

عنوان درس: شیمی دارویی ۱

مخاطبان: دانشجویان ترم هفتم دکترای حرفه‌ای داروسازی

تعداد و نوع واحد: ۳ واحد نظری

درس پیش نیاز: شیمی آلی و فارماکولوژی

زمان ارائه درس: دوشنبه، چهارشنبه ۱۰-۸

ساعت مشاوره:

مدرس: دکتر علی آبادی، دکتر نوروزی

هدف کلی درس: آشنایی دانشجویان با تاریخچه، کاربرد شیمی دارویی و ساختار داروهای شیمیایی، آشنایی با رابطه بین ساختار شیمیایی و مکانیسم اثر (فارماکودینامیک) و همچنین رابطه ساختار شیمیایی با فارماکوکینتیک (جذب، توزیع، متابولیسم، دفع و اتصال پروتئینی) و عوارض جانبی داروها، آشنایی با روش‌های منطقی طراحی دارو

اهداف کلی جلسات:

- ۱- تأثیر خصوصیات فیزیکوشیمیایی در فارماکوکینتیک داروها
- ۲- ساختمان رسپتور و نیروهای دخیل در برهمکنش دارو با رسپتور
- ۳- مسیرهای متابولیسم و رابطه ساختمان و متابولیسم داروها
- ۴- مسیرهای متابولیسم و رابطه ساختمان و متابولیسم داروها
- ۵- بیوایزواسترها
- ۶- روشهای طراحی دارو شامل QSAR و داکینگ
- ۷- سولفونامیدها (تاریخچه، مکانیسم اثر، SAR و آشنایی با ساختار داروها)
- ۸- سولفونامیدها (سولفون‌ها، مهارکننده‌های DHFR، ...)
- ۹- پنی‌سیلین‌ها
- ۱۰- کارباپنم‌ها، مونوباکتام‌ها و مهارکننده‌های بتالاکتاماز
- ۱۱- سفالوسپورین‌ها (مکانیسم اثر، سفالوسپورین‌های نسل اول و دوم)
- ۱۲- سفالوسپورین‌ها (سفالوسپورین‌های نسل سوم و چهارم)
- ۱۳- کینولون‌ها
- ۱۴- تتراسیکلین‌ها
- ۱۵- آمینوگلیکوزیدها
- ۱۶- ماکرولیدها، آلفنیکل‌ها
- ۱۷- لینکوز آمیدها، اکسازولیدینون‌ها
- ۱۸- داروهای ضد انگل، ضد کرم و ضد آمیب (نیتروآریل‌ها و ...)
- ۱۹- داروهای ضد مالاریا
- ۲۰- داروهای ضد قارچ
- ۲۱- داروهای ضد ویروس

۲۲- داروهای ضد سل

۲۳- آنتی سبتیک ها

۲۴- رادیوایپک ها (داروهای رادیولوژی و عوامل تشخیصی)

اهداف ویژه رفتاری به تفکیک اهداف کلی هر جلسه

جلسه اول

هدف کلی: تأثیر خصوصیات فیزیکوشیمیایی در فارماکوکینتیک داروها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

- ۱-۱- تأثیر خواص فیزیکوشیمیایی را در جذب گوارشی توضیح دهد.
- ۱-۲- قانون لی پینسکی را برای یک ترکیب شیمیایی مورد بررسی قرار دهد.
- ۱-۳- خواص فیزیکوشیمیایی دخیل در فارماکوکینتیک را نام ببرد.
- ۱-۴- نقش لیپوفیلیسته را در فارماکوکینتیک توضیح دهد.
- ۱-۵- نقش pK_a را در فارماکوکینتیک توضیح دهد.
- ۱-۶- نقش حل پذیری (Solubility) را در فارماکوکینتیک توضیح دهد.
- ۱-۷- نقش نفوذپذیری را در فارماکوکینتیک توضیح دهد.
- ۱-۸- روش های اصلاح ساختار شیمیایی جهت بهینه کردن خواص فیزیکوشیمیایی و فارماکوکینتیک را توضیح دهد.

جلسه دوم

هدف کلی: ساختمان رسپتور و نیروهای دخیل در برهمکنش دارو با رسپتور

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

- ۱-۲- رسپتور را تعریف کند.
- ۲-۲- انواع رسپتورها را نام ببرد.
- ۳-۲- انواع برهمکنش های بین لیگاند و رسپتور را نام ببرد.
- ۴-۲- انواع برهمکنش های بین لیگاند و رسپتور را توضیح دهد.

