

ФГБОУ ВО «Башкирский государственный университет»
Инженерный факультет

Утверждено:
на заседании кафедры ТХиМ
протокол № 13 от «21» апреля 2020 г.

Согласовано:
Председатель УМК факультета

Зав. кафедрой  /Мухамедзянова А.А.


/Мельникова А.Я

Рабочая программа дисциплины
Медицинская химия и основы фармацевтической технологии

Факультативная дисциплина

Программа бакалавриата

Направление подготовки

18.03.02 Энерго- и ресурсосберегающие процессы в химической технологии, нефтехимии
и биотехнологии

Направленность (профиль) подготовки

Рациональное использование материальных ресурсов и химической технологии
природного сырья

Квалификация

Бакалавр

Форма обучения

Очная, очно-заочная, заочная

Разработчик
к.х.н., доц



Ямансарова Э.Т.

Для приема 2020 г.

Уфа, 2020 г.

Составитель: к.х.н., доц. Ямансарова Э.Т.



Рабочая программа дисциплины рассмотрена и утверждена на заседании кафедры технической химии и материаловедения, протокол № 13 от « 21 » апреля 2020 г

Заведующий кафедрой ТХиМ



А.А. Мухамедзянова

Дополнения и изменения, внесенные в рабочую программу дисциплины, утверждены на заседании кафедры _____

протокол № _____ от « _____ » _____ 20 _ г.

Заведующий кафедрой _____ / _____

Ф.И.О./

Дополнения и изменения, внесенные в рабочую программу дисциплины, утверждены на заседании кафедры _____

протокол № _____ от « _____ » _____ 20 _ г.

Заведующий кафедрой _____ / _____

Ф.И.О./

Содержание

1.	Планируемые результаты обучения по дисциплине, соотнесённые с планируемыми результатами освоения образовательной программы	3
2.	Место дисциплины в структуре образовательной программы	4
3.	Объем дисциплины	6
4.	Содержание рабочей программы дисциплины	6
5.	Учебно–методическое обеспечение для самостоятельной работы обучающихся по дисциплине	13
6.	Фонд оценочных средств для проведения промежуточной аттестации обучающихся по дисциплине	14
6.1.	Перечень компетенций	14
6.2.	Показатели и критерии оценивания компетенций	15
6.3.	Типовые контрольные задания	15
6.4.	Вопросы к экзамену	19
7.	Перечень основной и дополнительной литературы для освоения дисциплины	20
7.1.	Основная литература	20
7.2.	Дополнительная литература	20
8.	Ресурсы информационно-телекоммуникационной сети «Интернет» для освоения дисциплины	20
9.	Методические указания для обучающихся по освоению дисциплины	21
9.1.	Описание основных разделов дисциплины	24
9.2.	Пример решения задач	24
9.3.	Пример лабораторной работы	25
9.4.	График самостоятельной работы студента	26
9.5.	Рейтинг план дисциплины	27
10.	Перечень информационных технологий, используемых при осуществлении образовательного процесса по дисциплине	28
11.	Материально–техническая база, необходимая для осуществления образовательного процесса по дисциплине	28

1. Перечень планируемых результатов обучения по дисциплине, соотнесённых с планируемыми результатами освоения образовательной программы

Результаты обучения		Формируемые компетенции	Примечание
Знания	Знать: области применения и основные методы синтеза биоактивных органических соединений, особенности строения и характерные свойства основных классов биоорганических соединений, методы их идентификации; стереохимические особенности и влияние этих особенностей на биологические свойства веществ; основы механизмов жизнедеятельности на молекулярном уровне.	ОК-7- способность к самоорганизации и к самообразованию ОПК-3 способность использовать основные естественнонаучные законы для понимания окружающего мира и явлений природы	
Умения	Уметь: планировать синтез лекарственных веществ на основе современных теоретических представлений об их строении, стереохимических особенностях и роли в жизненно важных процессах.	ОК-7- способность к самоорганизации и к самообразованию ОПК-3 способность использовать основные естественнонаучные законы для понимания окружающего мира и явлений природы	
Владения (навыки/ опыт деятельности)	Владеть: современными методами по конструированию лекарств на основе знаний о метаболизме лекарственных веществ в организме, владеть методами оценки связи «структура – свойства»; методологией научного исследования, включающей в себя разработку стратегии целевого органического синтеза биологически важных соединений с заданными свойствами	ОК-7- способность к самоорганизации и к самообразованию ОПК-3 способность использовать основные естественнонаучные законы для понимания окружающего мира и явлений природы	

2. Место дисциплины в структуре образовательной программы

Дисциплина «Медицинская химия и основы фармакологии» (шифр ФТД.2) входит в цикл факультативных дисциплин – учебного плана подготовки бакалавров направления подготовки 18.03.02 «Энерго- и ресурсосберегающие процессы в химической технологии, нефтехимии и биотехнологии», профиль подготовки «Рациональное использование материальных ресурсов в химической технологии природного сырья», реализуемого в Башкирском государственном университете, на инженерном факультете. Дисциплина базируется на фундаментальном фактическом материале таких теоретических курсов, как «Органическая химия», «Физическая химия», «Высокомолекулярные соединения», «Биохимия», «Основы химии биоматериалов», изучаемых в на младших курсах. Преподавание данного курса должно базироваться на всех пройденных ранее дисциплинах, входящих в учебный план подготовки бакалавров. Данная дисциплина является составной частью теоретической подготовки, на которой базируется дальнейшее выполнение практической части учебного плана, включающее выполнение научно-исследовательской работы, прохождения научно-исследовательской и преддипломной практик

Цели освоения дисциплины. Целями освоения дисциплины «Медицинская химия и основы фармацевтической технологии» является подготовка студентов к научно-исследовательской деятельности, связанной с созданием лекарственных препаратов в академических институтах и промышленных предприятиях, в первую очередь, с использованием средств хемо- и биоинформатики, молекулярного моделирования. Дать знания, умения и навыки в области новейших направлений органической химии лекарственных веществ, биохимии и биотехнологии, интегрирующих потенциал биомедицинского материаловедения, клеточных культур и технологий, тканевого инжиниринга как наиболее перспективных технологий реконструктивной биомедицины. Кроме того целями освоения дисциплины являются:

- формирование у обучающихся компетенций, связанных с пониманием проблематики в области веществ и материалов медицинского и фармацевтического назначения,
- приобретение знаний в области синтеза веществ медицинской степени чистоты, направленного биологического действия и с заданным сроком пребывания в организме,
- получение знаний о физико-химических и биохимических аспектах биосовместимости и тромборезистентности веществ и материалов медицинского назначения,
- знакомство с химической фармакологией,
- формирование навыков коллективной (парной и групповой) работы при выполнении химического эксперимента,
- формирование навыков работы на современной учебно-научной аппаратуре при проведении химических экспериментов,

– формирование навыков самостоятельной работы с учебными и учебно-методическими материалами, профессиональной научной литературой.

Задачи учебной дисциплины нацелены на рассмотрение практических основ на базе новейших теоретических разделов медицинского материаловедения, клеточной и тканевой инженерии и приобретение студентами знаний методологии по этим ключевым направлениям. Для изучения данной дисциплины целесообразно предварительное освоение студентами курсов общей биотехнологии, биоорганической химии, общей микробиологии. В результате освоения данной дисциплины должны быть сформированы представления о том, каким образом происходит дизайн лекарственных препаратов, какие идеи лежат в основе технологии создания новых препаратов, какие требования предъявляются к современным лекарственным препаратам, какие теоретические подходы и как используются для создания новых лекарственных препаратов, каков типичный алгоритм виртуального скрининга при создании лекарственных препаратов.

