

Karta przedmiotu

Cz. 1

Informacje ogólne o przedmiocie		
1. Kierunek studiów: Farmacja	2. Poziom kształcenia: jednolite studia magisterskie	
	3. Forma studiów: stacjonarne	
4. Rok: IV	5. Semestr: VIII	
6. Nazwa przedmiotu: Biotransformacja i metabolizm leku		
7. Status przedmiotu: obowiązkowy		
8. Treści programowe przedmiotu i przypisane do nich efekty uczenia się		
Zapoznanie z procesami chemicznymi i biochemicznymi, jakim podlegają substancje lecznicze (S.L.) w organizmie człowieka. Enzymologia I, II i III fazy przemian S.L. Znaczenie kliniczne czynników dziedzicznych, m.in. polimorfizmów genów determinujących cechy fenotypowe związane z biotransformacją/metabolizmem S.L. w kontekście optymalizacji farmakoterapii. Wpływ czynników fizjologicznych, patologicznych i środowiskowych (z uwzględnieniem stylu życia i udziału flory jelitowej) na skuteczność i bezpieczeństwo stosowania leków w aspekcie procesów aktywacji i detoksykacji S.L.		
Efekty uczenia się/odniesienie do efektów uczenia się zawartych w standardach		
w zakresie wiedzy student zna i rozumie: D.W4, D.W6, D.W7, D.W8, D.W19, D.W22, D.W24, D.W35;		
w zakresie umiejętności student potrafi: D.U10, D.U12, D.U13, D.U15, D.U17, D.U19, D.U28, D.U29, D.U30;		
w zakresie kompetencji społecznych student jest gotów do:		
dostrzegania i rozpoznawania własnych ograniczeń, dokonywania samooceny deficytów i potrzeb edukacyjnych; korzystania z obiektywnych źródeł informacji; formułowania wniosków z własnych pomiarów lub obserwacji; przyjęcia odpowiedzialności związanej z decyzjami podejmowanymi w ramach działalności zawodowej, w tym w kategoriach bezpieczeństwa własnego i innych osób.		
9. Liczba godzin z przedmiotu		90
10. Liczba punktów ECTS dla przedmiotu		6
11. Sposoby weryfikacji i oceny efektów uczenia się		
Efekty uczenia się	Sposoby weryfikacji	Sposoby oceny
W zakresie wiedzy	Sprawdzian pisemny – pytania otwarte Zaliczenie na ocenę – test wyboru	*
W zakresie umiejętności	Sprawozdanie Obserwacja Egzamin praktyczny	*
W zakresie kompetencji	Obserwacja	*

* zakłada się, że ocena oznacza na poziomie:

- Bardzo dobry (5,0)** – zakładane efekty uczenia się zostały osiągnięte i w znacznym stopniu przekraczają wymagany poziom;
- Ponad dobry (4,5)** – zakładane efekty uczenia się zostały osiągnięte i w niewielkim stopniu przekraczają wymagany poziom;
- Dobry (4,0)** – zakładane efekty uczenia się zostały osiągnięte na wymaganym poziomie;
- Dość dobry (3,5)** – zakładane efekty uczenia się zostały osiągnięte na średnim wymaganym poziomie;
- Dostateczny (3,0)** – zakładane efekty uczenia się zostały osiągnięte na minimalnym wymaganym poziomie;
- Niedostateczny (2,0)** – zakładane efekty uczenia się nie zostały uzyskane.

