

МИНОБРНАУКИ РОССИИ

Федеральное государственное бюджетное
образовательное учреждение высшего образования
«Астраханский государственный университет имени В. Н. Татищева»
(Астраханский государственный университет им. В. Н. Татищева)

СОГЛАСОВАНО
Руководитель ОПОП

А.В. Великородов

«24» января 2025 г.

УТВЕРЖДАЮ
Заведующий кафедрой фундаментальной
и прикладной химии

Л. А. Джигола

«24» января 2025 г.

РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ

«ОСНОВЫ МЕДИЦИНСКОЙ ХИМИИ»

Составитель(и)

Направление подготовки /
специальность

Направленность (профиль) ОПОП

Квалификация (степень)

Форма обучения

Год приёма

Курс

Семестр

Носачев С.Б., доцент, к.х.н., доцент

04.03.01 ХИМИЯ

**МЕДИЦИНСКАЯ И ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ
ХИМИЯ
бакалавр**

очно-заочная

2021

5

9

1. ЦЕЛИ И ЗАДАЧИ ОСВОЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ

1.1. Целями освоения дисциплины «Основы медицинской химии» являются формирование знаний и умений для работы в области создания биологически активных соединений, в т.ч. лекарственных с выраженной фармакологической активностью.

1.2. Задачи освоения дисциплины:

- сформировать понимание исторической необходимости появления химико-фармацевтической промышленности и возникновения многочисленных направлений по созданию арсенала лекарственных соединений;
- научить студентов анализировать основные концепции по стратегии синтеза биологически активных веществ и их применение на конкретных примерах производственной практики;
- сформировать умения выявлять связи химической структуры веществ с их реакционной способностью и биологической активностью;
- применять логику тонкого органического синтеза по планированию и по выбору тактических путей и химических реакций для целенаправленного получения потенциальных лекарственных веществ.

2. МЕСТО ДИСЦИПЛИНЫ В СТРУКТУРЕ ОПОП

2.1. Учебная дисциплина «Основы медицинской химии» относится к части, формируемой участниками образовательных отношений и осваивается в 9 семестре.

Дисциплина встраивается в структуру ОПОП ВО (последовательность в учебном плане) как с точки зрения преемственности содержания, так и с точки зрения непрерывности процесса формирования компетенций выпускника. Данный курс является логическим завершением процесса обучения, знакомя студентов с современными тенденциями развития органической химии биологически активных веществ, в т.ч. лекарственных в контексте синтеза и изучения биологической активности.

2.2. Для изучения данной учебной дисциплины необходимы следующие знания, умения, навыки, формируемые предшествующими учебными дисциплинами:

– органическая химия

Знания: современных методов получения органических соединений, их свойств и сферах применения.

Умения: проводить органический синтез на основе современных методик и устанавливать строение вновь полученных соединений комплексом физико-химических методов анализа.

Навыки: работы на современном учебном и научном оборудовании, владении методиками синтеза органических веществ.

2.3. Последующие учебные дисциплины и (или) практики, для которых необходимы знания, умения, навыки, формируемые данной учебной дисциплиной:

- производственная практика (преддипломная)

3. ПЛАНИРУЕМЫЕ РЕЗУЛЬТАТЫ ОБУЧЕНИЯ ПО ДИСЦИПЛИНЕ

Процесс освоения дисциплины направлен на формирование элементов следующей компетенции в соответствии с ФГОС ВО и ОПОП ВО по данному направлению подготовки:

профессиональных (ПК):

ПК-1. Способен оказывать информационную поддержку специалистам, осуществляющим научно-исследовательские работы;

ПК-2. Способен выбирать и использовать технические средства и методы испытаний для решения исследовательских задач химической направленности, поставленных специалистом более высокой квалификации.

Таблица 1 – Декомпозиция результатов обучения

Код и наименование компетенции	Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю)		
	Знать (1)	Уметь (2)	Владеть (3)
ПК-1. Способен оказывать информационную поддержку специалистам, осуществляющим научно-исследовательские работы	ИПК-1.1.1 Отдельные стадии исследования при наличии общего плана НИР	ИПК-1.2.1 Оказывать информационную поддержку специалистам, осуществляющим НИР; ИПК-1.2.2 Готовить элементы документации, проекты планов и отчетов отдельных этапов НИР	ИПК-1.3.1 Способами работы стандартным и оригинальным программным обеспечением
ПК-2. Способен выбирать и использовать технические средства и методы испытаний для решения исследовательских задач химической направленности, поставленных специалистом более высокой квалификации	ИПК-2.1.1 Технические средства и методы испытаний для решения конкретных исследовательских задач химической направленности, поставленных специалистом более высокой квалификации	ПК-2.1.2 Проводить отбор, идентификацию образцов, подготовку технической документации на образцы, устанавливает нормативные значения контролируемых показателей	ПК-2.1.3 Техническими средствами и методами испытаний для решения конкретных исследовательских задач химической направленности, поставленных специалистом более высокой квалификации

4. СТРУКТУРА И СОДЕРЖАНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

Объём дисциплины составляет 4 зачётных единиц, в том числе 28 часов, выделенных на контактную работу обучающихся с преподавателем (из них 14 часов – лекции, 14 часов – лабораторные работы), и 116 часов – на самостоятельную работу обучающихся.

Таблица 2 – Структура и содержание дисциплины

Раздел, тема дисциплины	Семестр	Контактная работа (в часах)			Самост. работа		Форма текущего контроля успеваемости, форма промежуточной аттестации
		Л	ПЗ	ЛР	КР	СР	
Тема 1 «Связь физико-химических свойств БАВ с их фармакологической активностью.	9	2		2		19	Отчет по лабораторной работе

Раздел, тема дисциплины	Семестр	Контактная работа (в часах)			Самост. работа		Форма текущего контроля успеваемости, форма промежуточной аттестации
		Л	ПЗ	ЛР	КР	СР	
Взаимодействие лекарство-рецептор»							
Тема 2. «Системы передач рецепторного сигнала и вторичные посредники. Ферменты. Ингибиторы ферментов в современном арсенале лекарственных средств»		2		2		19	Отчет по лабораторной работе
Тема 3. «Фармакокинетика. Роль фармакокинетических исследований в создании новых лекарственных средств. Метаболизм БАВ»		2		2		19	Отчет по лабораторной работе
Тема 4. «Источники поиска новых лекарственных средств. Современные методы усовершенствования структуры лидера»		2		2		19	Отчет по лабораторной работе
Тема 5. «Комбинаторный синтез и его роль в поиске структур-лидеров»		2		2		19	Отчет по лабораторной работе
Тема 6. «Дескрипторы молекулярной структуры. Регрессионные модели биологической активности органических молекул»		4		4		21	Отчет по лабораторной работе Тестирование Реферат
Итого		14		14		116	Диф. Зачет (зачет с оценкой)

Примечание: Л – лекция; ПЗ – практическое занятие, семинар; ЛР – лабораторная работа; КР – курсовая работа; СР – самостоятельная работа.

Таблица 3 – Матрица соотнесения разделов, тем учебной дисциплины и формируемых компетенций

Раздел, тема дисциплины (модуля)	Кол-во часов	Код компетенции		Общее количество компетенций
		ПК-1	ПК-2	
Тема 1 «Связь физико-химических свойств БАВ с их фармакологической активностью. Взаимодействие лекарство-рецептор»	23	+	+	2
Тема 2. «Системы передач рецепторного сигнала и вторичные посредники. Ферменты. Ингибиторы ферментов в	23	+	+	2

Раздел, тема дисциплины (модуля)	Кол-во часов	Код компетенции		Общее количество компетенций
		ПК-1	ПК-2	
современном арсенале лекарственных средств»				
Тема 3. «Фармакокинетика. Роль фармакокинетических исследований в создании новых лекарственных средств. Метаболизм БАВ»	23	+	+	2
Тема 4. «Источники поиска новых лекарственных средств. Современные методы усовершенствования структуры лидера»	23	+	+	2
Тема 5. «Комбинаторный синтез и его роль в поиске структур-лидеров»	23	+	+	2
Тема 6. «Дескрипторы молекулярной структуры. Регрессионные модели биологической активности органических молекул»	29	+	+	2
Итого	144			

Краткое содержание каждой темы дисциплины

Тема 1 «Связь физико-химических свойств БАВ с их фармакологической активностью. Взаимодействие лекарство-рецептор»

Растворимость и липофильность. Поверхностно-активные, мембран-активные фармакологические агенты и ион-проводящие антибиотики. Химическое связывание и биологическая активность. Связь между фармакологической активностью, электронными свойствами и константами ионизации. Стереохимические аспекты действия лекарств. Оптическая изомерия. Геометрическая изомерия. Биологическая активность конформеров.

Тема 2. «Системы передач рецепторного сигнала и вторичные посредники. Ферменты. Ингибиторы ферментов в современном арсенале лекарственных средств»

Аденилатциклазная система передачи сигнала. цГМФ как вторичный посредник. Продукты метаболизма фосфолипидов как вторичные посредники. Ионы Ca^{2+} как вторичные посредники. Классы ферментов. Оксидоредуктазы. Трансферазы. Гидролазы. Лиазы. Изомеразы. Лигазы (синтетазы). Коферменты. Принципы действия ферментов. Кинетика ферментативных реакций. Регуляция ферментативной активности. Категории ингибиторов ферментов. Необратимые ингибиторы ферментов. Обратимые ингибиторы ферментов. Регуляция активности мультиферментных систем.