В результате освоения дисциплины у обучающихся должны быть сформированы следующие **компетенции**:

ОК-7- способность к самоорганизации и к самообразованию

ОПК-3 способностью использовать основные естественнонаучные законы для понимания окружающего мира и явлений природы

В результате освоения данной дисциплины выпускник должен

знать:

- главные принципы дизайна новых молекулярных структур, обладающих потенциальным лекарственным действием;
- основные требования, которым должны удовлетворять лекарственные препараты, для того, чтобы выйти на рынок;
- основные идеи и подходы, используемые при создании новых лекарственных препаратов;
- основы медицинской химии;
- типичный алгоритм создания лекарственного препарата с использованием виртуального скрининга;
- основные причины отклонения кандидатов в лекарственные препараты от использования;

уметь:

ориентироваться в современных направлениях и новейших методах органического синтеза лекарственных веществ, биотехнологии (биомедицинском материаловедении, технологиях клеточных культур, тканевой инженерии и конструирования биоискусственных органов);

использовать знания разделов новейших разделов биотехнологии при изучении специальных дисциплин;

применять полученные знания для повышения качества жизни людей;

- использовать полученные данные при написании рефератов, статей, научных проектов.

- использовать технологию виртуального скрининга в создании лекарственного препарата, обладающего заданными биологическими свойствами с использованием различных подходов хемо- и биоинформатики;
- отсеивать на ранних этапах соединения, потенциально обладающие нежелательными характеристиками адсорбции, метаболизма, распределения, выведения (ADME характеристиками), а также потенциально токсичные соединения;
- валидировать метод докинга и ранжировать соединения в соответствии с скоринг-функцией в них;
- проводить виртуальный скрининг без использования знаний о структуре биологической мишени;

владеть:

- методами виртуального скрининга с использованием информации о структуре биологической мишени;
- подходами для отсеивания соединений, не удовлетворяющих требованиям "лекарствоподобия", "лидероподобия" и другим характеристикам;
- основными программами, используемыми для проведения докинга и фармакофорного поиска;
- программами биоизостерного замещения для создания пептидомиметиков, "обхода" запатентованных соединений;
- методами *de novo* дизайна лекарственных препаратов,
- навыками синтеза и модификации лекарственных препаратов ,
- навыками коллективной (парной и групповой) работы при выполнении химического эксперимента.
- навыками самостоятельной работы с учебными и учебно-методическими материалами, профессиональной научной литературой

3. Объем дисциплины

Трудоемкость (ЗЕТ/час) – 2/72

Учебных часов:

лекций – 18

лабораторных – 18

Зачет – 7 сем.

СРС – 34

КСР – 2

4. Содержание рабочей программы дисциплины

ФЕДЕРАЛЬНОЕ ГОСУДАРСТВЕННОЕ БЮДЖЕТНОЕ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ ВЫСШЕГО ПРОФЕССИОНАЛЬНОГО
ОБРАЗОВАНИЯ
«БАШКИРСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ»

СОДЕРЖАНИЕ РАБОЧЕЙ ПРОГРАММЫ

дисциплина «Медицинская химия и основы фармацевтической технологии» на 7 семестр
(наименование дисциплины)

Рабочую программу осуществляют:

Лекции: доц., к.х.н. Ямансарова Э.Т.
(должность, уч. степень, звание, ф.и.о.)

Практические занятия: доц., к.х.н. Ямансарова Э.Т.
(должность, уч. степень, звание, ф.и.о.)

Зачетных единиц трудоемкости (ЗЕТ) 2/72

Учебных часов:

лекций 18

семинарских _____

практических _____

лабораторных 18

консультаций _____

зачет 7 сем.

экзамен _____

самостоятельная работа студентов 34

КСР 2

Приложение 2

№ п/п	Тема и содержание	Форма изучения материалов (лекции, практические занятия, семинарские занятия, лабораторные работы, самостоятельная работа)	Кол-во часов аудиторной работы	Основная и дополнительная литература, рекомендуемая студентам (номера из списка)	Задания по самостоятельной работе студентов с указанием литературы, номеров задач	Количество часов самостоятельной работы	Форма контроля самостоятельной работы студентов (коллоквиумы, контрольные работы, компьютерные тесты и т.п.)
1	2	3	4	5	6	7	8
Модуль 1							
1	<p>Введение в дисциплину. Предмет курса. Основные понятия, используемые при создании лекарственного препарата. Основные этапы разработки, испытания и внедрения лекарственного препарата. Требования к лекарствам. Типичные причины отклонения лекарственных препаратов на различных этапах разработки и испытаний.</p> <p>Алгоритм создания лекарственного препарата. Практические и теоретические создание лекарственных препаратов. Использование подхода «золотой пули» - целевого воздействия на данную биологическую мишень. Достоинства и недостатки подхода. Использование информации о биологическом профайлинге соединений для уменьшения числа и силы побочных явлений. Системная биология. Метаболические пути. Взаимодействие протеин-протеин и лекарство-лекарство. Способы осуществления данных</p>	<p>ЛК</p> <p>ЛБ</p>	<p>8</p> <p>4</p>	<p>[2] – гл. 1, С. 11-43</p> <p>[1] – 2.1;</p> <p>[3] – 1.1, 1.2;</p> <p>Доп. 1, с.443-508</p> <p>2 с. 287 сл.</p> <p>[2] – 1.3, 1.4;</p> <p>Доп. 1, 2, 3</p>	<p>8, гл. 12, с. 284-288</p> <p>гл. 14, с. 359-361</p> <p>[2] – гл. 1, С. 11-43</p> <p>[1] – 2.1;</p> <p>[3] – 1.1, 1.2;</p> <p>Доп. 1, с.443-508</p> <p>2 с. 287 сл.</p> <p>1, гл. 2, с. 89-103</p>	<p>8</p> <p>8</p>	<p>СР, КЛ</p>

<p>взаимодействий. Использование информации системной биологии для создания лекарственных веществ. Понятие хабов биологических взаимодействий и их использование</p> <p>Высокопроизводительный скрининг и его использование в создании лекарственных препаратов. Основы метода. Основные понятия и подходы. Использование библиотек соединений. Основы комбинаторной химии. Отбор библиотек. Разбросанные и сфокусированные библиотеки. Способы отбора соединений для проведения скрининга.</p> <p>Алгоритм виртуального скрининга химических соединений. Типичные фильтры: "лекарствоподобия", "лидероподобия", структурные фильтры, фармакофорные фильтры. Многообразие фильтров. Виртуальный скрининг, основанный на структуре лигандов. Скрининг, основанных на схожести. Использование SAR/QSAR. Фармакофорный поиск с использованием структуры лиганда. Способы определения фармакофора.</p> <p>Виртуальный скрининг, основанный на структуре биомолекулы. Виртуальный скрининг, основанный на структуре биомолекулы. Основные подходы, используемые при таком типе скрининга. Трехмерные фармакофоры и их использование для скрининга. Фармакофорный поиск с использованием структуры. Способы формулирования фармакофора. Основные программы и подходы, используемые для виртуального скрининга с использованием</p>						
--	--	--	--	--	--	--