۲-۵- رابطه بین گروه‌های عاملی مختلف و نوع برهمکنش مربوطه را توضیح دهد.

جلسه سوم

هدف کلی: مسیرهای متابولیسم و رابطه ساختمان و متابولیسم داروها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۳-۱- فازهای مختلف متابولیسم را شرح دهد.

۳-۲- واکنش‌های مختلف متابولیسم فاز I را نام ببرد.

۳-۳- با توجه به ساختار شیمیایی داروها، راههای احتمالی متابولیسم آنها را در فاز I پیش بینی کند.

جلسه چهارم

هدف کلی: مسیرهای متابولیسم و رابطه ساختمان و متابولیسم داروها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۴-۱- واکنش‌های مختلف متابولیسم فاز II را نام ببرد.

۴-۲- با توجه به ساختار شیمیایی داروها، راههای احتمالی متابولیسم آنها را در فاز II پیش بینی کند.

جلسه پنجم

هدف کلی: بیوایزواسترها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۵-۱- قوانین بیوایزوستری را نام ببرد.

۵-۲- انواع بیوایزوسترها را توضیح دهد.

۵-۳- دلایل استفاده از بیوایزواسترها را توضیح دهد.

جلسه ششم

هدف کلی: روشهای طراحی دارو شامل QSAR و داکینگ

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱-۶- واژه‌های تخصصی مانند Bioinformatics، Chemoinformatics، Drug design، QSAR، Docking و ... را تعریف کند.

۲-۶- روش QSAR را توضیح دهد.

۳-۶- نرم افزارهای مورد استفاده جهت QSAR را نام ببرد.

۴-۶- روش Docking را توضیح دهد.

۵-۶- نرم افزارهای مورد استفاده جهت Docking را نام ببرد.

جلسه هفتم

هدف کلی: سولفونامیدها(تاریخچه، مکانیسم اثر، SAR و آشنایی با ساختار داروها)

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱-۷- مکانیسم اثر سولفونامیدها را توضیح دهد.

۲-۷- ساختار سولفونامیدهای آنتی باکتریال را تشخیص دهد.

۳-۷- رابطه ساختار با فعالیت آنتی باکتریال سولفونامیدها را توضیح دهد.

۴-۷- طیف اثر سولفونامیدها را از روی ساختار توضیح دهد.

۵-۷- رابطه ساختار با فارماکوکینتیک سولفونامیدها را توضیح دهد.

۶-۷- رابطه ساختار با عوارض جانبی سولفونامیدها را توضیح دهد.

جلسه هشتم

هدف کلی: سولفونامیدها(سولفونها، مهارکننده‌های DHFR، ...)

اهداف ویژه: در پایان دانشجو قادر باشد.

۸-۱- مکانیسم اثر سولفون‌ها را توضیح دهد.

۸-۲- رابطه ساختار با فعالیت آنتی‌باکتریال سولفون‌ها را توضیح دهد.

۸-۳- ساختار مهارکننده‌های دی‌هیدروفولات ردوکتاز را تشخیص دهد.

۸-۴- کاربرد مهارکننده‌های دی‌هیدروفولات ردوکتاز را بیان کند.

جلسه نهم

هدف کلی: پنی‌سیلین‌ها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۹-۱- مکانیسم اثر پنی‌سیلین‌ها را توضیح دهد.

۹-۲- رابطه ساختار با فعالیت آنتی‌باکتریال پنی‌سیلین‌ها را توضیح دهد.

۹-۳- عوامل موثر در پایداری پنی‌سیلین‌ها را توضیح دهد.

۹-۴- عوامل موثر در فارماکوکینتیک (جذب، طول اثر و ...) پنی‌سیلین‌ها را توضیح دهد.

۹-۵- دانشجو قادر به نامگذاری پنی‌سیلین‌ها باشد.

جلسه دهم

هدف کلی: کارباینم‌ها، مونوباکتام‌ها و مهارکننده‌های بتالاکتاماز

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱۰-۱- ساختار کارباینم‌ها را تشخیص دهد.

۱۰-۲- مکانیسم و طیف اثر کارباینم‌ها را توضیح دهد.

۱۰-۳- ساختار مونوباکتم‌ها را تشخیص دهد.

۱۰-۴- مکانیسم طیف اثر مونوباکتام‌ها را توضیح دهد.

۱۰-۵- ساختار مهارکننده‌های بتا لاکتاماز را تشخیص دهد.