Тема 3. «Фармакокинетика. Роль фармакокинетических исследований в создании новых лекарственных средств. Метаболизм БАВ»

Основные понятия фармакокинетики. Физико-химические свойства лекарственных веществ и их фармакокинетика. Фармакокинетические модели. Абсорбция. Количественные характеристики процесса абсорбции. Распределение лекарственных веществ. Выведение лекарственных веществ. Количественные характеристики процесса выведения лекарственных веществ. Фармакокинетика некоторых групп лекарственных средств.

Метаболические пути и места метаболических превращений ксенобиотиков. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые CYP450. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые FAD-содержащими ферментами. Восстановительные процессы. Гидролиз. Реакции II фазы метаболизма ксенобиотиков. Связь структуры и степени метаболизма лекарственных веществ.

Тема 4. «Источники поиска новых лекарственных средств. Современные методы усовершенствования структуры лидера»

Природное сырье как источник новых лекарственных средств. Официальные лекарственные средства как источник создания новых препаратов. Физиологические посредники как источник новых лекарственных средств. Биоизостерические перемещения. Конформационные ограничения. Пролекарства.

Тема 5. «Комбинаторный синтез и его роль в поиске структур-лидеров»

Стратегия конструирования и синтеза химических библиотек. Комбинаторный синтез в растворах. Одностадийные методы синтеза. Двухстадийные методы синтеза. Трехстадийные методы синтеза. Однореакторные методы синтеза (one-pot synthesis). Тандемные реакции. Параллельный синтез индивидуальных соединений. Классические жидкофазные реакции. Способы очистки реакционных растворов от примесей. Синтез с использованием растворимого полимера. Комбинаторный синтез на твердом носителе. Линкеры. Синтез гетероциклов на полимерном носителе. Методы установления структуры индивидуальных компонентов библиотек. Индексные библиотеки. Итерационная процедура распознавания веществ. Позиционное сканирование. Перспективы дальнейшего развития комбинаторного синтеза.

Тема 6. «Дескрипторы молекулярной структуры. Регрессионные модели биологической активности органических молекул»

Общая классификация дескрипторов. Электронные дескрипторы. Топологические дескрипторы. Физико-химические дескрипторы. Химические дескрипторы. Фармакофоры. Индикаторные дескрипторы. Регрессионный анализ. Факторные модели в регрессионном анализе. Эмпирические константы заместителей. Уравнения Гаммета и Тафта. Аддитивная модель Фри-Вильсона. Метод Хэнча. Значение липофильности. Метод сравнительного анализа молекулярных полей.

5. МЕТОДИЧЕСКИЕ УКАЗАНИЯ ПО ПРЕПОДАВАНИЮ И ОСВОЕНИЮ ДИСЦИПЛИНЫ

5.1. Указания для преподавателей по организации и проведению учебных занятий по дисциплине

Преподаватель должен активно непосредственно участвовать в учебном процессе и проводить подготовку к нему. Необходимость постоянной подготовки к лекциям, семинарским и практическим занятиям обусловлена потребностью отражать современные подходы, взгляды, данные по темам и разделам. Проводя подготовку к учебному процессу необходимо изучать современные методические рекомендации, результаты научных исследований, новые технологии и т.д. При реализации различных видов учебной работы преподаватель должен использовать образовательные технологии: создание интерактивных презентаций, обучающие компьютерные программы, технологии развития мышления (эффективная лекция, таблицы, работа в группах и т.д.)

В ходе подготовки лекции преподаватель должен разрабатывать план лекции, в котором должен определить те основные материалы, которые слушатели должны понять и записать. Содержание лекции должно быть организованным и четким, что делает усвоение материала доступным. Содержание лекции должно отвечать следующим требованиям: изложение материала от простого к сложному; от известного к неизвестному; логичность, четкость и ясность в изложении материала; возможность проблемного изложения; дискуссии и диалога в конце лекции с целью активизации деятельности слушателей; опора смысловой части лекции на подлинные факты, события, явления, статистические данные; тесная связь теоретических положений и выводов с практикой и профессиональной деятельностью. В ходе лекционного занятия преподаватель должен четко озвучить тему, представить план, кратко изложить цель, учебные вопросы. Раскрывая содержание учебных вопросов, акцентировать внимание на основных категориях, явлениях и процессах, особенностях их протекания. Следует также раскрывать сущность и содержание различных точек зрения и научных подходов к объяснению тех или иных явлений и процессов. При изложении лекционного материала следует аргументировано обосновать собственную позицию по спорным теоретическим вопросам, приводя примеры, раскрывать положительный отечественный и зарубежный опыт. По ходу изложения, возможно, задавать риторические вопросы и самому давать на них ответ. Преподаватель в целом не должен отвлекаться от излагаемого материала лекции. Преподаватель должен руководить работой слушателей по конспектированию лекционного материала, подчеркивать необходимость отражения в конспектах основных положений изучаемой темы. Используемый во время лекции наглядный материал – слайды, таблицы, схемы, иллюстрации помогает вести конспекты и улучшает темп предложения материала лекций. В заключительной части лекции необходимо сформулировать общие выводы по теме, раскрывающие содержание всех вопросов, поставленных в лекции. Для закрепления материала, подготовки к семинарским и практическим занятиям и выполнения самостоятельной работы необходимо рекомендовать литературу, основную и дополнительную, в том числе учебно-методические материалы, а также электронные источники (интернет-ресурсы).

Лабораторные занятия способствуют закреплению знаний полученных студентами в ходе обучения и самостоятельной работы, формированию компетенций, навыков в получении информации, приобретению умений провести ее обработку и анализ, овладению навыками планирования, анализа и управления. Общее требование при разработке тематики лабораторных таково - этот вид аудиторных занятий должен научить студента правильно оценить и предвидеть развитие ситуации, управлять ее формированием, владению методами анализа. На занятиях проводится отработка практических умений под контролем преподавателя. В конце каждого лабораторного занятия преподаватель планирует 6-7 минут для подведения итогов. Он обращает внимание на то, как освоен учебный материал по теме в целом, анализирует типичные ошибки и недоработки студентов, акцентирует их внимание на значимость темы.

5.2. Указания для обучающихся по освоению дисциплины

Таблица 4 – Содержание самостоятельной работы обучающихся

Вопросы, выносимые на самостоятельное изучение	Кол-во часов	Форма работы
Тема 1 «Связь физико-химических свойств БАВ с их фармакологической активностью. Взаимодействие лекарство-рецептор» Стереохимические аспекты действия лекарств. Оптическая изомерия. Геометрическая изомерия. Биологическая активность конформеров.	19	Оформление отчета по лабораторной работе
Тема 2. «Системы передач рецепторного сигнала и вторичные	19	Оформление

посредники. Ферменты. Ингибиторы ферментов в современном арсенале лекарственных средств» Принципы действия ферментов. Кинетика ферментативных реакций. Регуляция ферментативной активности. Категории ингибиторов ферментов. Необратимые ингибиторы ферментов. Обратимые ингибиторы ферментов. Регуляция активности мультиферментных систем.		отчета по лабораторной работе
Тема 3. «Фармакокинетика. Роль фармакокинетических исследований в создании новых лекарственных средств. Метаболизм БАВ» Метаболические пути и места метаболических превращений ксенобиотиков. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые CYP450. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые FAD-содержащими ферментами. Восстановительные процессы. Гидролиз. Реакции II фазы метаболизма ксенобиотиков. Связь структуры и степени метаболизма лекарственных веществ.	19	Оформление отчета по лабораторной работе
Тема 4. «Источники поиска новых лекарственных средств. Современные методы усовершенствования структуры лидера» Физиологические посредники как источник новых лекарственных средств. Биоизостерические перемещения. Конформационные ограничения. Пролекарства.	19	Оформление отчета по лабораторной работе
Тема 5. «Комбинаторный синтез и его роль в поиске структур-лидеров» Комбинаторный синтез на твердом носителе. Линкеры. Синтез гетероциклов на полимерном носителе. Методы установления структуры индивидуальных компонентов библиотек. Индексные библиотеки. Итерационная процедура распознавания веществ. Позиционное сканирование. Перспективы дальнейшего развития комбинаторного синтеза.	19	Оформление отчета по лабораторной работе
Тема 6. «Дескрипторы молекулярной структуры. Регрессионные модели биологической активности органических молекул» Регрессионный анализ. Факторные модели в регрессионном анализе. Эмпирические константы заместителей. Уравнения Гаммета и Тафта. Аддитивная модель Фри-Вильсона. Метод Хэнча. Значение липофильности. Метод сравнительного анализа молекулярных полей.	21	Оформление отчета по лабораторной работе Подготовка реферата

Методические рекомендации по подготовке к занятиям

Успешное освоение дисциплины возможно при систематической серьезной подготовке к каждому занятию. При подготовке к занятиям необходимо использовать несколько учебных пособий, так как это позволит создать более полное представление по изучаемой теме.