	фармакофоров. Метод докинга. Основные алгоритмические подходы, используемые для докинга. Скоринг. Типы скоринг функций. Наиболее популярные программы докинга. Использование обратного QSAR для создания соединений. De novo дизайн лекарственных препаратов. Основные методы de novo дизайна. Использование биоизостеризма химических групп для создания лекарственных препаратов. Основные биоизостерные группы. Алгоритмы биоизостерного замещения. Программы, используемые для создания лекарственных препаратов с использованием биоизостерного замещения.						
2	Стадии изучения ЛВ. Понятие первичного скрининга. LD50. Побочные эффекты. Понятие биодоступности и биотрансформации ЛВ. Принципы химического модифицирования структуры ЛВ и введение фармакоформной группы. Метод молекулярного моделирования (дизайна). Стратегия пролекарств. Концепция антиметаболитов. Методы комбинаторной химии. Связь химического строения ЛВ с его фармакологической активностью. Способы пролонгации действия ЛВ.	ЛК ЛБ	2 6	[1] – 1.1-1.3; [2] – 2.1-2.3; [4] – 4.1-4.4; [6] – 1.А.3,- 2.А.5, 3.А.1- 3.А.6; [8] – гл.2; [1] – 1.4,-1.6, 3.А.1-3.А.6; [2] – 4.1-4.8; [4] – 5.1-5.6; [5] – 5.1-5.8; [6] – 2.Г.1-9, 2.Д.4; [8] – гл.3; [10];	1, гл. 3, с. 155-158 [2] – 2.1-2.3; [4] – 4.1-4.4; [6] – 1.А.3,-2.А.5, 3.А.1-3.А.6; [8] – гл.2; 1, гл. 4, с. 207-211	8 8	СР, КЛ, 3
Модуль 2							
3	Основные понятия и термины фармацевтической технологии.	ЛК	4	[2] – 8.1-8.5;	1, гл. 12, с. 557-565	8	СР, КЛ, 3

	<p>Нормирующая документация. ФС. ВФС. GMP регламент. Государственное нормирование производства лекарственных препаратов. Соблюдение санитарного и фармацевтического режима.</p> <p>Основные процессы и аппараты в фармацевтической технологии Общие технологические понятия. Перемещение материалов внутри производства. Измельчение и просеивание твёрдых тел. Перемешивание жидкостей. Разделение твёрдых и жидких тел. Тепловые процессы. Выпаривание. Сушка. Растворители и экстрагенты. Упаковка и фасовка лекарств и галеновых препаратов. Метрологическая служба в фармацевтических учреждениях и на предприятиях.</p> <p>Технология галеновых препаратов Галеновые препараты как лекарственные средства суммарного состава. Теоретические основы извлечения (экстрагирования). Настойки. Экстракты. Медицинские масла. Препараты из свежих растений и специально подготовленного растительного сырья. Суммарные очищенные (новогаленовые) препараты. Органопрепараты. Сиропа.</p>	ЛБ	6	<p>[4] – 9.1-9.7; [5] – 11.1-11.3, 12.1-12.7; [6] – 2.В.1-8, 3.Д.1-4; [8] – гл.5; [11];</p> <p>[1] – 6.1-6.6; [2] – 6.1, 6.2; [4] – 8.1-8.8; [5] – 2.1-2.3; [6] – 6.Б.1-5; [8] – гл. 6; [12]; [13];</p>			
4	<p>Ароматные воды. Растворы. Медицинские мыла и их препараты.</p> <p>Технология лекарственных форм. Системы классификации лекарственных форм. Основы биофармации и элементы фармакокинетики. Рациональность лекарственной прописи и проблема совместимости её ингредиентов. Твёрдые лекарственные формы. Сборы. Порошки. Таблетки. Драже. Микродраже. Спансулы.</p>	ЛК ЛБ	4 6	<p>[2] – 10.1-10.8; [5] – 13.1, 13.2; [6] – 4.А.1-5; [8] – гл.7; [10];</p> <p>[1] – 7.1-7.8; [4] – 10.1-</p>	Соответствующие разделы органич. химии 1, гл. 7, с. 299-312 [2] – 2.1-2.3; [4] – 4.1-4.4; [6] – 1.А.3,-2.А.5, 3.А.1-3.А.6; [8] – гл.2;	8	СР, КЛ, 3

	Гранулы. Кондитерские лекарственные формы.		10.5; [5] – 13.3-13.9; [6] – 6.А.1-4, 6.Г.1-5, 6.Д.1-5; [8] – гл.7;			
--	--	--	--	--	--	--

Принятые сокращения:

лекция – ЛК, лабораторные занятия – ЛР, коллоквиум – КЛ, самостоятельные работы – СР, задачи – З.

5. Учебно–методическое обеспечение для самостоятельной работы обучаемых по дисциплине

Для освоения студентами дисциплины «Медицинская химия и основы фармацевтической технологии» предусмотрены следующие

Виды самостоятельной работы:

- изучение основной и дополнительной литературы в целях самоподготовки;
- теоретическая проработка по отдельным разделам курса, подготовка к сдаче коллоквиумов;
- написание рефератов на заданную тему;
- подготовка к лабораторным работам;
- обработка экспериментальных результатов лабораторных работ и оформление лабораторных журналов.

Формы текущего контроля:

- тестовые задания;
- собеседование, допуск к выполнению лабораторных работ;
- проверка оформленных лабораторных работ в лабораторных журналах;
- проверка конспектов.

Форма рубежного контроля: сдача коллоквиумов.

Форма промежуточного контроля: написание теста.

Форма итогового контроля: зачет.

Согласно рабочему учебному плану на самостоятельную работу студентам дневной формы обучения отводится 34 часа.

Текущий контроль представляет собой проверку усвоения учебного материала, регулярно осуществляемую на протяжении семестра. Он осуществляется систематически, что обусловлено требованием постоянного и непрерывного мониторинга качества обучения, а также необходимостью балльно-рейтинговой оценки успеваемости обучающегося. При подобном контроле осуществляется проверка не компетенции в целом, а отдельных ее элементов (знания, умения, навыки).

Рубежный контроль осуществляется в конце каждого модуля, выделяемых в рамках освоения дисциплины. Он позволяет проверить отдельные компетенции или совокупности взаимосвязанных компетенций. Промежуточный контроль осуществляется в конце семестра и завершает изучение дисциплины. Подобный контроль помогает оценить более крупные совокупности знаний и умений, а также формирование определенных общекультурных и профессиональных компетенций. Совокупность приобретенных студентом общекультурных и профессиональных компетенций оценивается во время итогового контроля.

Теоретическая подготовка предполагает изучение студентами основной и дополнительной литературы и конспектов лекций по изучаемой дисциплине. Методические указания к практическим занятиям.

Устный опрос (УО) имеет большое значение в оценке процесса формирования компетенций в процессе освоения учебной дисциплины. Воспитательная функция УО имеет ряд важных аспектов: нравственный (честная сдача), дисциплинирующий (систематизация материала при ответе), дидактический (лучшее запоминание материала при интеллектуальной концентрации), эмоциональный (радость от успешного прохождения собеседования) и др. Обучающая функция УО состоит в выявлении деталей, которые по каким-то причинам оказались недостаточно осмысленными в ходе учебных занятий и при подготовке к зачёту или экзамену. УО обладает также мотивирующей функцией: правильно организованное собеседование, коллоквиум, экзамен могут стимулировать учебную деятельность студента, его участие в научной работе.

В ходе собеседования (УО-1) осуществляется специальная беседа преподавателя со студентом на темы, связанные с изучаемой дисциплиной, рассчитанная на выяснение объема знаний студента по определенному разделу, теме, проблеме и т.п.

Коллоквиум (УО-2) может служить формой не только проверки, но и повышения знаний студентов. На коллоквиумах обсуждаются отдельные части, разделы, темы, вопросы изучаемого курса, а также рефераты, подготовленные обучающимися.