Karta przedmiotu

Cz. 2

Inne przydatne informacje o przedmiocie		
12. Jednostka realizująca przedmiot, adres, e-mail: Katedra i Zakład Biofarmacji, ul. Jedności 8, 41-200 Sosnowiec, 32 364 12 48; www.biofarmacja.sum.edu.pl		
13. Imię i nazwisko osoby odpowiedzialnej za realizację przedmiotu: dr hab. n. farm. Alicja Zajdel; azajdel@sum.edu.pl		
14. Wymagania wstępne w zakresie wiedzy, umiejętności i innych kompetencji: Znajomość zagadnień związanych z losami leków opisanych przez procesy wchłaniania, dystrybucji i eliminacji oraz strukturą chemiczną związków farmakologicznie aktywnych.		
15. Liczebność grup	Zgodna z uchwałą Senatu SUM	
16. Materiały do zajęć	Materiały dydaktyczne do seminariów zamieszczone na stronie www.biofarmacja.sum.edu.pl ; instrukcje do ćwiczeń: aparatura laboratoryjna na wyposażeniu pracowni	
17. Miejsce odbywania się zajęć	w salach ogólnodostępnych Wydziału Nauk Farmaceutycznego SUM	
18. Miejsce i godzina konsultacji	do uzgodnienia z osobami prowadzącymi zajęcia	
19. Efekty uczenia się		
Numer przedmiotowego efektu uczenia się	Przedmiotowe efekty uczenia się	Odniesienie do efektów uczenia się zawartych w standardach
P_W01	Zna i rozumie procesy, jakim powinna podlegać S.L. w organizmie oraz tłumaczy uwarunkowania fizjologiczne, patofizjologiczne i środowiskowe mogące wpływać na przebieg jej biotransformacji czy metabolizmu w aspekcie skuteczności i bezpieczeństwa farmakoterapii.	D.W4. D.W6. D.W8. D.W22. D.W24.
P_W02	Identyfikuje problemy wzajemnego oddziaływania między lekami oraz między lekami a składnikami pożywienia na etapach wchłaniania (enzymy jelitowe i wątrobowe odpowiedzialne za efekt pierwszego przejścia) oraz biotransformacji/metabolizmu S.L. i wie jak tym problemom można zapobiec.	D.W7. D.W19. D.W24. D.W35.
P_U01	Analizuje mikrosomalne i pozamikrosomalne procesy, jakim podlega S.L. w organizmie człowieka oraz ocenia ich kliniczne znaczenie w aktywacji metabolicznej i detoksykacji.	D.U12. D.U17. D.U19.
P_U02	Ocenia wpływ poszczególnych czynników fizjologicznych, patologicznych i środowiskowych (z uwzględnieniem stylu życia i udziału flory jelitowej) na skuteczność i bezpieczeństwo stosowania leków oraz przedstawia mechanizmy tych oddziaływań w aspekcie biotransformacji/metabolizmu S.L.	D.U10. D.U13. D.U15. D.U28. D.U29. D.U30.
P_U03	Szacuje wpływ czynników dziedzicznych, m.in. polimorfizmów genów determinujących cechy fenotypowe związane z biotransformacją/metabolizmem S.L. w kontekście optymalizacji farmakoterapii.	D.U12. D.U13. D.U17. D.U19.
20. Formy i tematy zajęć		Liczba godzin
21.1. Wykłady		30
Charakterystyka przedmiotu oraz cele jego nauczania. Przedstawienie i omówienie harmonogramów: wykładów, zajęć seminaryjnych i laboratoryjnych, wymagań stawianych studentom, procedur zaliczania zajęć seminaryjnych i laboratoryjnych oraz warunków zaliczenia na ocenę przedmiotu.		2

Typy reakcji chemicznych I fazy i ich komórkowa i pozakomórkowa lokalizacja. Enzymy uczestniczące w I fazie biotransformacji substancji leczniczych (S.L.).	2
Charakterystyka białek CYP. Nomenklatura i klasyfikacja superrodziny CYP. Lokalizacja CYP w tkankach człowieka. Budowa i charakterystyka substratowa CYP. Przykłady najważniejszych typów reakcji katalizowanych przez CYP.	2
Cykl katalityczny CYP. Reduktazy w cyklu CYP. Cykl katalityczny reduktazy NADPH-cytochrom P450 (CPR). Rola CPR w przemianach S.L. Charakterystyka wybranych CYP.	2
Mechanizmy regulacji ekspresji i aktywności CYP. Aspekt kliniczny zmian aktywności CYP.	2
Istotne klinicznie polimorfizmy genów CYP biorących udział w biotransformacji/metabolizmie leków. Potencjalne przyczyny indywidualnych różnic w skuteczności i bezpieczeństwie farmakoterapii.	2
CYP jako biomarkery i potencjalne cele oddziaływania w chemoprewencji i terapii nowotworów. Zastosowania CYP w biotechnologii, projektowaniu i badaniach leków.	2
Mikrosomalne przemiany S.L. niezwiązane z CYP. Charakterystyka monooksygenaz flawinowych (FMO). Budowa i charakterystyka substratowa FMO. Przykłady najważniejszych typów reakcji katalizowanych przez FMO. Cykl katalityczny FMO. Reakcje I fazy niezwiązane z utlenianiem S.L. Procesy redukcji, hydrolizy, dehalogenizacji.	2
Pozamikrosomalne przemiany oksydacyjne S.L. Budowa, aktywność i charakterystyka substratowa m.in. dehydrogenazy alkoholowej, dehydrogenazy aldehydowej, oksydazy ksantynowej, oksydazy aldehydowej, oksydazy monoaminowej w aspekcie biotransformacji S.L.	2
II faza przemian biochemicznych S.L. Mechanizmy regulacji procesów II fazy biotransformacji. Glukuronidacja. Budowa i charakterystyka substratowa UDP-glukuronylotransferaz (UGT). Udział poszczególnych izoform UGT w biotransformacji leków. Interakcje z udziałem UGT, a skuteczność i bezpieczeństwo farmakoterapii. Glukuronidy, jako proleki. Reaktywne (toksyczne) produkty glukuronidacji S.L. lub jej metabolitów.	2
II faza przemian biochemicznych S.L. Sulfatacja. Budowa i charakterystyka substratowa sulfotransferaz (SULT). Udział poszczególnych izoform SULT w biotransformacji leków. Acetylacja - budowa i charakterystyka substratowa acetylotransferaz. Zmienność fenotypowa N- acetylotransferaz a bezpieczeństwo farmakoterapii. Metylacja.	2
Udział flory jelitowej w przemianach S.L. Enzymy mikroorganizmów jelitowych biorące udział w przemianach S.L. lub jej metabolitów.	2
Wpływ składników pokarmowych na aktywność enzymów I, II i III fazy biotransformacji. Interakcje między lekami a pożywieniem w fazie biotransformacji w aspekcie skuteczności i bezpieczeństwa farmakoterapii.	2
Czynniki endogenne i egzogenne a aktywność enzymów I, II i III fazy biotransformacji. Wpływ wieku, płci, stylu życia, środowiska na przemiany S.L. w organizmie ludzkim.	2
Niepożądane reakcje na leki związane z procesem ich biotransformacji.	2
22.2. Seminaria	30
Podstawowe pojęcia i definicje z zakresu biotransformacji i metabolizmu leków. Biochemiczne podstawy procesu biotransformacji S.L. Znaczenie biotransformacji/metabolizmu z punktu widzenia farmakoterapii.	2
Metody badania przebiegu procesu biotransformacji i metabolizmu leków na poziomie molekularnym, komórkowym, narządowym oraz populacyjnym.	2
Biochemiczne parametry hepatodiagnostyczne istotne z punktu widzenia procesu biotransformacji i metabolizmu leków.	2
Przemiany biochemiczne determinujące działanie proleków.	2
Rola glutationu w przemianach komórkowych i pozakomórkowych. Reakcje sprzęgania	2

