**ПЛОВДИВСКИ УНИВЕРСИТЕТ «ПАИСИЙ ХИЛЕНДАРСКИ»**

**Учебен курс**

**Факултет**

Химически

**Катедра**

Органична химия

**Професионално направление (на курса)**

1.3. Педагогика на обучението по …………

**Специалност**

Биология и химия (редовно обучение)

**ОПИСАНИЕ**

1. **Наименование на курса**

Химия на лекарствените вещества

1. **Код на курса**
2. **Тип на курса**

избираем

1. **Равнище на курса (ОКС)**

бакалавър

1. **Година на обучение**

втора

1. **Семестър**

пети

1. **Брой ECTS кредити**

2

1. **Име на лектора**

проф. д-р Илиян Иванов

1. **Учебни резултати за курса** **– усвоени знания, умения, компетенции (цели)**

Успешно завършилите обучението по този учебен курс:

1. *ще знаят*:

* Основните методи за синтез и анализ на лекарствени вещества;
* Зависимостта между химическата структура на веществата и биологичната активност.
* Механизма на лекарствено действие.
* Основните принципите на фармакокинетиката и фармакодинамиката.

1. *ще могат***:**

* самостоятелно да синтезират, изолират и идентифицират химични съединения с биологична активност.

1. **Начин на преподаване**

Аудиторно: 30 ч. - лекции.

Извън аудиторно: 30 ч. - самостоятелна подготовка, консултации.

1. **Предварителни изисквания (знания и умения от предходно обучение) и изисквания за други (едновременни) курсове**

Студентите трябва:

* Задължително да са изучавали курсовете по: Обща и неорганична химия; Аналитична химия, Органична химия.
* Да имат познания по следните теми:

-да познават и прилагат общите теоретични принципи на органичната химия.

-свойствата на основните класове органични съединения.

1. **Препоръчани избираеми програмни компоненти**

Химия на хетероциклените съединения

1. **Съдържание на курса**

**13 А. Общо описание (анотация)**

По своята структура и съдържание настоящата програма е съобразена с изложения в съвременните учебници по медицинска химия учебен материал. Програмата представлява естествено продължение на лекционните курсове по Органична химия и е максимално съобразена с необходимостта на студентите от познания по Химия на лекарствените вещества. Особено внимание при изложението е отделено на строежа на лекарствените средства, механизма на лекарственото действие, зависимостта между химическата структура и биологично действие, химизма на протичащите в живия организъм процеси на усвояване и биотрансформация на лекарствените вещества. По обясними причини, в хода на горното изложение са въведени термини и понятия и са разгледани процеси, които са обект на изучаване от други науки (биоорганична химия, биохимия, анатомия и физиология на човека). Основна задача е подготовката на студентите в областта на анализ и синтез на физиологично активни вещества и лекарствени препарати.

**13.Б. Тематично съдържание на учебната дисциплина**

**а) лекции – 30 часа**

**Лекция № 1 –** 2 часа

Тема: Лекарствени вещества. Предмет, задачи и развитие на химията на лекарствените вещества. Перспективи и пътища за създаване на нови лекарствени вещества. Закон за лекарствата и аптеките в хуманната медицина. Класификация на лекарствените вещества. Видове класификации на лекарствените вещества и приложението им. Наименования на лекарствата.

**Лекция № 2 –** 2 часа

Тема: Източници на лекарствени вещества- синтетични, растителни, морски, микроорганизми. Синтетичният дизайн като подход за създаване на нови лекарства. Етапи в създаването на нови лекарства, патентен контрол. Съвременни изисквания към лекарствените вещества. Основни болести при човека и водещи групи лекарствени вещества на съвременният фармацевтичен пазар.