Самостоятельная работа (ПР-1) является простейшей формой контроля, направленной на проверку владения терминологическим аппаратом, современными информационными технологиями и конкретными знаниями в области фундаментальных и прикладных дисциплин. СР-1 состоит из небольшого количества элементарных задач; занимает часть учебного занятия (20-30 минут); правильные решения разбираются на том же или следующем занятии; частота тестирования – после изучения каждой отдельной темы дисциплины.

Контрольная работа (ПР-2) является более сложной формой проверки. Контрольная работа состоит из небольшого количества средних по трудности вопросов, задач или заданий, требующих поиска обоснованного ответа. Контрольная работа выполняется студентами в конце семестра и завершает изучение дисциплины.

6. Фонд оценочных средств для проведения промежуточной аттестации обучаемых по дисциплине

6.1. Перечень компетенций, реализуемых в процессе изучения дисциплины и этапы их формирования приведены в таблице

№ п/п	Формулировка компетенции	Этапы формирования компетенции
1	ОК-7 способность к самоорганизации и к самообразованию	Компетенция формируется на всех этапах изучения дисциплины и ориентирована на развитие у обучаемых способности самостоятельно прорабатывать, по указанию преподавателя, литературные источники, осуществлять интернет-поиск, проводить патентные исследования и пр., ориентируясь при этом на собственные способности и, при необходимости, принимая меры к их совершенствованию. Большую роль в формировании компетенции имеет личный пример преподавателя, который должен объяснить и показать на примерах технологии развития способностей к самоорганизации и самообразованию.
2	ОПК-3 способность использовать основные естественнонаучные законы для понимания окружающего мира и явлений природы	Компетенция формируется на этапе проведения теоретической работы и лабораторных работ и ориентирована на получение знаний об этапах становления медицинской химии, привитие у обучаемых навыков использования общих представлений о механизмах рецепции, ориентирована на привитие у обучаемых навыков работы по синтезу, анализу и исследованию новых лекарственных препаратов

6.2. Показатели и критерии оценивания компетенций

Для каждой компетенции принята единая методика оценки на всех этапах ее формирования.

Входной уровень знаний, умений, опыта деятельности, требуемых для формирования компетенций, определяется федеральным государственным образовательным стандартом среднего (полного) общего образования (утвержден приказом Министерства образования и науки Российской Федерации от «12» марта 2015 г. N210).

6.3. Типовые контрольные задания

Вопросы к коллоквиуму 1 по теме: «Основы хеморецепции»

1. Химические основы возникновения и проведения нервных импульсов, понятие нейромедиатора и рецептора. Общая классификация рецепторов (механизмы передачи сигнала). Структуры вторичных мессенджеров. Агонисты и антагонисты: определения и общие подходы к созданию их структур (примеры). Понятия эутомер, дистомер, изостер, биоизостер, umbrella -эффект. Аллостерические агонисты и антагонисты. Понятия сродства соединения к рецептору и его внутренней активности. Частичные агонисты.

2. Ацетилхолиновые рецепторы. Классификация и механизм передачи сигнала. Природные и синтетические агонисты и антагонисты (примеры). Особенности структур и принципы создания лигандов ацетилхолиновых рецепторов (примеры), их возможное терапевтическое применение.

3. Синтез серотонина в организме и основная реакция его метаболизма. Серотониновые рецепторы, их классификация и механизм передачи сигнала. Примеры конструирования агонистов и антагонистов серотониновых рецепторов первого, второго и третьего подтипов, их использование в клинической практике (буспирон, суматриптан, ондансетрон и новые лиганды др.)

4. Рецепторы глутаминовой кислоты. Классификация, механизм передачи сигнала, сайты связывания лигандов. Ионотропные рецепторы: принципы конструирования агонистов и антагонистов различных подтипов и сайтов (D - AR 5(7), производные кинуреновой кислоты, МК-801, мемантин и др.). Структуры агонистов и антагонистов первой группы метаботропных глутаматных рецепторов (AIDA). Терапевтическое применение лигандов глутаматных рецепторов и проблемы в их создании.

5. Синтез дофамина и адреналина в организме. Классификация, механизм действия и лиганды дофаминовых рецепторов (примеры), их терапевтическое применение. Классификация адреналиновых рецепторов. Структурные особенности, подходы к конструированию и клиническое применение лигандов, взаимодействующих с различными подтипами адренорецепторов (примеры).

6. Гистамин, его функция в организме, классификация его рецепторов. Антагонисты различных подтипов гистаминовых рецепторов, принципы конструирования, клиническое использование (примеры на каждый подтип).

Побочные эффекты первого поколения антигистаминовых препаратов и пути преодоления этих эффектов с помощью структурных модификаций.

7. Опиатные рецепторы (ОР): классификация, особенности механизма действия, эндогенные лиганды. Морфин и основные соотношения «структура–свойство» для его аналогов. Возможные пути устранения наркотических свойств лигандов опиатных рецепторов. Структуры соединений, селективных к определенным подтипам ОР. Налоксон, его клиническое применение.

8. Рецепторы γ -аминомасляной кислоты – классификация и механизм передачи сигнала. Особенности строения и связывания с рецептором лигандов различных подтипов (баклофен и др. примеры).

9. Гормональные рецепторы, общий механизм гормональной регуляции. Строение лигандов тиреоидных гормонов и их аналогов. Особенности механизма действия рецепторов стероидных гормонов. Примеры конструирования агонистов и антагонистов эстрогенных и андрогенных рецепторов.

10. Рациональные подходы к созданию структур, взаимодействующих с ДНК: примеры интеркаляторов и алкилирующих агентов. Механизм действия 8-метоксипсораленов. Соединения, действующие на РНК: примеры структур и принцип действия.

11. Примеры соединений с разными типами мишеней: антималярийные препараты, местные анестетики и др. (структуры и механизм действия).

Пример тестового задания по теме «Фармакодинамика и фармакокинетика»

Вариант 1

1. Что включает понятие «фармакодинамика»?

- А. всасывание лекарственных веществ
- Б. распределение лекарственных веществ
- В. выведение лекарственных веществ из организма
- Г. биологический эффект и механизм действия веществ**
- Д. всё перечисленное выше

2. Выберите термины, относящиеся к фармакодинамике:

- А. агонизм, антагонизм
- Б. местное действие, системное действие
- В. доза, эффект
- Г. резорбтивное действие
- Д. все варианты ответов верны**

3. Каким термином обозначается действие лекарственных средств во время беременности, которое приводит к врожденным уродствам?