Рекомендуемая литература:

1. Хайрутдинов Ф.Г., Синтез лекарственных веществ [Электронный ресурс] / Ф.Г. Хайрутдинов и др. - Казань : Издательство КНИТУ, 2014. - 136 с. - ISBN 978-5-7882-1620-1 - Режим доступа: <http://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785788216201.html> (ЭБС «Консультант студента»)

2. Бухаров С.В., Химия и технология продуктов тонкого органического синтеза [Электронный ресурс] : учебное пособие / С.В. Бухаров, Г.Н. Нугуманова. - Казань : Издательство КНИТУ, 2013. - 268 с. - ISBN 978-5-7882-1436-8 - Режим доступа: <http://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785788214368.html> (ЭБС «Консультант студента»)
3. Смит В.А., Основы современного органического синтеза [Электронный ресурс] : учебное пособие / В.А. Смит, А.Д. Дильман. - 4-е изд. (эл.). - М. : БИНОМ, 2015. - 753 с. - ISBN 978-5-9963-2369-2 - Режим доступа: <http://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785996323692.html> (ЭБС «Консультант студента»).
4. Орехов С.Н., Фармацевтическая биотехнология / Орехов С.Н. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2013. - 384 с. - ISBN 978-5-9704-2499-5 - Текст : электронный // ЭБС "Консультант студента" : [сайт]. - URL : <http://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970424995.html> - Режим доступа : по подписке. (ЭБС «Консультант студента»).

5.3. Виды и формы письменных работ, предусмотренных при освоении дисциплины, выполняемые обучающимися самостоятельно

Методические указания по написанию отчета по лабораторной работе

1. Цель и задачи исследования.
2. Краткое описание эксперимента: способы, методы, методики исследования и теоретические положения.
3. Законы, положения, формулы, уравнения реакций. Результаты исследования и расчеты (уравнения должны быть приведены в общем виде и с подставленными данными). Результаты исследования и расчетов должны быть сведены в соответствующие таблицы.
4. Графическая обработка экспериментальных данных (при необходимости): графики и схемы должны выполняться на миллиметровой бумаге. На ось ординат наносится функция, на ось абсцисс – аргумент с указанием единиц измерения. На осях наносится шкала согласно выбранному масштабу. Единицы масштаба должны быть выбраны в соответствии точности отсчета при эксперименте. Координаты экспериментальной точки наносятся только на плоскости и отмечаются точкой. По экспериментальным точкам проводится усредняющая кривая. Выпавшие точки не используются, но показываются. На листе, где выполнен график, должны быть указаны наименование графика (под графиком), условия, сноски.
5. Анализ экспериментально полученных зависимостей.
6. Выводы.

Работа считается выполненной, если приведены все необходимые расчеты, построены изучаемые зависимости, приведены все структурные формулы изучаемых веществ и образуемых соединений, сделаны соответствующие выводы.

Темы рефератов по дисциплине «Основы медицинской химии» выбираются студентами в течение сентября месяца и обсуждаются с преподавателем. Сдача и защита рефератов осуществляется в ноябре.

Требования к оформлению рефератов:

Реферат должен быть представлен в форме печатной работы (электронная версия обязательна) объемом **от 20 до 40 страниц**, созданный в редакторе Microsoft Word (Windows), и сохранен в формате doc (docx), шрифт – Times New Roman; кегль – 14; межстрочный интервал – 1,0; абзац – 1,25; выравнивание по ширине, отступы: слева и справа – 2,5 см, сверху и снизу – 2,5 см, ориентация – книжная.

Оформление списка литературы к реферату:

1. Аршанский, Е.Я. Методика обучения химии в классах гуманитарного профиля [Текст] / Е.Я. Аршанский. – М.: Вентана-Граф, 2003. – 176 с.

2. Береснева, Е.В. Использование технологии критического мышления при изучении органической химии в средней школе [Текст] / Е.В. Береснева, Е.Н. Загвоздкина // Химия в школе. – 2008. – № 8. – С. 17–22.
3. Левитес, Д.Г. Школа для профессионалов или семь уроков для тех, кто учит / Д.Г. Левитес. – Воронеж: Издательство НПО «МОДЭК». – 2001. – 256 с.
4. Новые педагогические и информационные технологии в системе образования [Текст] / Е.С. Полат, М.Ю. Бухаркина, М.В. Моисеева, А.Е. Петров; под ред. Е.С. Полат. – М.: Издательский центр «Академия», 2008. – 272 с.
5. Храпов, С.А. Технологии CDIO в сфере социализации студентов (опыт Астраханского государственного университета) [Электронный ресурс]. / С.А. Храпов. – Режим доступа: http://portal.tpu.ru/f_dite/conf/2013/4/khrapov.pdf

Допускается самостоятельный выбор студентом темы реферата. Примерные темы рефератов:

1. Стереохимические аспекты действия лекарств.
2. Оптическая изомерия. Геометрическая изомерия.
3. Биологическая активность конформеров.
4. Принципы действия ферментов. Кинетика ферментативных реакций.
5. Регуляция ферментативной активности.
6. Категории ингибиторов ферментов.
7. Необратимые ингибиторы ферментов. Обратимые ингибиторы ферментов.
8. Регуляция активности мультиферментных систем.
9. Метаболические пути и места метаболических превращений ксенобиотиков.
10. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые CYP450.
11. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые FAD-содержащими ферментами. Восстановительные процессы. Гидролиз.
12. Реакции II фазы метаболизма ксенобиотиков.
13. Связь структуры и степени метаболизма лекарственных веществ.
14. Физиологические посредники как источник новых лекарственных средств.
15. Биоизостерические перемещения. Конформационные ограничения. Пролекарства.
16. Комбинаторный синтез на твердом носителе. Линкеры.
17. Синтез гетероциклов на полимерном носителе.
18. Методы установления структуры индивидуальных компонентов библиотек.
19. Индексные библиотеки.
20. Итерационная процедура распознавания веществ. Позиционное сканирование.
21. Перспективы дальнейшего развития комбинаторного синтеза.
22. Регрессионный анализ. Факторные модели в регрессионном анализе.
23. Эмпирические константы заместителей. Уравнения Гаммета и Тафта.
24. Аддитивная модель Фри-Вильсона. Метод Хэнча. Значение липофильности.
25. Метод сравнительного анализа молекулярных полей.

6. ОБРАЗОВАТЕЛЬНЫЕ И ИНФОРМАЦИОННЫЕ ТЕХНОЛОГИИ

В соответствии с требованиями ФГОС ВО по направлению 04.03.01 Химия (профиль Медицинская и фармацевтическая химия) реализация компетентного подхода предусматривает широкое использование в учебном процессе активных и интерактивных форм проведения занятий в сочетании с внеаудиторной работой с целью формирования и развития требуемых компетенций обучающихся.

В рамках учебного курса «Основы медицинской химии» предусмотрены встречи с представителями российских компаний, региональными работодателями, государственных и общественных организаций, мастер-классы экспертов и специалистов.

6.1. Образовательные технологии

Таблица 5 – Образовательные технологии, используемые при реализации учебных занятий

Раздел, тема дисциплины	Форма учебного занятия		
	Лекция	Практическое занятие, семинар	Лабораторная работа
Тема 1 «Связь физико-химических свойств БАВ с их фармакологической активностью. Взаимодействие лекарство-рецептор»	Обзорная лекция	Не предусмотрено	Исследовательская л/р
Тема 2. «Системы передач рецепторного сигнала и вторичные посредники. Ферменты. Ингибиторы ферментов в современном арсенале лекарственных средств»	Обзорная лекция	Не предусмотрено	Исследовательская л/р
Тема 3. «Фармакокинетика. Роль фармакокинетических исследований в создании новых лекарственных средств. Метаболизм БАВ»	Лекция с заранее запланированными ошибками	Не предусмотрено	Исследовательская л/р
Тема 4. «Источники поиска новых лекарственных средств. Современные методы усовершенствования структуры лидера»	Обзорная лекция	Не предусмотрено	Исследовательская л/р
Тема 5. «Комбинаторный синтез и его роль в поиске структур-лидеров»	Обзорная лекция	Не предусмотрено	Исследовательская л/р
Тема 6. «Дескрипторы молекулярной структуры. Регрессионные модели биологической активности органических молекул»	Обзорная лекция	Не предусмотрено	Исследовательская л/р

Учебные занятия по дисциплине могут проводиться с применением информационно-телекоммуникационных сетей при опосредованном (на расстоянии) интерактивном взаимодействии обучающихся и преподавателя в режимах online и (или) offline в формах видеолекций, лекций-презентаций, видеоконференции, собеседования в режиме форума, чата, выполнения виртуальных практических и (или) лабораторных работ и др.

6.2. Информационные технологии

Информационные технологии, используемые при реализации различных видов учебной и внеучебной работы:

- использование электронных учебников и различных сайтов (например, электронных библиотек, журналов и т. д.) как источников информации;
- использование возможностей электронной почты преподавателя sbn86chem@yandex.ru;

- использование средств представления учебной информации (электронных учебных пособий и практикумов, применение новых технологий для проведения очных (традиционных) лекций и семинаров с использованием презентаций и т. д.);
- использование интегрированных образовательных сред, где главной составляющей являются не только применяемые технологии, но и содержательная часть, т. е. информационные ресурсы (доступ к мировым информационным ресурсам, на базе которых строится учебный процесс);
- использование виртуальной обучающей среды (LMS Moodle «Электронное образование») по курсу «Основы медицинской химии» или иных информационных систем, сервисов и мессенджеров.