ksenobiotyków z glutationem i aminokwasami.	
Białka III fazy biotransformacji leków. Oporność wielolekowa i strategie przeciwdziałania	2
Rola, właściwości i przemiany biochemiczne wielonienasyconych kwasów tłuszczowych.	2
Biotransformacja wybranych leków stosowanych w terapii nadciśnienia.	2
Biotransformacja wybranych leków stosowanych w kardiologii.	2
Biotransformacja najczęściej stosowanych narkotycznych leków przeciwbólowych.	2
Biotransformacja wybranych leków przeciwdepresyjnych.	2
Biotransformacja wybranych niesteroidowych leków przeciwzapalnych.	2
Rola polimorfizmów genetycznych w metabolizmie leków przeciwnowotworowych.	2
Biotransformacja wybranych leków stosowanych w terapii cukrzycy oraz dyslipidemii.	2
Sprawdzenie umiejętności przewidywania przemian S.L. z uwzględnieniem wpływu cech fenotypowych człowieka oraz czynników fizjologicznych, patologicznych i środowiskowych w kontekście optymalizacji i bezpieczeństwa farmakoterapii.	2
23.3. Ćwiczenia	30
Oznaczanie metabolitów bakterii kwasu mlekowego w materiale biologicznym i preparatach farmaceutycznych.	5
Oznaczanie glutationu jako markera mikrosomalnej przemiany paracetamolu.	5
Wpływ sulfasalazyny na aktywność transferazy glutationowej (GST) w komórkach Caco-2.	5
Oznaczanie metabolitów paracetamolu w materiale biologicznym.	5
Określenie aktywności NADPH zależnej reduktazy cytochromu P450 (CPR) metodą spektrofotometryczną przy wykorzystaniu 3-(4,5-dimetylo-2-tiazolilo)-2,5-difenylotetrazolu bromku (MTT).	5
Prowadzenie hodowli komórkowych, jako eksperymentalnego modelu badania biotransformacji leków.	5
24. Literatura	
1. Biochemiczne i molekularne podstawy biotransformacji ksenobiotyków. M. Cichocki, Uniwersytet Medyczny im. Karola Marcinkowskiego, Poznań 2015. 2. Drug metabolism in drug design and development. Ed. D. Zhang, M. Zhu. G. Humphreys, Wiley-interscience, 2007 3. Enzyme systems that metabolise drugs and other xenobiotics. Ed. Costas Ioannides, John Wiley&Sons,LTD 2002 4. Hydrolysis in drug and prodrug metabolism. Ed. B. Testa, J. M. Mayer, Wiley-VCH, 2003, 5. Aktualne publikacje związane z tematyką przedmiotu.	
25. Kryteria oceny – szczegóły	
Zgodnie z zaleceniami organów kontrolujących. Zaliczenie przedmiotu – student osiągnął zakładane efekty uczenia się. Szczegółowe kryteria zaliczenia i oceny z przedmiotu są zamieszczone w regulaminie przedmiotu.	