- А. мутагенное действие
- Б. эмбриотоксическое действие
- В. канцерогенное действие
- Г. тератогенное действие**
- Д. фетотоксическое действие

4. Метаболизм ЛС при гипотиреозе:
- А. повышается
 - Б. снижается**
 - В. не изменяется
 - Г. вначале повышается, а затем снижается
 - Д. вначале снижается, а затем повышается.
5. Понятие толерантности к ЛС — это:
- А. повышение чувствительности к препарату после его повторного применения;
 - Б. низкая чувствительность к препарату при 1-м применении;
 - В. высокая чувствительность к препарату при 1-м применении;
 - Г. снижение чувствительности к препарату после его повторного применения;**
 - Д. снижение дозы препарата после его 1-го применения.
6. Терапия, направленная на восполнение дефицита в организме веществ, которые не вырабатываются в нем в достаточном количестве — это:
- А. симптоматическая терапия;
 - Б. заместительная терапия;**
 - В. комплексная терапия;
 - Г. этиотропная терапия;
 - Д. стимулирующая терапия.
7. Какие особенности детского организма следует учитывать при дозировании лекарств у детей?
- А. более быстрое всасывание лекарств, чем у взрослых;
 - Б. проницаемость гистогематических барьеров, в т. ч. и ГЭБ, выше, чем у взрослых;
 - В. активность микросомальных ферментов печени ниже, чем у взрослых;
 - Г. более низкая скорость клубочковой фильтрации, чем у взрослых;
 - Д. все варианты ответов верны.**
8. Изменения метаболизма и функции клеток, органов или систем организма, возникающие под влиянием лекарственного средства — это:
- А. фармакологический эффект;**
 - Б. лекарственное взаимодействие;
 - В. фармакодинамическое взаимодействие;
 - Г. фармацевтическое взаимодействие;
 - Д. биотрансформация.
9. От дозы лекарственного средства зависят:
- А. индивидуальная чувствительность к ЛС;
 - Б. эффективность и безопасность ЛС;**
 - В. риск развития тахифилаксии;
 - Г. риск развития синдрома отмены;
 - Д. путь введения ЛС.
10. Непрямое действие лекарственных средств, которое развивается со стороны органов, расположенных в удалении от места непосредственного контакта вещества с чувствительными рецепторами — это:

- А. резорбтивное действие
 - Б. местное действие
 - В. рефлекторное действие**
 - Г. обратимое действие
 - Д. необратимое действие
11. Фармакокинетика изучает:
- А. всасывание, распределение, метаболизм и выведение ЛС из организма**
 - Б. токсичность и побочные эффекты ЛС
 - В. эффекты ЛС и механизмы их действия
 - Г. взаимодействия ЛС и фармакологические эффекты
 - Д. изменения определенных функций организма в ответ на действие ЛС.
12. Элиминация вещества – это:
- А. величина реабсорбции препарата из почечных канальцев
 - Б. скорость очищения от вещества определенного объема крови
 - В. время, в течение которого содержание вещества в плазме крови снижается на 50%
 - Г. время, в течение которого содержание вещества в плазме крови увеличивается на 50%
 - Д. процесс освобождения организма от вещества**
13. Биодоступностью ЛС называют:
- А. эффективная доза ЛС, оказывающая терапевтическое действие
 - Б. количество ЛС, достигающего системного кровотока**
 - В. количество ЛС, связанного с белками плазмы крови
 - Г. количество ЛС, выведенного из организма
 - Д. объем распределения ЛС в организме
14. Биодоступность ЛС зависит от:
- А. абсорбции и связывания с белком
 - Б. выведения почками и метаболизма в печени
 - В. всасывания и пресистемного метаболизма**
 - Г. объема распределения и периода $t_{1/2}$
 - Д. кратности приема и продолжительности лечения
15. На период полувыведения ЛС влияет:
- А. объем распределения
 - Б. связь с белками плазмы крови
 - В. скорость элиминации
 - Г. почечный и печеночный клиренс**
 - Д. биотрансформация

Перечень тем рефератов по дисциплине

«Медицинская химия и основы фармацевтической технологии»

1. Моделирование белков и рецепторов.
2. Методы компьютерного поиска новых структур потенциальных биологически активных веществ («lead-generation»).
3. Молекулярный дизайн лекарственных средств.

4. Основные направления компьютерного поиска новых лекарственных соединений: QSAR, молекулярное моделирование, виртуальный скрининг, направленное конструирование.
5. Молекулярный докинг.
6. Молекулярные дескрипторы
7. Молекулярная динамика пептидов.
8. Структурно-ориентированный молекулярный дизайн.
9. Методы молекулярной динамики в исследовании полимеров.
10. Методы молекулярной динамики в исследовании наноструктур.
11. Молекулярное моделирование, параллельные вычисления и Grid-технологии.

6.4. Вопросы к зачету

1. Основные этапы разработки, испытания и внедрения лекарственного препарата.
2. Требования к лекарствам. Типичные причины отклонения лекарственных препаратов на различных этапах разработки и испытаний.
3. Алгоритм создания лекарственного препарата. Практические и теоретические основы создания лекарственных препаратов.
4. Метод "золотой пули". Достоинства и недостатки подхода.
5. Биологический профайлинг соединений и его использование для создания лекарственных веществ.
6. Взаимодействие протеин-протеин и лекарство-лекарство. Способы осуществления данных взаимодействий.
7. Высокопроизводительный скрининг и его использование в создании лекарственных препаратов.
8. Комбинаторная химия. Отбор библиотек. Разбросанные и сфокусированные библиотеки. Способы отбора соединений для проведения скрининга.
9. Типичные фильтры в виртуальном скрининге.
10. Виртуальный скрининг, основанный на структуре лигандов.
11. Фармакофорный поиск с использованием структуры лиганда. Способы определения фармакофора.
12. Виртуальный скрининг, основанный на структуре биомолекулы. Основные подходы, используемые при таком типе скрининга.
13. Трехмерные фармакофоры и их использование для скрининга.
14. Докинг. Основные алгоритмы докинга.
15. Скоринг. Типы скоринг функций.
16. De novo дизайн лекарственных препаратов. Основные методы de novo дизайна.
17. Использование биоизостеризма химических групп для создания лекарственных препаратов.

7. Перечень основной и дополнительной литературы для освоения дисциплины

7.1. Основная литература

1. Фомина М. В. , Бибарцева Е. В. , Соколова О. Я. Фармацевтическая биохимия. Учебное пособие. Оренбург: ОГУ, 2015. 109 с. ЭБС «Университетская библиотека on-line», http://biblioclub.ru/index.php?page=book_red&id=438993&sr=1
2. Хайрутдинов Ф. Г. , Ахтямова З. Г. , Головин В. В. , Князев А. В. , Гафаров А. Н. Синтез лекарственных веществ: учебно-методическое пособие. Казань: Издательство КНИТУ, 2014. 136 с. Электронное издание. ЭБС «Университетская библиотека on-line», http://biblioclub.ru/index.php?page=book_red&id=428142&sr=1
3. Бушма М. И. , Бушма К. М. Фармакология: учебное пособие : в 2 ч., Ч. 1, 2. – Минск: Вышэйшая школа, 2013, 432 с. ЭБС «Университетская библиотека on-line», http://biblioclub.ru/index.php?page=book_red&id=448143&sr=1

7.2. Дополнительная литература

1. Биоорганическая химия: учебник / Н. А. Тюкавкина, Ю. И. Бауков. — М.: Дрофа, 2005 .— 542 с.
2. Биохимия : учебник / В. П. Комов, В. Н. Шведова .— М. : Дрофа, 2004 .— 638 с.
3. Ю.А.Овчинников. Биоорганическая химия, М.: Просвещение, 1987, 815 с.
4. Племенков В.В. "Введение в химию природных соединений" Казань 2001, 376 с.
5. Химия биологически активных природных соединений (под ред. Н. А. Преображенского и А. П. Евстигнеевой). М.: Просвещение, 1986, 815 с.
6. Общая органическая химия (под ред. Н. К. Кочеткова) т. 11, М.: Химия, 1986, 735 с.
7. Полимеры в медицине: пер. с англ. под ред. Н. А. Платэ — М. : Мир, 1969 .— 239 с
8. Платэ Н.А., Васильев А.Е. Физиологически активные полимеры. М.: Химия, 1986, 296 с.
9. Общая органическая химия (под ред. Н. К. Кочеткова) т. 12, М.: Химия, 1986, 735 с.
10. Общая органическая химия / под ред. Н. К. Кочеткова. – М.: Химия, Т. 10: Нуклеиновые кислоты, аминокислоты, пептиды, белки / под ред. М. А. Членова; пер. с англ. В. И. Бетанели; А. А. Коста; С. Н. Кочеткова .— 1986 .— 704 с.
11. Физико-химические методы изучения, анализа и фракционирования биополимеров. / Под ред. проф. Г.В.Самсонова .— М.-Л.: Наука, 1966 .— 341с.