6.3. Программное обеспечение, современные профессиональные базы данных и информационные справочные системы

6.3.1. Программное обеспечение

Наименование программного обеспечения	Назначение
Adobe Reader	Программа для просмотра электронных документов
Платформа дистанционного обучения LMS Moodle	Виртуальная обучающая среда
Mozilla FireFox	Браузер
Microsoft Office 2013, Microsoft Office Project 2013, Microsoft Office Visio 2013	Пакет офисных программ
7-zip	Архиватор
Microsoft Windows 10 Professional	Операционная система
Kaspersky Endpoint Security	Средство антивирусной защиты
Google Chrome	Браузер
Notepad++	Текстовый редактор
OpenOffice	Пакет офисных программ
Opera	Браузер
Paint .NET	Растровый графический редактор

6.3.2. Современные профессиональные базы данных и информационные справочные системы

<i>Наименование современных профессиональных баз данных, информационных справочных систем</i>
Универсальная справочно-информационная полнотекстовая база данных периодических изданий ООО «ИВИС» http://dlib.eastview.com Имя пользователя: AstrGU Пароль: AstrGU
Электронные версии периодических изданий, размещённые на сайте информационных ресурсов www.polpred.com
Электронный каталог Научной библиотеки АГУ на базе MARK SQL НПО «Информ-систем» https://library.asu.edu.ru/catalog/
Электронный каталог «Научные журналы АГУ» https://journal.asu.edu.ru/
Корпоративный проект Ассоциации региональных библиотечных консорциумов

*Наименование современных профессиональных баз данных,
информационных справочных систем*

(АРБИКОН) «Межрегиональная аналитическая роспись статей» (МАРС) – сводная база данных, содержащая полную аналитическую роспись 1800 названий журналов по разным отраслям знаний. Участники проекта предоставляют друг другу электронные копии отсканированных статей из книг, сборников, журналов, содержащихся в фондах их библиотек.

<http://mars.arbicon.ru>

7. ФОНД ОЦЕНОЧНЫХ СРЕДСТВ ДЛЯ ПРОВЕДЕНИЯ ТЕКУЩЕГО КОНТРОЛЯ И ПРОМЕЖУТОЧНОЙ АТТЕСТАЦИИ ПО ДИСЦИПЛИНЕ

7.1. Паспорт фонда оценочных средств

При проведении текущего контроля и промежуточной аттестации по дисциплине «Основы медицинской химии» проверяется сформированность у обучающихся компетенций, указанных в разделе 3 настоящей программы. Этапность формирования данных компетенций в процессе освоения образовательной программы определяется последовательным освоением дисциплин (модулей) и прохождением практик, а в процессе освоения дисциплины – последовательным достижением результатов освоения содержательно связанных между собой разделов, тем.

Таблица 6 – Соответствие разделов, тем дисциплины, результатов обучения по дисциплине и оценочных средств

Контролируемый раздел, тема дисциплины (модуля)	Код контролируемой компетенции	Наименование оценочного средства
Тема 1 «Связь физико-химических свойств БАВ с их фармакологической активностью. Взаимодействие лекарство-рецептор»	ПК-1, ПК-2	Отчет по лабораторной работе
Тема 2. «Системы передач рецепторного сигнала и вторичные посредники. Ферменты. Ингибиторы ферментов в современном арсенале лекарственных средств»	ПК-1, ПК-2	Отчет по лабораторной работе
Тема 3. «Фармакокинетика. Роль фармакокинетических исследований в создании новых лекарственных средств. Метаболизм БАВ»	ПК-1, ПК-2	Отчет по лабораторной работе
Тема 4. «Источники поиска новых лекарственных средств. Современные методы усовершенствования структуры лидера»	ПК-1, ПК-2	Отчет по лабораторной работе
Тема 5. «Комбинаторный синтез и его роль в поиске структур-лидеров»	ПК-1, ПК-2	Отчет по лабораторной работе
Тема 6. «Дескрипторы молекулярной структуры. Регрессионные модели биологической активности органических молекул»	ПК-1, ПК-2	Отчет по лабораторной работе Тест

7.2. Описание показателей и критериев оценивания компетенций, описание шкал оценивания

Таблица 7 – Показатели оценивания результатов обучения в виде знаний

Шкала оценивания	Критерии оценивания
5 «отлично»	демонстрирует глубокое знание теоретического материала, умение обоснованно излагать свои мысли по обсуждаемым вопросам, способность полно, правильно и аргументированно отвечать на вопросы, приводить примеры
4 «хорошо»	демонстрирует знание теоретического материала, его последовательное изложение, способность приводить примеры, допускает единичные ошибки, исправляемые после замечания преподавателя
3 «удовлетворительно»	демонстрирует неполное, фрагментарное знание теоретического материала, требующее наводящих вопросов преподавателя, допускает существенные ошибки в его изложении, затрудняется в приведении примеров и формулировке выводов
2 «неудовлетворительно»	демонстрирует существенные пробелы в знании теоретического материала, не способен его изложить и ответить на наводящие вопросы преподавателя, не может привести примеры

Таблица 8 – Показатели оценивания результатов обучения в виде умений и владений

Шкала оценивания	Критерии оценивания
5 «отлично»	демонстрирует способность применять знание теоретического материала при выполнении заданий, последовательно и правильно выполняет задания, умеет обоснованно излагать свои мысли и делать необходимые выводы
4 «хорошо»	демонстрирует способность применять знание теоретического материала при выполнении заданий, последовательно и правильно выполняет задания, умеет обоснованно излагать свои мысли и делать необходимые выводы, допускает единичные ошибки, исправляемые после замечания преподавателя
3 «удовлетворительно»	демонстрирует отдельные, несистематизированные навыки, испытывает затруднения и допускает ошибки при выполнении заданий, выполняет задание по подсказке преподавателя, затрудняется в формулировке выводов
2 «неудовлетворительно»	не способен правильно выполнить задания

7.3. Контрольные задания и иные материалы, необходимые для оценки результатов обучения по дисциплине

Тема 1 «Связь физико-химических свойств БАВ с их фармакологической активностью. Взаимодействие лекарство-рецептор»

Перечень вопросов для отчета по лабораторной работе

1. Растворимость и липофильность.
2. Поверхностно-активные, мембран-активные фармакологические агенты и ион-проводящие антибиотики.

3. Химическое связывание и биологическая активность.
4. Связь между фармакологической активностью, электронными свойствами и константами ионизации.
5. Стереохимические аспекты действия лекарств.
6. Оптическая изомерия.
7. Геометрическая изомерия.
8. Биологическая активность конформеров.

Тема 2. «Системы передач рецепторного сигнала и вторичные посредники. Ферменты. Ингибиторы ферментов в современном арсенале лекарственных средств»

Перечень вопросов для отчета по лабораторной работе

1. Аденилатциклазная система передачи сигнала.
2. цГМФ как вторичный посредник.
3. Продукты метаболизма фосфолипидов как вторичные посредники.
4. Ионы Ca^{2+} как вторичные посредники.
5. Классы ферментов. Оксидоредуктазы. Трансферазы. Гидролазы. Лиазы. Изомеразы. Лигаза (синтетаза).
6. Коферменты.
7. Принципы действия ферментов.
8. Кинетика ферментативных реакций.
9. Регуляция ферментативной активности.
10. Категории ингибиторов ферментов.
11. Необратимые ингибиторы ферментов.
12. Обратимые ингибиторы ферментов.
13. Регуляция активности мультиферментных систем.

Тема 3. «Фармакокинетика. Роль фармакокинетических исследований в создании новых лекарственных средств. Метаболизм БАВ»

Перечень вопросов для отчета по лабораторной работе

1. Основные понятия фармакокинетики.
2. Физико-химические свойства лекарственных веществ и их фармакокинетика.
3. Фармакокинетические модели.
4. Абсорбция. Количественные характеристики процесса абсорбции.
5. Распределение лекарственных веществ.
6. Выведение лекарственных веществ.
7. Количественные характеристики процесса выведения лекарственных веществ.
8. Фармакокинетика некоторых групп лекарственных средств.
9. Метаболические пути и места метаболических превращений ксенобиотиков.
10. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые CYP450.
11. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые FAD-содержащими ферментами.
12. Восстановительные процессы.
13. Гидролиз.
14. Реакции II фазы метаболизма ксенобиотиков.
15. Связь структуры и степени метаболизма лекарственных веществ.

Тема 4. «Источники поиска новых лекарственных средств. Современные методы усовершенствования структуры лидера»

Перечень вопросов для отчета по лабораторной работе

1. Природное сырье как источник новых лекарственных средств.
2. Официальные лекарственные средства как источник создания новых препаратов.
3. Физиологические посредники как источник новых лекарственных средств.
4. Биоизостерические перемещения.
5. Конформационные ограничения.
6. Пролекарства.

Тема 5. «Комбинаторный синтез и его роль в поиске структур-лидеров»**Перечень вопросов для отчета по лабораторной работе**

1. Стратегия конструирования и синтеза химических библиотек.
2. Комбинаторный синтез в растворах.
3. Одностадийные методы синтеза.
4. Двухстадийные методы синтеза.
5. Трехстадийные методы синтеза.
6. Однореакторные методы синтеза (*one-pot synthesis*).
7. Тандемные реакции.
8. Параллельный синтез индивидуальных соединений.
9. Классические жидкофазные реакции.
10. Способы очистки реакционных растворов от примесей.
11. Синтез с использованием растворимого полимера.
12. Комбинаторный синтез на твердом носителе. Линкеры.
13. Синтез гетероциклов на полимерном носителе.
14. Методы установления структуры индивидуальных компонентов библиотек.
15. Индексные библиотеки.
16. Итерационная процедура распознавания веществ.
17. Позиционное сканирование.
18. Перспективы дальнейшего развития комбинаторного синтеза.

