

18

RENCANA PROGRAM KEGIATAN PEMBELAJARAN SEMESTER (RPKPS)

KIMIA MEDISINAL [2]

A. PERENCANAAN PEMBELAJARAN

1. Deskripsi singkat matakuliah Kimia Medisinal

Matakuliah Kimia Medisinal menyajikan materi yang berisi arti, ruang lingkup, manfaat Kimia Medisinal bagi farmasis. Hubungan struktur dengan proses absorpsi, distribusi, ekskresi obat. Proses interaksi obat-biopolimer, hubungan kelarutan dengan aktivitas biologis, prinsip Ferguson dan model kerja obat. Aspek stereokimia dan aktivitas biologis. Hubungan kuantitatif struktur dan aktivitas biologis obat. Hubungan sifat kimia fisika dengan aktivitas biologis obat. Teori-teori interaksi obat-reseptor serta ikatan kimia yang terlibat. Metabolisme obat dan senyawa organik asing lain. Modifikasi molekul dan rancangan obat yang rasional dan beberapa contoh obat: obat antiinfeksi (antibiotika dan sulfonamida).

2. Tujuan Pembelajaran

Setelah mempelajari matakuliah ini mahasiswa diharapkan dapat menjelaskan prinsip-prinsip dasar hubungan struktur, sifat kimia fisika dengan aktivitas biologis obat, baik secara kualitatif maupun kuantitatif. Memahami proses interaksi obat-reseptor dan metabolisme dengan aktivitas biologis obat, untuk digunakan sebagai dasar untuk menjelaskan hubungan struktur dengan aktivitas biologis suatu kelompok turunan obat dan rancangan obat.

3. Tujuan Pembelajaran Khusus

Setelah mengikuti matakuliah ini mahasiswa diharapkan mampu:

1. a. Menjelaskan definisi, sejarah dan ruang lingkup Kimia Medisinal serta hubungannya dengan bidang ilmu lain.
b. Menjelaskan tujuan dan manfaat Kimia Medisinal bagi farmasis
2. a. Menjelaskan hubungan struktur dengan proses absorpsi, distribusi dan ekskresi obat
b. Menjelaskan sifat interaksi obat-biopolimer secara nonspesifik dan spesifik
c. Menjelaskan hubungan struktur dengan interaksi nonspesifik antara obat dengan protein plasma, lemak dan asam nukleat
d. Menjelaskan hubungan struktur dan interaksi spesifik antara obat dengan enzim biotransformasi dan reseptor.
3. a. Menjelaskan hubungan struktur, koefisien partisi dengan aktivitas antibakteri kelompok turunan n-alifatis alkohol, n-alkil resorsinol dan ester p-aminobenzoat.
b. Menjelaskan hubungan kelarutan dengan aktivitas obat anestesi sistemik menurut teori Overton-Meyer

