowania leków na przykładzie AIDS.</b> Fizjologia infekcji ludzkim wirusem braku odporności. Wybór celów projektowania leków – receptory, enzymy, procesy metaboliczne.	2
Wy5	<b>Teoria analogii strukturalnej.</b> Pionierskie prace Ehlicha i Domagka i ich kreatywne rozwinięcie. Analogi izoelektronowe i izosteryczne. Historia odkrycia glifozatu i inhibitorów biosyntezy aminokwasów alifatycznych. Rośliny transgeniczne.	2
Wy6	<b>Praktyczna teoria analogi strukturalnej.</b> Zastępowanie grup funkcyjnych substratów i produktów reakcji enzymatycznych resztami o podobnej strukturze. Stosowane sposoby i triki.	2

	Peptydomimetyki. Projektowanie substancji aktywnych o nieznanym mechanizmie działania.	
Wy7	<b>Teoria analogi strukturalnej – podobieństwo topograficzne.</b> Projektowanie leków w oparciu o trójwymiarową strukturę efektorów enzymów i receptorów.	2
Wy8	<b>Przestrzenna struktura receptora jako templat.</b> Konstrukcja farmakofora, metody komputerowe – QSAR, mechanika i modelowanie molekularne. Krystalografia i NMR a przestrzenna struktura enzymu.	2
Wy9	<b>Inhibitory kowalencyjne.</b> Przegląd inhibitorów nieodwracalnych na stałe wiążących się z enzymami. Zalety i wady takich inhibitorów. Przegląd grup reaktywnych stosowanych w tych inhibitorach.	2
Wy10	<b>Inhibitory samobójcze – konie trojańskie reakcji enzymatycznej.</b> E. Bloch i pierwsze inhibitory samobójcze wymagające obecności dwóch zasad w centrum aktywnym enzymu. Substraty, które przekształcane są przez enzymy w inhibitory kowalencyjne. Reakcja enzymatyczna wiodąca do analogów stanu przejściowego. Inhibitory syntetazy glutaminy.	2
Wy11	<b>Analogi stanu przejściowego.</b> Kinetyczny efekt izotopowy i modelowanie molekularne jako sposoby definiowania struktury stanów przejściowych reakcji enzymatycznych. Fosforany i fosfoniany jako analogi wysokoenergetycznych intermediatów procesów hydrolizy amidów i estrów. Analogi karbokationów. Inhibitory dwusubstratowe.	2
Wy12	<b>Inhibitory wiążące jon metalu w centrum aktywnym enzymu.</b> Historia odkrycia kaptoprilu. Stosowane ligandy w inhibitorach metaloenzymów. Wiązanie metalu versus wiązanie fragmentów organicznych inhibitora.	2
Wy13	<b>Selektywny transport leków do ich miejsc działania.</b> Inwazyjne systemy dostarczania leków (katetery, stenty, implanty). Zastosowanie nanotechnologii w selektywnym transporcie leków: liposomy, pęcherzyki, nanopolimery, nanocząstki, dendrymery itp. Duchy bakteryjne i wirosomy. Prokleki – aktywacja metaboliczna.	2
Wy14	<b>Terapia genowa i terapie nietypowe.</b> Antysensowne DNA, siRNA, rybozomy. Terapia fotodynamiczna, krio- i termoablacja.	2
Wy15	Czipy i urządzenia diagnostyczne.	2
	Suma godzin	<b>30</b>

Forma zajęć - projekt		Liczba godzin
Pr1 Pr2 Pr3	Omówienie komputerowo-wspomaganych metod projektowania związków biologicznie aktywnych – konstrukcja farmakofora, QSAR, modelowanie molekularne. Przegląd dostępnych programów	6
Pr4 do Pr15	Przedstawianie, grupowa dyskusja i konsultacje wybranych przez studentów środków biologicznie aktywnych	24

	Suma godzin	30
--	-------------	----

STOSOWANE NARZĘDZIA DYDAKTYCZNE	
N1	wykład z prezentacją multimedialną
N2	przygotowanie projektu
N3	interaktywny system elektronicznej konsultacji projektu

OCENA OSIĄGNIĘCIA PRZEDMIOTOWYCH EFEKTÓW KSZTAŁCENIA		
Oceny (F – formująca (w trakcie semestru), P – podsumowująca (na koniec semestru))	Numer przedmiotowego efektu kształcenia	Sposób oceny osiągnięcia efektu kształcenia
P (wykład)	PEK_W01 do PEK_W05	Projekt substancji aktywnej dla wybranej przez studenta choroby lub patogena
P (projekt)	PEK_U01	Projekt substancji aktywnej dla wybranej przez studenta choroby lub patogena

LITERATURA PODSTAWOWA I UZUPEŁNIAJĄCA
<p><b><u>LITERATURA PODSTAWOWA:</u></b></p> <p>[1] K. M. Merz, Drug Design, structure and Ligand-Based Approaches, Cambridge University Press, 2010</p> <p>[2] The Organic Chemistry of Drug Design and Drug Action, Academic Press, 2004</p> <p><b><u>LITERATURA UZUPEŁNIAJĄCA:</u></b></p> <p>[1] Textbook of Drug Design and Discovery, eds. T. Liljefors, P. Krosgaard-Larsen &amp; U. Madsen, Taylor &amp; Francis, 2002</p> <p>[2] Medicinal Chemistry and Drug Design, ed. D. Dnkici, Intech (open access), 2012</p> <p>[3] Drug Design. Quantitative Approaches, eds. D. J. Livingstone &amp; A. M. Davies, RSC Publishing, 2012</p> <p>[4] Herbicides and Plant Metabolism, ed. A. D. Ddge, Society of Experimental Biology, 2004</p>

OPIEKUN PRZEDMIOTU (Tytuł, Imię, Nazwisko, adres e-mail)
<b>Prof. dr hab. inż. Paweł Kafarski</b> , pawel.kafarski@pwr.wroc.pl

## MACIERZ POWIĄZANIA EFEKTÓW KSZTAŁCENIA DLA PRZEDMIOTU

Chemia ogólna

### Z EFEKTAMI KSZTAŁCENIA NA KIERUNKU

(wszystkie kierunki Wydziału Chemicznego)

<b>Przedmiotowy efekt kształcenia</b>	<b>Odniesienie przedmiotowego efektu do efektów kształcenia zdefiniowanych dla kierunku studiów i specjalności (o ile dotyczy)**</b>	<b>Cele przedmiotu ***</b>	<b>Treści programowe ***</b>	<b>Narzędzia dydaktyczne ***</b>
<b>(wiedza) PEK_W01 PEK-W03</b>	S2bt2_W05	C1, C2	W2, W4-W12	N1, N2
<b>PEK_W02</b>	S2bt2_W05	C3	Wy1	N1
<b>PEK_W04</b>	S2bt2_W05	C1	W13,W14	N-1
<b>PEK_W01 PEK-W03</b>	S2bt2_W03, S2bt2_W05	C1,	W3	N-1
<b>PEK_W01</b>	S2bt2_W05	C5	W15	N-1
<b>PEK_U01</b>	S2bt2_W05	C1, C4	Pr01 do Pr15	N2, N3

\*\* - wpisać symbole kierunkowych/specjalnościowych efektów kształcenia

\*\*\* - odpowiednie symbole z tabel powyżej