Тема 6. «Дескрипторы молекулярной структуры. Регрессионные модели биологической активности органических молекул»**Перечень вопросов для отчета по лабораторной работе**

1. Общая классификация дескрипторов. Электронные дескрипторы.
2. Топологические дескрипторы.
3. Физико-химические дескрипторы.
4. Химические дескрипторы.
5. Фармакофоры.
6. Индикаторные дескрипторы.
7. Регрессионный анализ.
8. Факторные модели в регрессионном анализе.
9. Эмпирические константы заместителей.
10. Уравнения Гаммета и Тафта.
11. Аддитивная модель Фри-Вильсона.
12. Метод Хэнча.
13. Значение липофильности.
14. Метод сравнительного анализа молекулярных полей.

Вопросы для тестирования

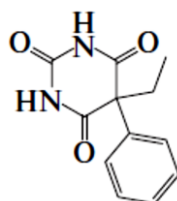
1. При проведении общего (ненаправленного) ТСХ-скрининга НЕВОЗМОЖНО обнаружить вещества из группы:
А. Опиатов.
Б. Производных барбитуровой кислоты.
В. Производных 1,4-бензодиаземина.
Г. Каннабиноидов.
Д. Производных фенотиазина.
2. Методом ТСХ-скрининга при экстракции как из кислой, так и из щелочной среды можно обнаружить группы веществ:
А. Опиаты, кокаин.
Б. Производные барбитуровой кислоты, производные 1,4-бензодиаземина.
В. Производные 1,4-бензодиаземина.
Г. Производные барбитуровой кислоты, производные фенотиазина.
Д. Опиаты, производные пиразолона.
3. Скрининговые методы позволяют:
А. Полуколичественно определить токсиканты в биообъекте.
Б. Отделить положительные пробы от отрицательных, определив групповую принадлежность токсикантов («металлический» яд, кислоты, щелочи).
В. Отделить положительные пробы от отрицательных, определив групповую принадлежность токсиканта (производные барбитуровой кислоты, производное 1,4-бензодиаземина, алкалоид и т. д.).
Г. Быстро провести качественное и количественное определение токсикантов в биообъекте.
4. Реактив для отличия морфина от кодеина при проведении ТСХ-анализа:
А. Хлорид железа.
Б. Драгендорфа.
В. Нesslera.
Г. Браттона–Маршала.
Д. Хлорная кислота и нитрит натрия.
5. При использовании в качестве детектирующего реагента раствор хлорида железа (III) выявляют:
А. Фенольные соединения.
Б. Соединения, содержащие третичный атом азота.
В. Барбитураты.
Г. Производные 1,4-бензодиаземина.
Д. Каннабиноиды.
6. При использовании в качестве детектирующего реагента реактив Марки выявляют:
А. Опиаты.
Б. Соединения, содержащие третичный атом азота.
В. Производные барбитуровой кислоты.
Г. Производные 1,4-бензодиаземина.
Д. Каннабиноиды.
7. При использовании в качестве детектирующего реагента раствор дифенилкарбазона и сульфата ртути выявляют:
А. Фенольные соединения.

- Б. Соединения, содержащие третичный атом азота.
- В. Производные барбитуровой кислоты.
- Г. Производные 1,4-бензодиазепина.
- Д. Каннабиноиды.

8. При проведении реакции Браттона–Маршала выявляют:

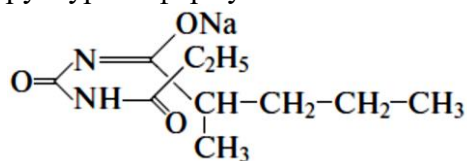
- А. Фенольные соединения.
- Б. Соединения, содержащие третичный атом азота.
- В. Производные барбитуровой кислоты.
- Г. Производные 1,4-бензодиазепина.
- Д. Каннабиноиды.

9. На рисунке изображена структурная формула:



- А. Фенобарбитала.
- Б. Диазепама.
- В. Циклобарбитала.
- Г. Аминазина.
- Д. Атропина.

10. На рисунке изображена структурная формула:



- А. Фенобарбитала.
- Б. Диазепама.
- В. Аминазина.
- Г. Этаминала натрия.
- Д. Тиопентала натрия.

11. Наиболее эффективно из трупного материала извлекаются производные барбитуровой кислоты:

- А. Методом П. Валоу.
- Б. Методом Стаса–Отто.
- В. Методом В. Ф. Крамаренко.
- Г. Жидкость-жидкостной экстракцией при pH 2–3.
- Д. Жидкость-жидкостной экстракцией при pH 9–10.

12. Наиболее эффективно из биожидкостей извлекаются производные барбитуровой кислоты:

- А. Методом П. Валоу.
- Б. Методом Стаса–Отто.
- В. Методом В. Ф. Крамаренко.
- Г. Жидкость-жидкостной экстракцией при pH 2–3.
- Д. Жидкость-жидкостной экстракцией при pH 10.

13. УФ-спектры большинства производных барбитуровой кислоты НЕ имеют заметного поглощения в области 200–330 нм при:

- А. Кислых значениях рН.
- Б. Нейтральных значениях рН.
- В. Щелочных значениях рН.
- Г. Сильнощелочных значениях рН.

14. УФ-спектры большинства производных барбитуровой кислоты имеют два максимума поглощения, которые характеризуют поглощение ионизированных форм первой (238–240 нм) и второй (254–256 нм) ступеней диссоциации, при:

- А. Кислых значениях рН.
- Б. Нейтральных значениях рН.
- В. Щелочных значениях рН.

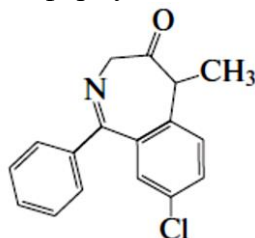
Производные барбитуровой кислоты:

- А. Обладают кислотными свойствами.
- Б. Обладают основными свойствами.
- В. Амфотерны.
- Г. Липофильны; кислотно-основные свойства выражены слабо.

15. Обнаружение производных барбитуровой кислоты в ХТА проводят:

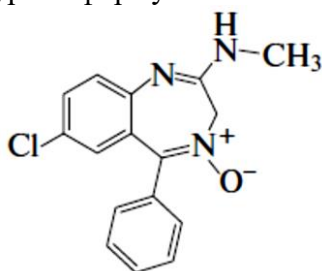
- А. Смесью концентрированных азотной и серной кислот.
- Б. Серной кислотой и формальдегидом.
- В. Хлоридом железа.
- Г. Аммиачным раствором нитрата кобальта.
- Д. Тетраиодвисмутатом калия.

16. На рисунке изображена структурная формула:



- А. Диазепама.
- Б. Фенобарбитала.
- В. Хлорзепада.
- Г. Нитразепама.
- Д. Хлорпромазина.

17. На рисунке изображена структурная формула:



- А. Диазепама.
- Б. Фенобарбитала.
- В. Хлорзепада.
- Г. Нитразепама.

Д. Хлорпромазина.

18. Условия гидролиза производных 1,4-бензодиазепина:

- А. Концентрированная HCl, нагревание.
- Б. Концентрированная H₂SO₄, нагревание.
- В. Концентрированная HNO₃, нагревание.
- Г. 10%-й раствор NaOH, нагревание.
- Д. Фермент глюкуронидаза, термостатирование при 37 °С.

19. После гидролиза биообъектов при исследовании на производные 1,4-бензодиазепина образуются:

- А. Исходные (нативные) вещества.
- Б. Неконъюгированные метаболиты и нативные вещества.
- В. Аминобензофеноны.
- Г. Соли диазония.
- Д. Азокрасители.

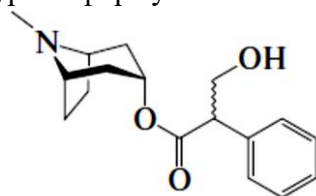
20. Реакция, применяемая в ХТА производных 1,4-бензодиазепина:

- А. С аммиачным раствором нитрата кобальта.
- Б. Браттона–Маршала.
- В. С реактивом Несслера.
- Г. С 10%-м раствором FeCl₃.
- Д. С пикриновой кислотой.

21. Производные 1,4-бензодиазепина обладают свойствами:

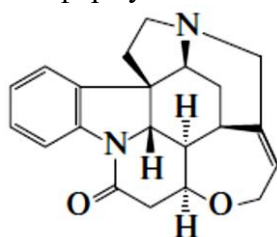
- А. Кислотными.
- Б. Основными.
- В. Амфотерными.
- Г. Липофильными; кислотно-основные свойства выражены слабо.

22. На рисунке изображена структурная формула:



- А. Атропина.
- Б. Никотина.
- В. Хинина.
- Г. Анабазина.
- Д. Стрихнина.

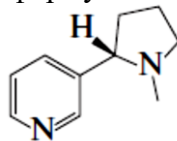
23. На рисунке изображена структурная формула:



- А. Атропина.
- Б. Никотина.

- В. Хинина.
- Г. Анабазина.
- Д. Стрихнина.

24. На рисунке изображена структурная формула:



- А. Атропина.
- Б. Никотина.
- В. Хинина.
- Г. Анабазина.
- Д. Стрихнина.

25. К общеалкалоидным осадительным реактивам НЕ относится:

- А. Реактив Драгендорфа.
- Б. Пикриновая кислота.
- В. Фосфорномолибденовая кислота.
- Г. Реактив Марки.
- Д. Фосфорновольфрамовая кислота.