4.
 - a. Menjelaskan hubungan prinsip Ferguson, aktivitas Termodinamik dengan aktivitas obat anestesi sistemik dan antiseptik
 - b. Menjelaskan model kerja obat berstruktur tidak spesifik dan memberikan contohnya.
5.
 - a. Menjelaskan peran modifikasi isosterik dalam pengembangan obat.
 - b. Memberikan contoh-contoh modifikasi isosterik dan perubahan aktivitas biologis yang ditimbulkannya.
 - c. Menjelaskan pengaruh isomer cis-trans, bentuk konformasi, diastereoisomer dan isomer optik terhadap aktivitas biologis obat dan memberikan contohnya.
6.
 - a. Menjelaskan hubungan kuantitatif struktur dengan aktivitas biologis obat menurut model Free-Wilson
 - b. Menjelaskan hubungan kuantitatif struktur dengan aktivitas biologis obat menurut model LFER Hansch, dengan menggunakan parameter tetapan lipofilik, elektronik dan sterik.
 - c. Menjelaskan parameter kimia fisika yang digunakan pada model HKSA dari Hansch.
 - d. Memberikan contoh-contoh aplikasi HKSA model Hansch
 - e. Menjelaskan keunggulan dan kelemahan HKSA model Hansch dibandingkan model Free-Wilson
7.
 - a. Menjelaskan ikatan-ikatan kimia yang terlibat pada interaksi obat reseptor (ikatan kovalen, hidrogen, ion, dipol-dipol, van der Waals, dan hidrofob) dan peran ikatan tersebut terhadap aktivitas biologis obat.
 - b. Menjelaskan teori interaksi obat reseptor yaitu teori klasik, pendudukan, kecepatan, *induced-fit*, gangguan makromolekul dan teori pendudukan-aktivasi.
8.
 - a. Menjelaskan pengaruh perubahan pH, pKa dan ionisasi terhadap aktivitas biologis obat.
 - b. Menjelaskan HSA senyawa kation aktif
 - c. Menjelaskan pengaruh ikatan hidrogen terhadap sifat kimia fisika dan aktivitas biologis obat, serta memberikan contohnya.
 - d. Menjelaskan hubungan pembentukan khelat, potensial redoks dan aktivitas permukaan dengan aktivitas biologis obat dan memberikan contohnya.
9.
 - a. Menjelaskan proses bioaktivasi, bioinaktivasi dan biotoksifikasi dalam metabolisme obat.
 - b. Menjelaskan perubahan metabolik akibat reaksi oksidasi dari gugus fungsi obat, yaitu gugus cincin aromatik, gugus olefin, atom C-benzilik dan alilik, atom C α – karbonil dan imin, atom C-alifatik dan alisiklik, atom C sistem C-N, C-O dan C-S, serta gugus alkohol dan aldehida.
 - c. Menjelaskan perubahan metabolik akibat reaksi reduksi dari gugus-gugus fungsi aldehid dan karbonil, nitro dan azo
 - d. Menjelaskan perubahan metabolik akibat reaksi hidrolisis dari gugus-gugus fungsi ester dan amida
 - e. Menjelaskan perubahan metabolik akibat reaksi konyugasi dengan asam glukuronat, sulfat, glisin dan glutamin, glutation dan asam merkapturat dari gugus fungsi obat.
 - f. Menjelaskan perubahan metabolik akibat reaksi asetilasi dan metilasi dari gugus fungsi obat.
10.
 - a. Menjelaskan senyawa induk atau penuntun
 - b. Menjelaskan modifikasi senyawa induk menjadi turunan-turunan yang lebih baik, contoh penisilin, sulfonamid

B. PELAKSANAAN PEMBELAJARAN

1. Jadwal Kegiatan Mingguan

Minggu ke-	Topik	Substansi	Metode	Fasilitas
1	Pengantar Kimia Medisinal	Definisi, sejarah, ruang lingkup, hubungan dengan bidang ilmu lain, tujuan dan manfaat Kimia Medisinal	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
2	Hubungan struktur dengan proses absorpsi, distribusi dan ekskresi obat	Hubungan struktur, sifat kimia fisika, dengan proses absorpsi, distribusi dan ekskresi obat	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
3	Interaksi obat-biopolimer	<ul style="list-style-type: none"> - Interaksi obat-biopolimer secara spesifik dan nonspesifik. - Interaksi nonspesifik obat dengan protein plasma, lemak dan asam nukleat. - Interaksi spesifik obat dengan enzim biotransformasi dan reseptor 	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
4	Hubungan struktur, kelarutan dan aktivitas biologis obat	<ul style="list-style-type: none"> - Hubungan kelarutan dengan aktivitas biologis senyawa homolog turunan n-alifatis alkohol, n-alkil resorsinol dan ester p-amino benzoat. - Hubungan koefisien partisi dengan aktivitas anestesi sistemik 	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
5	Prinsip Ferguson dan Model kerja Obat	<ul style="list-style-type: none"> - Prinsip Ferguson dan aktivitas termodinamik - Senyawa berstruktur tidak spesifik - Senyawa berstruktur spesifik 	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
6	Hubungan struktur, aspek stereokimia dan aktivitas biologis obat	<ul style="list-style-type: none"> - Modifikasi isosterik dan aktivitas biologis obat - Pengaruh isomer terhadap aktivitas biologis obat 	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
7	Hubungan Kuantitatif Struktur Aktivitas Biologis Obat (HKSA)	Pendekatan HKSA Model de novo dari Free Wilson dan model LFER dari Hansch	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
8		Ujian Tengah Semester		
9	Interaksi Obat-reseptor	Ikatan kimia yang terlibat pada interaksi obat-reseptor dan perannya terhadap aktivitas biologis obat	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
10	Interaksi Obat-Reseptor	Teori Interaksi Obat-reseptor	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
11 & 12	Sifat Kimia Fisika dan aktivitas biologis obat	Hubungan ionisasi dan ikatan hidrogen dengan aktivitas biologis obat	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
	Sifat Kimia Fisika dan aktivitas biologis obat	Hubungan pembentukan khelat, potensial redoks dan aktivitas permukaan dengan aktivitas biologis	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD

		obat.		
13 & 14	Metabolisme, aktivitas biologis dan rancangan obat	<ul style="list-style-type: none"> - Proses bioaktivasi, bioinaktivasi dan biotoksikasi dalam metabolisme obat - Perubahan metabolik obat akibat reaksi oksidasi, reduksi dan hidrolisis dari gugus-gugus obat - Reaksi konyugasi, asetilasi dan metilasi dari gugus-gugus fungsi obat dikaitkan dengan aktivitas biologik dan rancangan obat. 	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
15.	Modifikasi molekul dan rancangan obat rasional (SAR)	<ul style="list-style-type: none"> -Senyawa penuntun (lead compound) -Modifikasi molekul dan tujuan rancangan obat rasional -Contoh: penisilin dan turunannya Sulfonamid dan turunannya 	Ceramah dan tanya jawab	-WB -OHP -LCD
16		Ujian Akhir Semester		

2. Metode Pembelajaran dan Bentuk Kegiatan

Bentuk kegiatan proses pembelajaran meliputi tatap muka dan tanya jawab/diskusi selama 100 menit, yang terdiri dari pembahasan konsep-konsep materi kuliah dan tugas terstruktur. Materi kuliah diberikan dengan peralatan Power Point, OHP dan papan tulis.

C. PERENCANAAN EVALUASI PEMBELAJARAN

1. Hasil Pembelajaran

Hasil pembelajaran diukur dari evaluasi kemampuan mahasiswa yang diperoleh selama proses pembelajaran. Evaluasi dilakukan dengan mengadakan Ujian Tengah Semester (UTS) dan Ujian Akhir Semester (UAS).

Untuk memantau kinerja dosen pengampu, disediakan kuesioner yang diisi oleh mahasiswa pada waktu kuliah. Hasil kuesioner akan diberikan kepada dosen pengampu, sebagai feed back untuk perbaikan perkuliahan di masa mendatang.

2. Penilaian (*assessment*) :

Aspek penilaian	Unsur Penilaian	Presentase (%)
Pemahaman	Tugas mandiri	10 - 20
	Ujian Tengah Semester	20 - 30
	Ujian Akhir Semester	20 - 40
<i>Soft Skills</i>	Kreativitas dalam diskusi, Membuat resume, Kedisiplinan pengumpulan tugas, Presentasi, Partisipasi di kelas, dsb	10 - 30
Jumlah		100

Konversi Nilai Angka ke dalam Nilai Huruf diserahkan kepada masing-masing Institusi.

D. DAFTAR PUSTAKA

- Delgado J.N., and Remers A.W., Eds, 1991, *Wilson and Gisvold's Textbook of Organic Medicinal and Pharmaceutical Chemistry*, 9th ed., Lippincott
- Foye W.,O., 2002, *Principles of Medicinal Chemistry*, 5th ed., Lea and Febriger
- Gringauz A., 1997, *Introduction to Medicinal Chemistry, How Drugs Act and Why*,Wiley-VCH, New York.
- Korolkovas A, 1988, *Essential of Medicinal Chemistry*, 2nd ed., John Wiley and Sons, New York
- Siswandono, Soekardjo B., 2000, *Kimia Medisinal I*, Airlangga University Press,Surabaya
- Siswandono, Soekardjo B., 2000, *Kimia Medisinal II*, Airlangga University Press,Surabaya
- Wolff M.E., Ed.,1995-1997, *Burger's Medicinal Chemistry aand Drug Discovery*, 5th ed., Vol. I-IV,John Wiley & Sons, New York