8. Ресурсы информационно-телекоммуникационной сети «Интернет» для освоения дисциплины

1. Online chemical modeling environment - <http://ochem.eu/home/show.do>
2. Virtual Computational Chemistry Laboratory - <http://www.vcclab.org>

3. База данных PDB - <http://www.rcsb.org/pdb/home/home.do>
4. База данных ZINC - <http://zinc.docking.org/>
5. Драг-дизайн: как в современном мире создаются новые лекарства - <http://biomolecula.ru/content/15>
6. Лекарственные средства - <http://www.buymedicine.ru/karta-sayta/>
7. Электронный образовательный ресурс «Хемоинформатика и молекулярное моделирование» площадки "Зилант" системы дистанционного обучения Казанского (Приволжского) федерального университета. - <http://zilant.kfu-elearning.ru/course/view.php?id=376>
8. <http://www.moldyn.org>, <http://www.nehudlit.ru/books/subcat281.html>
программы Microsoft Office 2007, программа ChemDraw, HyperChem, ChemOffice
9. **United States Patent and Trademark Office** [Электронный ресурс].- Режим доступа: <http://www.uspto.gov/patft/index.html>, свободный. – Загл. с экрана.
(патентная база США, бесплатный доступ к базе данных рефератов и полных описаний изобретений США с 1976 г.).
10. **European Patent Office** [Электронный ресурс].- Режим доступа: <http://ep.espacenet.com>, свободный. – Загл. с экрана.

9. Методические указания для обучаемых по освоению дисциплины

9.1. Описание основных разделов дисциплины

Основные понятия и термины медицинской химии

1. Медицинская химия: определения и цели. Основные фазы конструирования лекарственных препаратов. Соединение-лидер и стратегии его поиска. Понятия: me - too drug, through - put screening, hit compound, комбинаторные библиотеки, building block, scaffold, denovo дизайн физиологически активных веществ (ФАВ).
2. Биологические мишени действия ФАВ (липиды, белки, нуклеиновые кислоты) и принципы создания структур их лигандов.
3. Особенности химической структуры и механизм действия ионофоров и каналобразующих соединений (Амфотерицин В, Грамицидин, Валиномицин). Синтетические аналоги природных ионофоров.
4. "Химические эффекторы ферментов (субстраты, ингибиторы и модифицирующие агенты). Рациональные подходы к созданию ингибиторов ферментов (их зависимость от наличия структурной информации о мишени). Обратимое ингибирование, кинетические типы. Особенности химического строения конкурентных ингибиторов как отражение особенностей строения активных центров ферментов. Понятие фармакофора. Необратимое ингибирование, структурные особенности ингибиторов (на примере ОВ нервно-паралитического действия и др.).
5. Аналоги переходного состояния, принцип их конструирования (примеры). Суицидные субстраты, особенности их структуры и механизма; ограничения их клинического использования (понятие "molecular tool"). Аллостерическое ингибирование. Особенности структуры аллостерических ингибиторов в системах с контролем по принципу обратной связи."

6. Химические основы возникновения и проведения нервных импульсов, понятие нейромедиатора и рецептора. Общая классификация рецепторов (механизмы передачи сигнала). Структуры вторичных мессенджеров. Агонисты и антагонисты: определения и общие подходы к созданию их структур (примеры). Понятия эутомер, дистомер, изостер, биоизостер, umbrella -эффект. Аллостерические агонисты и антагонисты. Понятия сродства соединения к рецептору и его внутренней активности. Частичные агонисты.

7. Ацетилхолиновые рецепторы. Классификация и механизм передачи сигнала. Природные и синтетические агонисты и антагонисты (примеры). Особенности структур и принципы создания лигандов ацетилхолиновых рецепторов (примеры), их возможное терапевтическое применение.

8. Синтез серотонина в организме и основная реакция его метаболизма. Серотониновые рецепторы, их классификация и механизм передачи сигнала. Примеры конструирования агонистов и антагонистов серотониновых рецепторов первого, второго и третьего подтипов, их использование в клинической практике (буспирон, суматриптан, ондансетрон и новые лиганды др.)

9. Рецепторы глутаминовой кислоты. Классификация, механизм передачи сигнала, сайты связывания лигандов. Ионотропные рецепторы: принципы конструирования агонистов и антагонистов различных подтипов и сайтов (D - AP 5(7), производные кинуреновой кислоты, МК-801, мемантин и др.). Структуры агонистов и антагонистов первой группы метаботропных глутаматных рецепторов (AIDA). Терапевтическое применение лигандов глутаматных рецепторов и проблемы в их создании.

10. Синтез дофамина и адреналина в организме. Классификация, механизм действия и лиганды дофаминовых рецепторов (примеры), их терапевтическое применение. Классификация адреналиновых рецепторов. Структурные особенности, подходы к конструированию и клиническое применение лигандов, взаимодействующих с различными подтипами адренорецепторов (примеры).

11. Гистамин, его функция в организме, классификация его рецепторов. Антагонисты различных подтипов гистаминовых рецепторов, принципы конструирования, клиническое использование (примеры на каждый подтип). Побочные эффекты первого поколения антигистаминовых препаратов и пути преодоления этих эффектов с помощью структурных модификаций.

12. Опиатные рецепторы (ОР): классификация, особенности механизма действия, эндогенные лиганды. Морфин и основные соотношения «структура–свойство» для его аналогов. Возможные пути устранения наркотических свойств лигандов опиатных рецепторов. Структуры соединений, селективных к определенным подтипам ОР. Налоксон, его клиническое применение.

13. Рецепторы g-аминомасляной кислоты – классификация и механизм передачи сигнала. Особенности строения и связывания с рецептором лигандов различных подтипов (баклофен и др. примеры).

14. Гормональные рецепторы, общий механизм гормональной регуляции. Строение лигандов тиреоидных гормонов и их аналогов. Особенности механизма действия рецепторов стероидных гормонов. Примеры конструирования агонистов и антагонистов эстрогенных и андрогенных рецепторов.

15. Рациональные подходы к созданию структур, взаимодействующих с ДНК: примеры интеркаляторов и алкилирующих агентов. Механизм действия 8-метоксипсораленов. Соединения, действующие на РНК: примеры структур и принцип действия.

16. Примеры соединений с разными типами мишеней: антималярийные препараты, местные анестетики и др. (структуры и механизм действия).

Фармакокинетика и фармакодинамика

1. Понятие биодоступности. Основные фармакокинетические характеристики. Примеры изменения структуры ФАВ с целью улучшения фармакокинетических характеристик и других нежелательных свойств лекарств. Попытки предсказания возможности «доведения» активного соединения до лекарства; правила Липинского.

2. Гематоэнцефалический барьер и способы его «преодоления» химическими веществами. Основные метаболические реакции и способы «защиты» от них с помощью структурных модификаций. Понятия soft - drug, hard - drug, пролекарство. Структурные особенности мутагенов. Явления, возникающие при повторном введении лекарственных препаратов.

3. Количественная характеристика биологической активности.

4. Уравнение Скетчарда. Графическое определение сродства лиганда к рецептору. Понятие и определение (графическое или др.) величин EC50, IC50, ED50, LD50. Терапевтический индекс. Тестирование in vivo: трансгенные животные; поведенческие модели (примеры). Клинические испытания – понятия orphan drug; плацебо; двойной слепой метод.