26. Общеалкалоидные реактивы способны осаждать:

- А. Только алкалоиды.
- Б. Все гетероциклические соединения.
- В. Соединения, имеющие в составе третичный атом азота.
- Г. Соединения, имеющие в составе NH_2 -группу.
- Д. Соединения, имеющие в молекуле основной центр.

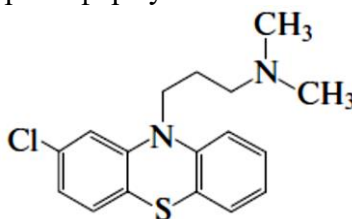
27. Практически НЕ обнаруживается микрокристаллоскопическими реакциями алкалоид:

- А. Морфин.
- Б. Эфедрин.
- В. Хинин.
- Г. Пахикарпин.
- Д. Атропин.

28. Алкалоиды обладают свойствами:

- А. Кислотными.
- Б. Основными.
- В. Амфотерными.
- Г. Липофильными; кислотно-основные свойства выражены слабо.

29. На рисунке приведена структурная формула:



- А. Аминазина.
- Б. Диазепама.
- В. Атропина.

- Г. Этаминала натрия.
- Д. Хлорпротиксена.

30. На производные 1,4-бензодиазепаина исследуют экстракт из:

- А. Кислой среды.
- Б. Щелочной среды.
- В. Кислой и щелочной сред.
- Г. Нейтральной среды.

31. Химические реакции производных фенотиазина основаны на способности:

- А. Окисляться с образованием окрашенных продуктов.
- Б. Образовывать окрашенные комплексы с ионами тяжелых металлов.
- В. Гидролизироваться с образованием окрашенных продуктов.
- Г. Флуоресцировать.
- Д. Изменять окраску раствора при изменении значения pH.

32. При взаимодействии с общеосадительными алкалоидными реактивами производные фенотиазина:

- А. Не вступают в реакции.
- Б. Образуют окрашенные кристаллические осадки.
- В. Образуют аморфные осадки.

33. Для барбитуратов характерны реакции:

- А. С хлор-цинк-иодом.
- Б. С солями кобальта и щелочами в безводной среде.
- В. С меднопиридиновым реактивом.
- Г. Мурексидная проба.
- Д. Таллейохинная проба.

34. Подтверждающие методы для определения барбитуратов:

- А. ИФА.
- Б. ВЭЖХ.
- В. ГЖХ.
- Г. Спектрофотометрия.

35. Для производных 1,4-бензодиазепаина характерны следующие кислотно-основные свойства:

- А. Это слабые кислоты.
- Б. Это слабые основания.
- В. При введении в их ядро нитро-, окси- и других групп основность соединений снижается.
- Г. При введении в их ядро нитро-, окси- и других групп основность соединений увеличивается.
- Д. 1,2-Дигидропроизводные 1,4-бензодиазепаина проявляют также слабокислые свойства благодаря наличию в молекуле амидной группы.

36. Объектами ТСХ-скрининга являются:

- А. Биологические жидкости.
- Б. Вещественные доказательства.
- В. Биологический материал.
- Г. Образцы растительного материала.
- Д. Иные вещественные доказательства — пищевые продукты, шприцы.

37. При использовании в качестве детектора реактива Марки выявляют:

- А. Фенольные соединения.
- Б. Соединения, содержащие третичный атом азота.
- В. Опиаты.
- Г. Производные 1,4-бензодиазепина.
- Д. Каннабиноиды.
- Е. Производные фенотиазина.

38. Алкалоиды могут быть производными:

- А. Пиридина и пиперидина.
- Б. Тропана.
- В. Хинолина.
- Г. Изохинолина.
- Д. Циклопентанпергидрофенантрена.
- Е. Фенотиазинов.
- Ж. Барбитуровой кислоты.
- З. 1,4-Бензодиазепина.

39. К производным пиридина и пиперидина относятся:

- А. Кониин.
- Б. Никотин.
- В. Анабазин.
- Г. Пахикарпин.
- Д. Папаверин.
- Е. Резерпин.
- Ж. Платифиллин.

40. Реакции обнаружения хинина:

- А. Образование талейохина.
- Б. Образование азокрасителя.
- В. Флуоресценция сернокислого раствора.
- Г. С солью Рейнеке.
- Д. С реактивом Марки.

41. Установите соответствие названия растения и содержащегося в нем алкалоида:

- | | |
|------------------------|-----------------|
| А. Белена. | 1. Стрихнин. |
| Б. Чилибуха. | 2. Скополамин. |
| В. Раувольфия змеиная. | 3. Платифиллин. |
| Г. Крестовник. | 4. Кониин. |
| Д. Болиголов. | 5. Резерпин. |

42. Порядок использования детектирующих реактивов при исследовании на I этапе ненаправленного ТСХ-скрининга веществ кислого, нейтрального и слабоосновного характера:

- | | |
|--|-------------------|
| А. УФ-свет. | 1. А, Б, В, Г, Д. |
| Б. Сульфат ртути (II) и 0,1%-й раствор дифенилкарбазона, $t^{\circ}\text{C}$. | 2. Г, А, Б, В, Д. |
| В. 10%-й раствор хлорида железа(III). | 3. Б, В, А, Г, Д. |
| Г. Реактив Драгендорфа. | 4. Д, А, Г, Б, В. |
| Д. Проведение реакции Браттона–Маршала. | |

43. Укажите порядок использования детектирующих реактивов при исследовании на I этапе ненаправленного ТСХ-скрининга веществ слабоосновного и основного характера:

- | | |
|--|-------------------|
| А. УФ-свет. | 1. А, Б, В, Г, Д. |
| Б. 10%-й раствор хлорида железа (III). | 2. А, Г, Д, Б, В. |
| В. 57%-й раствор хлорной кислоты и 0,5%-й раствор нитрита натрия (97:3). | 3. Г, Б, В, А, Д. |
| Г. Реактив Драгендорфа. | 4. Д, А, Б, Г, В. |
| Д. Проведение реакции Браттона–Маршала. | |

Перечень вопросов и заданий, выносимых на зачет

1. Растворимость и липофильность. Поверхностно-активные, мембран-активные фармакологические агенты и ион-проводящие антибиотики.
2. Химическое связывание и биологическая активность. Связь между фармакологической активностью, электронными свойствами и константами ионизации.
3. Стереохимические аспекты действия лекарств. Оптическая изомерия. Геометрическая изомерия. Биологическая активность конформеров.
4. Аденилатциклазная система передачи сигнала. цГМФ как вторичный посредник. Продукты метаболизма фосфолипидов как вторичные посредники. Ионы Ca^{2+} как вторичные посредники.
5. Классы ферментов. Оксидоредуктазы. Трансферазы. Гидролазы. Лиазы. Изомеразы. Лигаза (синтетаза).
6. Коферменты. Принципы действия ферментов. Кинетика ферментативных реакций.
7. Регуляция ферментативной активности.
8. Категории ингибиторов ферментов. Необратимые ингибиторы ферментов. Обратимые ингибиторы ферментов.
9. Регуляция активности мультиферментных систем.
10. Основные понятия фармакокинетики. Физико-химические свойства лекарственных веществ и их фармакокинетика. Фармакокинетические модели. Абсорбция. Количественные характеристики процесса абсорбции.
11. Распределение лекарственных веществ. Выведение лекарственных веществ. Количественные характеристики процесса выведения лекарственных веществ.
12. Фармакокинетика некоторых групп лекарственных средств. Метаболические пути и места метаболических превращений ксенобиотиков.
13. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые CYP450. Реакции I фазы метаболизма, катализируемые FAD-содержащими ферментами.
14. Восстановительные процессы. Гидролиз.
15. Реакции II фазы метаболизма ксенобиотиков.
16. Связь структуры и степени метаболизма лекарственных веществ.
17. Природное сырье как источник новых лекарственных средств. Официальные лекарственные средства как источник создания новых препаратов.
18. Физиологические посредники как источник новых лекарственных средств. Биоизостерические перемещения. Конформационные ограничения. Пролекарства.
19. Стратегия конструирования и синтеза химических библиотек. Комбинаторный синтез в растворах. Одностадийные методы синтеза. Двухстадийные методы синтеза. Трехстадийные методы синтеза.
20. Однореакторные методы синтеза (one-pot synthesis). Тандемные реакции.
21. Параллельный синтез индивидуальных соединений.
22. Классические жидкофазные реакции.
23. Способы очистки реакционных растворов от примесей. Синтез с использованием растворимого полимера. Комбинаторный синтез на твердом носителе. Линкеры.

24. Синтез гетероциклов на полимерном носителе. Методы установления структуры индивидуальных компонентов библиотек.
25. Индексные библиотеки.
26. Итерационная процедура распознавания веществ. Позиционное сканирование. Перспективы дальнейшего развития комбинаторного синтеза.
27. Общая классификация дескрипторов. Электронные дескрипторы. Топологические дескрипторы. Физико-химические дескрипторы. Химические дескрипторы.
28. Фармакофоры. Индикаторные дескрипторы.
29. Регрессионный анализ. Факторные модели в регрессионном анализе.
30. Эмпирические константы заместителей. Уравнения Гаммета и Тафта.
31. Аддитивная модель Фри-Вильсона. Метод Хэнча. Значение липофильности.
32. Метод сравнительного анализа молекулярных полей.