۱۰-۶- مکانیسم و طیف اثر مهارکننده‌های بتا لاکتاماز را توضیح دهد.

جلسه یازدهم

هدف کلی: سفالوسپورین‌ها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱۱-۱- مکانیسم اثر سفالوسپورین‌ها را توضیح دهد.

۱۱-۲- رابطه ساختار با فعالیت آن‌تی باکتریال سفالوسپورین‌ها را توضیح دهد.

۱۱-۳- عوامل موثر در پایداری سفالوسپورین‌ها را توضیح دهد.

۱۱-۴- عوامل موثر در فارماکوکینتیک (جذب، طول اثر و ...) سفالوسپورین‌ها را توضیح دهد.

۱۱-۵- دانشجو قادر به نامگذاری سفالوسپورین‌ها باشد.

جلسه دوازدهم

هدف کلی: سفالوسپورین‌ها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱۲-۱- نسل مربوط به هر سفالوسپورین را تشخیص دهد.

۱۲-۱- رابطه ساختار با عوارض جانبی سفالوسپورین‌ها را توضیح دهد.

۱۲-۱- سفالوسپورین‌های مقاوم به بتا لاکتاماز تشخیص دهد.

جلسه سیزدهم

هدف کلی: کینولون‌ها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱-۱۳- مکانیسم اثر فلوروکینولون‌ها را توضیح دهد.

۲-۱۳- رابطه ساختار با فعالیت آنتی باکتریال فلوروکینولون‌ها را توضیح دهد.

۳-۱۳- رابطه ساختار با عوارض جانبی فلوروکینولون‌ها را توضیح دهد.

۴-۱۳- عوامل موثر در فارماکوکینتیک (جذب، طول اثر و ...) فلوروکینولون‌ها را توضیح دهد.

۵-۱۳- دانشجو قادر به نامگذاری فلوروکینولون‌ها باشد.

۶-۱۳- راه‌های مقاومت به فلوروکینولون‌ها را شرح دهد.

جلسه چهاردهم

هدف کلی: تتراسیکلین‌ها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱-۱۴- مکانیسم اثر تتراسیکلین‌ها را توضیح دهد.

۲-۱۴- رابطه ساختار با فعالیت آنتی باکتریال تتراسیکلین‌ها را توضیح دهد.

۳-۱۴- رابطه ساختار با عوارض جانبی تتراسیکلین‌ها را توضیح دهد.

۴-۱۴- عوامل موثر در فارماکوکینتیک (جذب، طول اثر و ...) تتراسیکلین‌ها را توضیح دهد.

۵-۱۴- دانشجو قادر به نامگذاری تتراسیکلین‌ها باشد.

۶-۱۴- عوامل موثر در پایداری تتراسیکلین‌ها را توضیح دهد.

۷-۱۴- راه‌های مقاومت به تتراسیکلین‌ها را شرح دهد.

جلسه پانزدهم

هدف کلی: آمینو گلیکوزیدها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱-۱۵- مکانیسم اثر آمینو گلیکوزیدها را توضیح دهد.

۲-۱۵- رابطه ساختار با فعالیت آنتی باکتریال آمینو گلیکوزیدها را توضیح دهد.

۳-۱۵- رابطه ساختار با عوارض جانبی آمینو گلیکوزیدها را توضیح دهد.

۴-۱۵- عوامل موثر در فارماکوکینتیک (جذب، طول اثر و ...) آمینو گلیکوزیدها را توضیح دهد.

۵-۱۵- دانشجو قادر به نامگذاری آمینو گلیکوزیدها باشد.

۶-۱۵- عوامل موثر در پایداری آمینو گلیکوزیدها را توضیح دهد.

۷-۱۵- راه‌های مقاومت به آمینو گلیکوزیدها را شرح دهد.

جلسه شانزدهم

هدف کلی: ماکرولیدها، آمفنیکلها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱-۱۶- مکانیسم اثر ماکرولیدها و آمفنیکلها را توضیح دهد.

۲-۱۶- رابطه ساختار با فعالیت آنتی باکتریال ماکرولیدها و آمفنیکلها را توضیح دهد.

۳-۱۶- رابطه ساختار با عوارض جانبی ماکرولیدها و آمفنیکلها را توضیح دهد.

۴-۱۶- عوامل موثر در فارماکوکینتیک (جذب، طول اثر و ...) ماکرولیدها و آمفنیکلها و روش‌های رفع مشکلات فارماکوکینتیکی آنها را توضیح دهد.