Принципы конструирования отдельных классов лекарственных препаратов

1. Принципы создания антибактериальных препаратов. Структуры и мишени действия сульфамидов, фторхинолонов, нитрофуранов, пенициллинов; модификации с целью оптимизации их физиологической активности. Особенности структуры клавулановой кислоты. Новые мишени действия антибактериальных агентов, примеры структур их лигандов. Разработка ингибиторов компонентов токсина сибирской язвы.

5. Принципы создания противовирусных препаратов (на примере вирусов СПИДа, гриппа и простого герпеса). Структурные особенности лигандов различных биологических мишеней (ремантадин, оксолин, ацикловир, вирацепт, ТИВО, циклические мочевины и др.). Дизайн пептидометиков.

6. Анальгетики ненаркотического действия: механизм действия и примеры структур (в том числе, полученных в результате современных исследований). Эпибатидин и его аналоги.

7. Биологические мишени и принципы создания противораковых препаратов. Структурные аналоги таксола, колхицина, монастрола, ингибиторов теломеразы, фарнезилтрансферазы, клеточных киназ.

Основы фармацевтической технологии

1. Основные понятия и термины фармацевтической технологии. Нормирующая документация. ФС. ВФС. GMP регламент. Государственное нормирование производства лекарственных препаратов. Соблюдение санитарного и фармацевтического режима.

2. Основные процессы и аппараты в фармацевтической технологии Общие технологические понятия. Перемещение материалов внутри производства. Измельчение и просеивание твёрдых тел. Перемешивание жидкостей. Разделение твёрдых и жидких тел. Тепловые процессы. Выпаривание. Сушка. Растворители и экстрагенты. Упаковка и фасовка лекарств и галеновых препаратов. Метрологическая служба в фармацевтических учреждениях и на предприятиях.

3. Технология галеновых препаратов Галеновые препараты как лекарственные средства суммарного состава. Теоретические основы извлечения (экстрагирования). Настойки. Экстракты. Медицинские масла. Препараты из свежих растений и специально подготовленного растительного сырья. Суммарные очищенные (новогаленовые) препараты. Органопрепараты. Сиропы. Ароматные воды. Растворы. Медицинские мыла и их препараты.

4. Технология лекарственных форм. Системы классификации лекарственных форм. Основы биофармакии и элементы фармакокинетики. Рациональность лекарственной прописи и проблема совместимости её ингредиентов. Твёрдые лекарственные формы. Сборы. Порошки. Таблетки. Драже. Микродраже. Спансулы. Гранулы. Кондитерские лекарственные формы.

9.2. Календарный график лабораторного практикума

18 часов

№	Тема лабораторной работы	Количество часов	Сроки проведения	Форма контроля
1.	Занятие № 1. Влияние физического состояния лекарственных средств на скорость их высвобождения из лекарственных форм	6	8 неделя	Коллоквиум, 8 неделя «Основные понятия и термины медицинской химии» Тест №1
2.	Занятие № 2. Влияние пути введения и простой химической модификации лекарственных веществ на процесс их всасывания	6	10 неделя	Коллоквиум, 12 неделя «Фармакокинетика и фармакодинамика. Принципы конструирования отдельных классов лекарственных препаратов» Самостоятельная работа № 2 Тест №2
3.	Занятие № 5. Влияние технологических факторов на	6	12 неделя	Коллоквиум, 16 неделя «Основы фармацевтической

	скорость растворения таблеток и стабильность инъекционных растворов. Терапевтическая неэквивалентность лекарственных препаратов			технологии» Тест №3
5.	Допуск к экзамену		16 неделя	

9.3. Пример лабораторной работы

Лабораторная работа № 1. Влияние физического состояния лекарственных средств на скорость их высвобождения из лекарственных форм

Цель работы: Формирование знаний, умений, практических навыков по изучению влияния степени измельчения стрептоцида и полиморфных модификаций цинкинсулина на скорость их высвобождения из соответствующих лекарственных форм.

Содержание работы:

Приготовление геля и агаровых пластинок

Агаровый гель готовят 2 % концентрации в предварительно старированном стеклянном стакане, плотно закрытом крышкой. Измельченный агар (ГОСТ 6470 – 53) заливают водой очищенной и оставляют на 30 мин для набухания. Набухший агар нагревают до кипения, доводят до необходимой массы и к теплому гелю добавляют 5 % реактива Эрлиха. Состав реактива Эрлиха: п-диметиламинобензальдегида 0,5 г, концентрированной кислоты хлороводородной и этанола 95 % по 15 мл, н-бутанола 90 мл. Приготовленный агаровый гель разливают в чашки Петри (диаметр 98–100 мм, высота 20 мм), которые расставляют на столе, предварительно выверенном по горизонтальному уровню с помощью ватерпаса. Агар разливают в чашки двумя порциями по 10 и 15 мл. После застывания первой порции агара на ее поверхность в каждую чашку помещают три цилиндра из нержавеющей стали или стекла (наружный диаметр 8 мм, высота до 10 мм) и заливают второй слой агара. После застывания агара цилиндры осторожно вынимают.

Технология мазей. Для получения фракций различной степени дисперсности 50 г стрептоцида просеивают через набор сит, отделяя частицы размером 0,38 мм. Стрептоцид с частицами менее 0,38 мм дополнительно измельчают в ступке с 95 % спиртом в течение 10 мин и просеивают через сита, отбирая фракцию с размером частиц 0,1 мм. Мази готовят 10 % концентрации с использованием любой имеющейся в наличии мазевой основы (например, вазелина), часть которой предварительно подплавляют и смешивают с определенной фракцией стрептоцида. Во избежание нежелательного дальнейшего измельчения частиц дисперсной фазы, мазевую основу подплавляют и смешивают с веществом, используя пропеллерную мешалку (1500 об/мин).

При отсутствии пропеллерной мешалки мазь можно приготовить следующим образом: в ступку помещают стрептоцид с определенным размером частиц и смешивают по правилу Дерягина с половинным количеством расплавленной основы, а затем добавляют оставшуюся нерасплавленную основу и перемешивают.

Определение скорости высвобождения лекарственных веществ из мазей

Мази, содержащие лекарственное вещество с различной степенью дисперсности, помещают в лунки двух чашек с агаром. Чашки нумеруют или указывают степень измельчения. Мазь в лунки вносят с помощью стеклянной палочки, осуществляя контроль за тем, чтобы был хороший контакт с агаром. Чашки помещают в термостат с температурой 37 °С.

Лекарственное вещество, высвобождаясь из мази, диффундирует в агаровый гель, взаимодействуя с реактивом Эрлиха и образуя окрашенную зону. Через 0,5; 1; 2 часа с помощью линейки измеряют диаметр окрашенной зоны. В случае образования эллипса измеряют больший и меньший диаметр и определяют среднее значение диаметра окрашенной зоны.

Статистическую обработку полученных результатов проводят по методу Монцевичюте – Эрингене.

Ошибку среднего арифметического вычисляют по формуле:

$$m = \pm \Sigma a k,$$

где m — ошибка среднего арифметического диаметров окрашенных зон;

Σ — сумма;

a — цифровые значения отклонений диаметров зон от среднего арифметического со знаком «плюс» или «минус»;

k — величина, зависящая от числа вариантов, т. е. количества опытов (n) для каждого образца мази (табл. 1).