**Лекция № 3 –** 2 часа

Тема: Фармакокинетика на лекарствените вещества. Класификация на фармакокинетичните свойства Значение на фармакокинетиката при създаване на лекарства. Анализи на концентрацията на лекарствата и терапевтичното им значение. Фармакокинетични модели. Стабилност на лекарствените вещества. Методи и начини за приемане на лекарства. Фармакокинетична фаза. Абсорбция, разпределение, метаболизъм и елиминиране на лекарствата в организма

**Лекция № 4 –** 2 часа

Тема: Фармакодинамика. Лекарствено действие и лекарствен ефект. Етапи във взаимодействието на лекарствените вещества и клетъчните рецептори. Взаимодействия на лекарствени вещества с рецептори. Структурно специфично действие. Агонисти и антагонисти –примери. Предлекарства. Лекарствени взаимодействия.

**Лекция № 5 –** 2 часа

Тема: Лекарствени вещества, повлияващи нервната система. Анестетици. Общи анестетици- инхалационни и инжекционни средства за наркоза. Класификация. Представители- строеж и методи за получаване. Локални анестетици-представители.

**Лекция № 6 –** 2часа

Тема: Сънотворни лекарствени вещества. Барбитурати – структура, методи за получаване. Бензодиазепини. Съвременни сънотворни средства. „Идеалното” сънотворно средство. Лекарствени вещества с антиконвулсивно действие – антиепилептични средства. Представители – барбитурати, дифенин, карбамазепин, валпроат. Методи за получаване. Свойства.

**Лекция № 7 –** 2часа

Тема: Психотропни лекарствени средства. Невролептици. Препарати съдържащи фенотиазиново ядро- методи за получаване, свойства. Анксиолитици – представители, методи за получаване, метаболизъм. Връзка структура – активност в зависимост от заместителите в бензодиазепиновата молекула. Основни методи за синтез на бензодиазепини. Представители- лексотан, диазепам и др.

**Лекция № 8 –** 2 часа

Тема: Химиотерапевтични средства. Противомикробни, противовирусни и противопаразитни препарати. Антибактериални лекарствени вещества. Класификация. Свойства и приложение. Антибиотици. Класификация- според структура, произход, приложение. Бактерицидно и бактериостатично действие. Понятие за резистентност и начини за преодоляването и.

**Лекция № 9 –** 2 часа

Тема: Пеницилинови антибиотици. Природни и полусинтетични пеницилини. Пеницилин G- строеж и стереохимия на пеницилиновата молекула. Механизъм на бактерицидното действие на пеницилина. Пеницилини с пролонгирано действие. Полусинтетични бета-лактамазаустойчиви пеницилини. Полусинтетични широкоспектърни пеницилини – аминопеницилини, карбоксипеницилини, ацилуреидопеницилини и др.

**Лекция № 10 –** 2 часа

Тема: Сулфонамидни антибактериални лекарствени вещества. Класификация. Механизъм на противомикробното действие. Методи за синтез на сулфонамидни лекарствени вещества. Сулфонамидни лекарствени вещества с диуретично и антидиабетично действие.

**Лекция № 11 –** 2 часа

Тема: Болкоуспокояващи (аналгетични) и нестероидни противовъзпалителни средства. Аналгетици- класификация. Аналгетици с наркотично действие – морфин и сходни по структура алкалоиди (опиати); синтетични съединения притежаващи подобни свойства (опиоди)- димерол, промедол, фентанил. Механизъм на действие на наркотичните аналгетици. Зависимост структура- биологично действие. Агонисти и антагонисти на морфин. Тотален синтез на морфин.

**Лекция № 12 –** 2 часа

Тема: Препарати за лечение на онкологични заболявания. Класификация на противораковите средства. Алкилиращи вещества (бис--хлоретиламини, етилимини (етиленимини), акилсулфонати, нитрозокарбамиди, триазени)-структура и получаване. Антиметаболити (аналози на фолиевата киселина, на пурините и пиримидините). Вещества от природен произход - алкалоиди, антибиотици и др. структура и свойства.