۵-۱۶- دانشجو قادر به نامگذاری آمفنیکلها باشد.

۱۶-۶- عوامل موثر در پایداری ماکرولیدها را توضیح دهد.

۱۶-۷- راه‌های مقاومت به ماکرولیدها و آمفنیکل‌ها را شرح دهد.

جلسه هفدهم

هدف کلی: لینکوزآمیدها، اکسازولیدینون‌ها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱۷-۱- مکانیسم اثر لینکوزآمیدها و اکسازولیدینون‌ها را توضیح دهد.

۱۷-۲- رابطه ساختار با فعالیت آنتی باکتریال لینکوزآمیدها و اکسازولیدینون‌ها را توضیح دهد.

۱۷-۳- راه‌های مقاومت به لینکوزآمیدها و اکسازولیدینون‌ها را شرح دهد.

۱۷-۴- دانشجو قادر به نامگذاری اکسازولیدینون‌ها باشد.

۱۷-۵- راه‌های متابولیسم اکسازولیدینون‌ها را شرح دهد.

جلسه هیجدهم

هدف کلی: داروهای ضد انگل، ضد کرم و ضد آمیب (نیتروآریل‌ها و ...)

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱۸-۱- مکانیسم اثر هر کدام از عوامل ضد انگل، ضد کرم و ضد آمیب را توضیح دهد.

۱۸-۲- رابطه ساختار با فعالیت ضد انگل، ضد کرم و ضد آمیب داروهای مربوطه را توضیح دهد.

۱۸-۳- راه‌های متابولیسم آنها را شرح دهد.

۱۸-۴- طیف اثر هر کدام از داروهای مربوطه را با توجه به ساختار شیمیایی آنها شرح دهد.

جلسه نوزدهم

هدف کلی: داروهای ضد مالاریا

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱-۱۹- مکانیسم اثر هر کدام از عوامل ضد مالاریا را توضیح دهد.

۲-۱۹- رابطه ساختار با فعالیت ضد مالاریایی داروهای مربوطه را توضیح دهد.

۳-۱۹- راه‌های متابولیسم آنها را شرح دهد.

جلسه بیستم

هدف کلی: داروهای ضد قارچ

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱-۲۰- مکانیسم اثر داروهای ضد قارچ را با توجه به ساختار شیمیایی آنها توضیح دهد.

۲-۲۰- رابطه ساختار با فعالیت داروهای ضد قارچ را توضیح دهد.

۳-۲۰- رابطه ساختار با عوارض جانبی داروهای ضد قارچ را توضیح دهد.

۴-۲۰- دانشجو قادر به نامگذاری داروهای ضد قارچ باشد.

۵-۲۰- طیف اثر هر کدام از داروهای ضد قارچ را با توجه به ساختار شیمیایی آنها شرح دهد.

جلسه بیست و یکم

هدف کلی: داروهای ضد ویروس

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۱-۲۱- مکانیسم اثر داروهای ضد ویروس را با توجه به ساختار شیمیایی آنها توضیح دهد.

۲-۲۱- رابطه ساختار با فعالیت داروهای ضد ویروس را توضیح دهد.

۳-۲۱- طیف اثر هر کدام از داروهای ضد ویروس را با توجه به ساختار شیمیایی آنها شرح دهد.

جلسه بیست و دوم

هدف کلی: داروهای ضد سل

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۲۲-۱- مکانیسم اثر داروهای ضد سل را با توجه به ساختار شیمیایی آنها توضیح دهد.

۲۲-۲- رابطه ساختار با فعالیت داروهای ضد سل را توضیح دهد.

۲۲-۳- رابطه ساختار با عوارض جانبی داروهای ضد سل را توضیح دهد.

جلسه بیست و سوم

هدف کلی: آنتی سبتیک‌ها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۲۳-۱- طیف اثر هر کدام از آنتی سبتیک‌ها را توضیح دهد.

۲۳-۲- کاربرد هر کدام از آنتی سبتیک‌ها را شرح دهد.

جلسه بیست و چهارم

هدف کلی: رادیوپاک‌ها

اهداف ویژه:

در پایان دانشجو قادر باشد.

۲۴-۱- ساختار داروهای رادیوپاک را تشخیص دهد.

۲۴-۲- مکانیسم مربوط به هر داروی رادیوپاک را توضیح دهد.

۲۴-۳- کاربرد هر یک از داروهای رادیوپاک را شرح دهد.