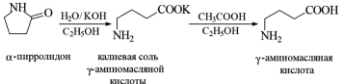
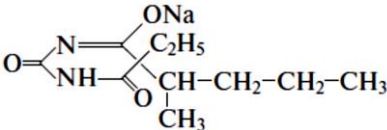
Таблица 9 – Примеры оценочных средств с ключами правильных ответов

№ п/п	Тип задания	Формулировка задания	Правильный ответ	Время выполнения (в минутах)
ПК-1. Способен оказывать информационную поддержку специалистам, осуществляющим научно-исследовательские работы				
1.	Задание закрытого типа	<i>Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа</i> При проведении общего (ненаправленного) ТСХ-скрининга НЕВОЗМОЖНО обнаружить вещества из группы: А. Опиатов. Б. Производных барбитуровой кислоты. В. Производных 1,4-бензодиазеина. Г. Каннабиноидов. Д. Производных фенотиазина.	Г	1 мин
2.		<i>Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа</i> Скрининговые методы позволяют: А. Полуколичественно определить токсиканты в биообъекте. Б. Отделить положительные пробы от отрицательных, определив групповую принадлежность токсикантов («металлический» яд, кислоты, щелочи). В. Отделить положительные пробы от отрицательных,	В	2 мин

№ п/ п	Тип задания	Формулировка задания	Правильный ответ	Время выполнени я (в минутах)
		определив групповую принадлежность токсиканта (производные барбитуровой кислоты, производное 1,4-бензодиаземина, алкалоид и т. д.). Г. Быстро провести качественное и количественное определение токсикантов в биообъекте.		
3.		<i>Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа</i> Реактив для отличия морфина от кодеина при проведении ТСХ-анализа: А. Хлорид железа. Б. Драгендорфа. В. Нesslerа. Г. Браттона–Маршала. Д. Хлорная кислота и нитрит натрия.	А	1 мин
4.		<i>Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа</i> При использовании в качестве детектирующего реагента раствор дифенилкарбазона и сульфата ртути выявляют: А. Фенольные соединения. Б. Соединения, содержащие третичный атом азота. В. Производные барбитуровой кислоты. Г. Производные 1,4-бензодиаземина. Д. Каннабиноиды.	В	1 мин
5.	Задание открытого типа	<i>Прочитайте текст и запишите развернутый ответ</i> С чем связана биологическая активность лекарственных препаратов?	Биологическая активность лекарственных препаратов связана с изменениями функций организма, которые могут нарушаться или оставаться неизменными. При попадании в организм биологические системы (органы, ткани) активно взаимодействуют с лекарственными препаратами в процессе обмена веществ,	7 мин

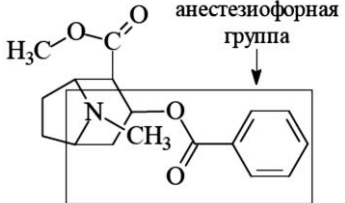
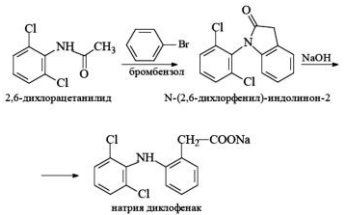
№ п/ п	Тип задания	Формулировка задания	Правильный ответ	Время выполнени я (в минутах)
			претерпевающая ряд превращений на пути его действия с образованием метаболитов. Взаимодействие может происходить в водной (биологические жидкости) или в липофильной (биологические мембраны) среде. В этом случае следует учитывать фактор среды. В ряде случаев метаболиты могут быть значительно активнее лекарственного препарата и способны привести к терригенным (воздействие на плод), мутагенным, канцерогенным изменениям в организме. Поэтому для использования лекарственных препаратов следует учитывать не только дозу, но и фактор времени.	
6.		<i>Прочитайте текст и запишите развернутый ответ</i> Какие методы проведения химических реакций используют для получения БАВ химическим способом?	Для получения БАВ химическим способом используют следующие методы проведения химических реакций: – превращение имеющихся в молекуле заместителей (реакции окисления, восстановления, конденсации); – введение новых заместителей (реакции галогенирования, сульфирования, нитрования, нитрозирования, алкилирования и ацилирования); – элиминирование заместителей для образования ненасыщенных связей; – циклизация путем раскрытия ненасыщенных связей или проведением реакции с выделением воды, спирта, углеводов и др; – перегруппировки позволяют получать соединения с определенным расположением заместителей путем уменьшения числа углеводородных атомов в молекуле или путем наращивания числа углеводородной цепи;	7 мин

№ п/ п	Тип задания	Формулировка задания	Правильный ответ	Время выполнени я (в минутах)
			– проведение регио- или энантиоселективных реакций связано с направленным воздействием на определенные реакционные центры путем подбора реагентов, условий реакции или изменением механизма реакции.	
7.		<i>Прочитайте текст и запишите развернутый ответ</i> Что собой представляют ауксины?	Ауксины имеют химическое строение природного ауксина индолил-3-уксусной кислоты (ИУК). Образуются из аминокислоты триптофана. Физиологические эффекты связаны с его действием на клеточном уровне, которое проявляется в регуляции растяжения, деления и дифференцирования, изменении положения различных органов растений (тропизм), что обусловлено разной скоростью растяжения клеток латеральных сторон осевых органов из-за неодинакового содержания в них ауксина. Под действием ауксина отмечается формирование проводящих флоэмных и ксилемных элементов в каллусной ткани.	7 мин
8.		<i>Прочитайте текст и запишите развернутый ответ</i> Какова основная задача технологии биосинтеза БАВ?	Основная задача технологии биосинтеза БАВ – преобразование природного сырья или отходов с помощью биологического объекта (микроорганизмов, изолированных клеток, ферментов, клеточных органелл), поддержание и активизация путей обмена клеток, ведущих к накоплению БАВ в целевом продукте при заметном подавлении других реакций обмена у культивируемого организма, а также получение клеток или их составных частей (преимущественно ферментов) для направленного изменения сложных молекул.	6 мин
9.	Задание	<i>Прочитайте текст,</i>	Гамма-аминомасляную кис-	7 мин

№ п/п	Тип задания	Формулировка задания	Правильный ответ	Время выполнения (в минутах)
	комбинированного типа	выберите один правильный вариант ответа и запишите аргументы, обосновывающие выбор ответа Щелочным гидролизом α-пирролидона и последующим осторожным подкислением образовавшейся соли получают: а) α-аминомасляную кислоту; б) γ-аминомасляную кислоту; в) изомасляную кислоту; г) янтарную кислоту	лоту получают щелочным гидролизом α-пирролидона и последующим осторожным подкислением образовавшейся соли до свободной γ-амино-масляной кислоты:  α-пирролидон + $\text{H}_2\text{O/KOH}$ / $\text{C}_2\text{H}_5\text{OH}$ $\rightarrow$ калиевая соль γ-аминомасляной кислоты $\xrightarrow{\text{CH}_3\text{COOH}/\text{C}_2\text{H}_5\text{OH}}$ γ-аминомасляная кислота	
10.		Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа и запишите аргументы, обосновывающие выбор ответа С помощью какого реактива в щелочной среде можно определить наличие в сахарах спиртовую и альдегидную группы: а) Na_2SO_4 б) CuSO_4 в) CaSO_4 г) MgSO_4	С помощью CuSO_4 в щелочной среде можно определить наличие в сахарах и спиртовых групп, и альдегидной. Выпадающий при взаимодействии сульфата меди с NaOH осадок гидроксида меди (II) растворяется в водном растворе сахаров, образуя фиолетово-синий комплекс уже при комнатной температуре. При стоянии этого раствора в результате окислительно-восстановительной реакции выделяется красный осадок закиси меди	7 мин
ПК-2. Способен выбирать и использовать технические средства и методы испытаний для решения исследовательских задач химической направленности, поставленных специалистом более высокой квалификации				
1.	Задание закрытого типа	Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа На рисунке изображена структурная формула:  А. Фенобарбитала. Б. Диазепама. В. Аминазина. Г. Этаминала натрия.	Г	1 мин

№ п/ п	Тип задания	Формулировка задания	Правильный ответ	Время выполнени я (в минутах)
		Д. Тиопентала натрия.		
2.		Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа Наиболее эффективно из трупного материала извлекаются производные барбитуровой кислоты: А. Методом П. Валоуа. Б. Методом Стаса–Отто. В. Методом В. Ф. Крамаренко. Г. Жидкость-жидкостной экстракцией при рН 2–3. Д. Жидкость-жидкостной экстракцией при рН 9–10.	А	1 мин
3.		Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа Условия гидролиза производных 1,4-бензодиазепина: А. Концентрированная HCl, нагревание. Б. Концентрированная H₂SO₄, нагревание. В. Концентрированная HNO₃, нагревание. Г. 10%-й раствор NaOH, нагревание. Д. Фермент глюкуронидаза, термостатирование при 37 °С.	А	1 мин
4.		Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа К общеалкалоидным осадительным реактивам НЕ относится: А. Реактив Драгендорфа. Б. Пикриновая кислота. В. Фосфорномолибденовая кислота. Г. Реактив Марки. Д. Фосфорновольфрамовая кислота.	Г	1 мин
5.	Задание открытого типа	Прочитайте текст и запишите развернутый	Требования к промышленным штаммам: стабильность структурно-	5 мин