9.4. График самостоятельной работы студента по дисциплине «Медицинская химия и основы фармацевтической технологии»

№ п/п	Тема и содержание	Количество часов самостоятельной работы	Сроки и Форма контроля самостоятельной работы студентов
1	2	7	8
1	Самостоятельное изучение рекомендуемой основной и дополнительной литературы по Разделу 1. Основные понятия и термины медицинской химии	6	ТЗ - 8 нед. КЛ - 8 нед.
2	Самостоятельное изучение рекомендуемой основной и дополнительной литературы по Разделу 2. Химические основы возникновения и проведения нервных импульсов, понятие нейромедиатора и рецептора. Общая классификация рецепторов	6	ТЗ - 8 нед. КЛ - 8 нед.
3	Самостоятельное изучение рекомендуемой основной и дополнительной литературы по Разделу 3. Фармакокинетика и фармакодинамика	4	ТЗ - 12 нед. КЛ - 12 нед.
4	Самостоятельное изучение рекомендуемой основной и дополнительной литературы по Разделу 4. Количественная характеристика биологической активности.	4	ТЗ - 12 нед. КЛ - 12 нед.
5	Самостоятельное изучение рекомендуемой основной и дополнительной литературы по Разделу 5. Принципы конструирования отдельных классов лекарственных препаратов. Этапы создания первичного арсенала лекарственных веществ. Принципы эмпирического (умозрительного) конструирования новых лекарственных препаратов	6	ТЗ - 12 нед. КЛ - 12 нед.
6	Самостоятельное изучение рекомендуемой основной и дополнительной литературы по Разделу 6. Основы современного компьютерного дизайна ЛП. Биомимети белкового типа. Молекулярное моделирование докинга ЛП с ферментами.	4	СР - 16 нед. КЛ - 16 нед.
7	Самостоятельное изучение рекомендуемой основной и дополнительной литературы по Разделу 7. Дизайн ЛП, взаимодействующих с рецепторами. Дизайн ЛП, взаимодействующих с ДНК	4	СР - 16 нед. КЛ - 16 нед.
8	Самостоятельное изучение рекомендуемой основной и дополнительной литературы по Разделу 8. Основы фармацевтической технологии.	4	СР - 16 нед. КЛ - 16 нед.
	ИТОГО: количество часов самостоятельной работы студентов.	34	18 неделя

9.5 Рейтинг-план дисциплины

«Медицинская химия и основы фармацевтической технологии»

Направление подготовки – 18.03.02 Энерго- и ресурсосберегающие процессы в химической технологии, нефтехимии и биотехнологии, Профиль подготовки – Рациональное использование материальных ресурсов в химической технологии природного сырья

курс IV, семестр 7, 2018 /2019 уч.г.

Количество часов по учебному плану 72, в т.ч. аудиторная работа 38, самостоятельная работа – 34.

Преподаватель: доц. каф. ТХиМ, Ямансарова Э.Т., кафедра: Технической химии и материаловедения

Виды учебной деятельности студентов	Балл за конкретное задание	Число заданий за семестр	Баллы	
			Минимальный	Максимальный
Модуль 1 30 баллов				
Текущий контроль			0	20
Аудиторная работа			0	14
Коллоквиум №1	7	1		
Коллоквиум №2	7	1		
2. Выполнение лабораторных работ	3	2	0	6
	2	2		4
Рубежный контроль				10
Тестовое задание №1	10	1	0	10
Всего				30
Модуль 2 40 баллов				
Текущий контроль				20
Аудиторная работа			0	14
Коллоквиум №3	7	1		
Коллоквиум №4	7	1		
2. Выполнение лабораторных работ	3	2	0	6
Рубежный контроль				20
Тестовое задание №2	8	1	0	8
Тестовое задание №3	7	1	0	7
Защита реферата	5	1		5
Всего				40
Поощрительные баллы				
1. Публикация статей, Участие в конференции			0	8
2. Помощь преподавателю в учебно-методической работе			0	2
Всего				10
Посещаемость (баллы вычитаются из общей суммы набранных баллов)				
1. Посещение лекционных занятий			0	-6
2. Посещение лабораторных занятий			0	-10
Итоговый контроль				
1. Экзамен			0	30

10. Перечень информационных технологий, используемых при осуществлении образовательного процесса по дисциплине

- программы подготовки презентаций;
- интернет-ресурсы;
- электронные библиотеки;
- электронная почта;
- сетевые средства доступа к учебно-методической и научной информации;
- образовательные электронные издания;
- мультимедиа.

Электронная информационно-образовательная среда БашГУ обеспечивает:

- доступ к учебным планам, рабочим программам дисциплин (модулей), практик, к изданиям электронных библиотечных систем и электронным образовательным ресурсам, указанным в рабочих программах;
- фиксацию хода образовательного процесса, результатов промежуточной аттестации и результатов освоения основной образовательной программы;
- проведение всех видов занятий, процедур оценки результатов обучения, реализация которых предусмотрена с применением электронного обучения, дистанционных образовательных технологий;
- формирование электронного портфолио обучающегося, в том числе сохранение работ обучающегося, рецензий и оценок на эти работы со стороны любых участников образовательного процесса;
- взаимодействие между участниками образовательного процесса, в том числе синхронное и (или) асинхронное взаимодействие посредством сети "Интернет".

11. Материально–техническая база, необходимая для осуществления образовательного процесса по дисциплине

Кафедра «Техническая химия и материаловедение», реализующая образовательную программу высшего образования по направлению подготовки «18.03.02 Энерго- и ресурсосберегающие процессы в химической технологии, нефтехимии и биотехнологии», уровень ВО – бакалавриат, профиль «Рациональное использование материальных ресурсов в химической технологии природного сырья», располагает необходимой материально-технической базой, обеспечивающей проведение всех видов дисциплинарной и междисциплинарной подготовки, лабораторной, практической и научно-исследовательской работы обучающихся, предусмотренной учебным планом по всем учебным дисциплинам (модулям) и соответствующей действующим санитарным и противопожарным правилам и нормам.

Специальные помещения представляют собой учебные аудитории для проведения занятий лекционного типа, занятий семинарского типа,

курсового проектирования (выполнения курсовых работ), групповых и индивидуальных консультаций, текущего контроля и промежуточной аттестации, а также помещения для самостоятельной работы и помещения для хранения и профилактического обслуживания учебного оборудования.

Специальные помещения укомплектованы специализированной мебелью и техническими средствами обучения, служащими для представления учебной информации большой аудитории.

Для проведения занятий лекционного типа предлагаются наборы демонстрационного оборудования и учебно-наглядных пособий, обеспечивающие тематические иллюстрации, соответствующие рабочей учебной программе.

Для чтения лекций преподаватели используют мультимедийные аудитории кафедры и общеуниверситетского назначения.

Уровень оснащения лабораторий, необходимый для реализации программы, достаточен для ведения учебного процесса и соответствует требованиям к материально-техническому обеспечению учебного процесса.

На сегодняшний день на кафедре имеются:

- специализированная лаборатория;
- компьютерный класс на 15 посадочных мест с достаточными техническими и программными ресурсами;
- лекционные аудитории, оснащенные проекционной техникой;
- специализированные компьютерные программы.

Программа составлена в соответствии с требованиями ФГОС ВО по направлению подготовки высшего образования «18.03.02 Энерго- и ресурсосберегающие процессы в химической технологии, нефтехимии и биотехнологии», уровень ВО – бакалавриат, профиль «Рациональное использование материальных ресурсов в химической технологии природного сырья» и в соответствии с «Положением о рабочей программе дисциплины (модуля)».

Составитель:
к.х.н., доц. каф. ТХиМ



Ямансарова Э.Т.

Зав.каф. ТХиМ, доц.



Мухамедзянова А.А.