منابع:

- 1) Foye's principles of Medicinal Chemistry, Sixth edition, 2008.
- 2) Wilson and Gisvold's Textbook of Organic Medicinal and Pharmaceutical Chemistry, Twelfth edition, 2011.
- 3) Burger's Medicinal Chemistry & Drug Discovery, Seventh edition, 2010.

روش تدریس:

سخنرانی، پرسش و پاسخ

رسانه‌های کمک آموزشی:

وایت برد، ویدئو پروژکتور

سنجش و ارزشیابی:

ساعت	تاریخ	نمره	روش آزمون	آزمون
	اول هر جلسه	۱۰ درصد	کتبی و تشریحی	کوئیز
	وسط ترم	۴۰ درصد	کتبی و تشریحی	میانترم
	پایان ترم	۵۰ درصد	کتبی و تشریحی	پایانترم

مقررات درس و انتظارات از دانشجو:

- ۱- حضور به موقع و شرکت مرتب در کلاس.
- ۲- رعایت نظم و همچنین شئون اخلاقی در کلاس.
- ۳- آمادگی برای کوئیز در هر جلسه.
- ۴- داشتن پیش مطالعه در مورد مباحث فارماکولوژی مربوط به هر جلسه.
- ۵- مطالعه منابع معرفی شده.

جدول زمان بندی شیمی دارویی ۱ - نیمسال اول ۱۴۰۱-۱۴۰۰

جلسه	تاریخ	روز	سرفصل	مدرس
۱	۶/۲۸	دوشنبه	تأثیر خصوصیات فیزیکوشیمیایی در فارماکوکینتیک داروها	دکتر نوروزی
۲	۶/۳۰	چهارشنبه	ساختمان رسپتور و نیروهای دخیل در برهمکنش دارو با رسپتور	دکتر نوروزی
۳	۷/۴	دوشنبه	مسیرهای متابولیسم و رابطه ساختمان و متابولیسم داروها	دکتر نوروزی
۴	۷/۶	چهارشنبه	مسیرهای متابولیسم و رابطه ساختمان و متابولیسم داروها	دکتر نوروزی
۵	۷/۱۱	دوشنبه	بیوایزواسترها	دکتر نوروزی
۶	۷/۱۸	دوشنبه	روشهای طراحی دارو شامل QSAR و داکینگ	دکتر نوروزی
۷	۷/۲۰	چهارشنبه	سولفونامیدها	دکتر نوروزی
۸	۷/۲۵	دوشنبه	سولفونامیدها	دکتر نوروزی
۹	۷/۲۷	چهارشنبه	پنی سیلین ها	دکتر نوروزی
۱۰	۸/۲	دوشنبه	کارباپنم ها، مونوباکتام ها و مهارکننده های بتالاکتاماز	دکتر نوروزی
۱۱	۸/۴	چهارشنبه	سفالوسپورین ها	دکتر نوروزی
۱۲	۸/۹	دوشنبه	سفالوسپورین ها	دکتر نوروزی
۱۳	۸/۱۱	چهارشنبه	کینولون ها	دکتر علی آبادی
۱۴	۸/۱۶	دوشنبه	تتراسیکلین ها	دکتر علی آبادی
۱۵	۸/۱۸	چهارشنبه	آمینو گلیکوزیدها	دکتر علی آبادی
۱۶	۸/۲۳	دوشنبه	ماکرو لیدها، آمفنیکل ها	دکتر علی آبادی
۱۷	۸/۲۵	چهارشنبه	لینکوز آمیدها، اکسازولیدینون ها	دکتر علی آبادی
۱۸	۸/۳۰	دوشنبه	داروهای ضد انگل، ضد کرم و ضد آمیب	دکتر علی آبادی
۱۹	۹/۲	چهارشنبه	داروهای ضد مالاریا	دکتر علی آبادی
۲۰	۹/۷	دوشنبه	داروهای ضد قارچ	دکتر علی آبادی
۲۱	۹/۹	چهارشنبه	داروهای ضد ویروس	دکتر علی آبادی
۲۲	۹/۲۱	دوشنبه	داروهای ضد سل	دکتر علی آبادی
۲۳	۹/۲۳	چهارشنبه	آنتی سبتیک ها	دکتر علی آبادی
۲۴	۹/۲۸	دوشنبه	رادپوایک ها (داروهای رادیولوژی و عوامل تشخیصی)	دکتر علی آبادی