**Лекция № 13 -** 2 часа

Тема: Лекарствени средства влияещи на сърдечносъдовата система. Лекарствени вещества подобряващи помпената функция на сърцето. Гликозиди – състав, структура, гликон, агликонна част. Сърдечни гликозиди. Дигиталисови алкалоиди- строеж, стереохимия. Дигоксин. Негликозиди. Вазодилататори. Нитроглицерин – синтез, свойства, приложение. Нитролонг. Пептиди- АСЕ инхибитори (антихипертензивни средства) – Enalapril.

**Лекция № 14 –** 2 часа

Тема: Лекарствени средства влияещи на сърдечносъдовата система. Лекарствени вещества подобряващи помпената функция на сърцето. Гликозиди – състав, структура, гликон, агликонна част. Сърдечни гликозиди. Дигиталисови алкалоиди- строеж, стереохимия. Дигоксин. Негликозиди. Вазодилататори. Нитроглицерин – синтез, свойства, приложение. Нитролонг. Пептиди- АСЕ инхибитори (антихипертензивни средства) – Enalapril.

**Лекция № 15 –** 2 часа

Тема: Лекарствени взаимодействия. Взаимодействия на фармацевтично (in vitro) и фармакокинетично ниво. Взаимодействия на фармакодинамично ниво – антагонизъм, синергизъм, синергоантагонизъм.

13.В. **Техническо осигуряване на обучението**

* съвременни средства за обучение – оборудвана компютърна зала и мултимедия.
* on-line достъп до ScienceDirect, ISI Web of Knowledge, in-silico тестове за биологична активност;
* специализиран софтуер.

1. **Библиография (основни заглавия)**

|  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- |
| ***Автор*** | ***Заглавие*** | ***Издателство*** | ***Година*** |
| М. Христов | Лекарствени продукти | Екопрогрес | 2006 |
| А. Антонова | Химия на лекарствата | Сиела, София | 2005 |
| Р. С. Вартанян | Синтез основных лекарственных средств | МИА, Москва, | 2004 |
| Douglas S. Johnson and Jie Jack Li | The art of drug synthesis | John Wiley & Sons, Inc., | 2007 |
| R.S. Vardanyan and V.J. Hruby | Synthesis of Essential Drugs | Elsevier | 2006 |
| И.Ламбев; И.Крушков | Фармакотерапевтичен справочник | АРСО, София | 2010 |
| A. Kar | Advanced Practical Medicinal Chemistry | New Age International (P) Ltd. | 2004 |

1. **Планирани учебни дейности и методи на преподаване**

Лекциите започват с основни въпроси на химията на лекарствените вещества, включващи класификация на лекарствените вещества, етапи в създаването на нови лекарства, фармакокинетиката и фармакодинамиката. Всяка тема от програмата се поднася като мултимедийна презентация, което позволява студентите да получават нагледна представа за разглеждания теоретичен материал. Предоставят се поредица научно-популярни и документални филми третиращи различни аспекти свързани с лекарствените средства.

Поредността на темите е подбрана рационално за осъществяване на по-добра вертикална и хоризонтална интеграция на преподаването и допринася за по-ефективното усвояване на преподавания материал.

Лекционния материал се предоставя на студентите в електронен вид.

1. **Методи и критерии на оценяване**

В Учебния план за спец. БХ е предвидено ИД IV да приключи с текуща оценка. Текущото оценяване се провежда съгласно чл. 48 от Правилника за учебната дейност и включва решаване на тест в началото на всеки лекционен блок съставен като активни така също и пасивни въпроси от материал разгледан в предходната лекция.

Критерии за оценяване: под 39% верни отговори – слаб, от 40 до 54% среден, 55-69% добър, 70-84% много добър, над 85% отличен.

Получилите слаба оценка на текущия контрол студенти, съгласно чл. 48(5) от същия правилник се явяват на изпит (тест върху целия лекционен материал) само по време на поправителна или ликвидационна сесия.

1. **Език на преподаване**

**български**

1. **Стажове/практика**

не се предвижда

1. **Изготвил описанието**

проф. д-р И. Иванов