№ п/ п	Тип задания	Формулировка задания	Правильный ответ	Время выполнени я (в минутах)
		<i>ответ</i> Перечислите основные требования к промышленным штаммам?	морфологических признаков и физиологической активности при длительном хранении и эксплуатации в производстве; повышенные скорости роста и биосинтеза целевых продуктов в лабораторных и производственных условиях; широкий диапазон устойчивости к воздействию неблагоприятных внешних факторов - колебанию температуры, pH среды, аэрации, перемешиванию, вязкости среды; умеренная требовательность к ограниченному числу источников питания	
6.		<i>Прочитайте текст и запишите развернутый ответ</i> Какими свойствами в плане биологической активности обладают производные оксазолов?	Среди производных оксазолов найдены снотворные и антиконвульсанты, имеющие строение 1,3-оксазолидин-2,4-дионов. Однако наибольшее значение приобрел антибактериальный агент циклосерин, представляющий собой 4-амино-1,2-оксазолидин-3-он, который является природным продуктом метаболизма, вырабатываемым некоторыми микроорганизмами	5 мин
7.		<i>Прочитайте текст и запишите развернутый ответ</i> В качестве каких средств используют фенол, резорцин и тимол?	Фенол, резорцин и тимол применяют в качестве антисептических средств. Фенол – едкое вещество, вызывает ожоги кожи и слизистых оболочек. Поэтому 3–5%-ные растворы фенола применяют главным образом для дезинфекции инструментов, белья, очагов инфекций. Резорцин менее токсичен и его назначают при лечении кожных заболеваний в виде водных, спиртовых растворов и мазей. Еще меньшая токсичность тимола позволяет применять его внутрь в качестве антисептического средства при заболеваниях желудочно-кишечного тракта и как противоглистное средство. Фенол и крезол	7 мин

№ п/ п	Тип задания	Формулировка задания	Правильный ответ	Время выполнени я (в минутах)
			используют и как консерванты некоторых жидких лекарственных форм.	
8.		Прочитайте текст и запишите развернутый ответ Где применяют сложные эфиры <i>p</i>-аминобензойной кислоты?	Их применяют в качестве местноанестезирующих средств. Предпосылкой создания синтетических обезболивающих веществ стало открытие структуры анестезиоформной группы, обуславливающей местный эффект анестезии, в природном алкалоиде кокаине:  анестезиоформная группа кокаин кокаин обладает не только местноанестезирующим эффектом, но и вызывает пристрастие (кокаинизм), поэтому было синтезировано и исследовано несколько тысяч соединений различных классов, содержащих анестезиоформную группу. Местноанестезирующие вещества влияют на процесс генерации возбуждения и способность блокировать прохождение импульса по нервным волокнам.	7 мин
9.	Задание комбинированного типа	Прочитайте текст, выберите один правильный вариант ответа и запишите аргументы, обосновывающие выбор ответа На основе 2,6-дихлорацетанилида можно получить: а) натрия диклофенак; б) ибупрофен в) кокаин г) бензокаин	Натриевую соль диклофенака синтезируют из 2,6-дихлорацетанилида и бромбензола. Образующееся гетероциклическое соединение подвергают гидролизу:  2,6-дихлорацетанилид бромбензол N-(2,6-дихлорфенил)-индолин-2-он натрия диклофенак	7 мин
10.		Прочитайте текст, выберите один правильный	Количественное определение тримекaina и лидокаина гидрохлоридов выполняют	7 мин

№ п/ п	Тип задания	Формулировка задания	Правильный ответ	Время выполнени я (в минутах)
		<i>вариант ответа и запишите аргументы, обосновывающие выбор ответа</i> Количественное определение тримекаина и лидокаина гидрохлоридов выполняют методом: а) кислотно-основного титрования; б) окислительно-восстановительного титрования; в) неводного титрования; г) титрования по осадку	методом неводного титрования, используя в качестве растворителя смесь муравьиной кислоты и уксусного ангидрида (1:20). Титруют 0,1 М раствором хлорной кислоты с индикатором кристаллическим фиолетовым (при титровании лидокаина индикатор – Судан III). Кроме неводного титрования применимо также кислото-основное титрование в водной среде по связанной хлороводородной кислоте и аргентометрия по хлорид-иону.	

Полный комплект оценочных материалов по дисциплине (фонд оценочных средств) хранится в электронном виде на кафедре, утверждающей рабочую программу дисциплины.

7.4. Методические материалы, определяющие процедуры оценивания результатов обучения по дисциплине

Текущий и внутрисеместровый контроль, промежуточная аттестация учебных достижений студентов проводится путем балльно-рейтинговой системы. Общая оценка учебных достижений студента в семестре по учебному курсу определяется как сумма баллов, полученных студентом по различным формам текущего и промежуточного контроля в течение данного семестра. Успешность изучения дисциплины в течение семестра оценивается, исходя из 100 максимально возможных баллов (90 баллов на текущие формы контроля и до 10 баллов отводится на бонусы), которые накапливаются студентом в течение всего семестра изучения дисциплины.

Таблица 10 – Технологическая карта рейтинговых баллов по дисциплине

№ п/п	Контролируемые мероприятия	Количество мероприятий / баллы	Максимальное количество баллов	Срок представления
Основной блок				
1.	Отчет по л/р	6/10	60	По расписанию
2.	Тестирование	1/15	15	По расписанию
3.	Реферат	1/15	15	
Всего			90	
Блок бонусов				
4.	Посещение занятий	-	2	
5.	Своевременная сдача отчетов по лабораторным работам	-	4	
6.	Активность на занятии	-	4	
Всего			10	

№ п/п	Контролируемые мероприятия	Количество мероприятий / баллы	Максимальное количество баллов	Срок представления
ИТОГО			100	

Таблица 11 – Система штрафов (для одного занятия)

Показатель	Балл
Опоздание на занятие	-1
Нарушение учебной дисциплины	-1
Неготовность к занятию	-2
Пропуск занятия без уважительной причины	-2

Таблица 12 – Шкала перевода рейтинговых баллов в итоговую оценку за семестр по дисциплине

по дисциплине		
Сумма баллов	Оценка по 4-балльной шкале	
90–100	5 (отлично)	Зачтено
85–89	4 (хорошо)	
75–84		
70–74		
65–69	3 (удовлетворительно)	
60–64		
Ниже 60	2 (неудовлетворительно)	Не зачтено

При реализации дисциплины в зависимости от уровня подготовленности обучающихся могут быть использованы иные формы, методы контроля и оценочные средства, исходя из конкретной ситуации.

8. УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ И ИНФОРМАЦИОННОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

8.1. Основная литература

1. Бухаров С.В., Химия и технология продуктов тонкого органического синтеза [Электронный ресурс] : учебное пособие / С.В. Бухаров, Г.Н. Нугуманова. - Казань : Издательство КНИТУ, 2013. - 268 с. - ISBN 978-5-7882-1436-8 - Режим доступа: <http://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785788214368.html> (ЭБС «Консультант студента»).
2. Хайрутдинов Ф.Г., Синтез лекарственных веществ [Электронный ресурс] / Ф.Г. Хайрутдинов и др. - Казань : Издательство КНИТУ, 2014. - 136 с. - ISBN 978-5-7882-1620-1 - Режим доступа: <http://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785788216201.html> (ЭБС «Консультант студента»).

8.2. Дополнительная литература

1. Смит В.А., Основы современного органического синтеза [Электронный ресурс] : учебное пособие / В.А. Смит, А.Д. Дильман. - 4-е изд. (эл.). - М. : БИНОМ, 2015. - 753 с. - ISBN 978-5-9963-2369-2 - Режим доступа: <http://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785996323692.html> (ЭБС «Консультант студента»).
2. Орехов С.Н., Фармацевтическая биотехнология / Орехов С.Н. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2013. - 384 с. - ISBN 978-5-9704-2499-5 - Текст : электронный // ЭБС "Консультант

студента" : [сайт]. - URL : <http://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970424995.html> - Режим доступа : по подписке. (ЭБС «Консультант студента»).

8.3. Интернет-ресурсы, необходимые для освоения дисциплины

Электронная библиотека «Астраханский государственный университет» собственной генерации на платформе ЭБС «Электронный Читальный зал – БиблиоТех». <https://biblio.asu.edu.ru>

Электронно-библиотечная система (ЭБС) ООО «Политехресурс» «Консультант студента». Многопрофильный образовательный ресурс «Консультант студента» является электронной библиотечной системой, предоставляющей доступ через сеть Интернет к учебной литературе и дополнительным материалам, приобретенным на основании прямых договоров с правообладателями. Каталог в настоящее время содержит около 15000 наименований.

www.studentlibrary.ru.

9. МАТЕРИАЛЬНО-ТЕХНИЧЕСКОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

Материально-техническое обеспечение учебной дисциплины включает в себя лекционную аудиторию, лабораторию по проведению лабораторного практикума. Лабораторный практикум обеспечен химическими реактивами, лабораторной посудой и учебно-научным оборудованием: шкафы для химических реактивов и химической посуды, набор химических реактивов, набор химической посуды.

Рабочая программа дисциплины при необходимости может быть адаптирована для обучения (в том числе с применением дистанционных образовательных технологий) лиц с ограниченными возможностями здоровья, инвалидов. Для этого требуется заявление обучающихся, являющихся лицами с ограниченными возможностями здоровья, инвалидами, или их законных представителей и рекомендации психолого-медико-педагогической комиссии. Для инвалидов содержание рабочей программы дисциплины (модуля) может определяться также в соответствии с индивидуальной программой реабилитации инвалида (при наличии).