

**Министерство науки и высшего образования Российской Федерации
Филиал федерального государственного бюджетного образовательного
учреждения высшего образования «Российский химико-
технологический университет имени Д.И. Менделеева»
в городе Ташкенте (Республика Узбекистан)**

«УТВЕРЖДАЮ»

Исполнительный директор

_____ Б.Э. Нурматов

«29» августа 2024 г.

РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ

«Медицинская химия. Основы фармакологии»

Направление подготовки 18.04.01 Химическая технология

**Магистерская программа – «Химическая технология биологически
активных веществ»**

Квалификация «магистр»

Ташкент 2024

Программа составлена на кафедре Химии и технологии биомедицинских препаратов.
Авторы программы: к.х.н., доц. Крыщенко Ю.К., к.х.н., доц. Поливанова А.Г.

Программа рассмотрена и одобрена на заседании кафедры Химии и технологии биомедицинских препаратов «22» мая 2024 г., протокол №9.

1. ЦЕЛЬ И ЗАДАЧИ ДИСЦИПЛИНЫ

Программа составлена в соответствии с требованиями Федерального государственного образовательного стандарта высшего образования – магистратура по направлению подготовки **18.04.01 Химическая технология** (ФГОС ВО), рекомендациями Методической комиссии и накопленным опытом преподавания дисциплины кафедрой Химии и технологии биомедицинских препаратов РХТУ им. Д.И. Менделеева. Программа рассчитана на изучение дисциплины в течение одного семестра.

Дисциплина «Медицинская химия. Основы фармакологии» относится к общей части дисциплин учебного плана, формируемой участниками образовательных отношений. Программа дисциплины предполагает, что обучающиеся имеют теоретическую и практическую подготовку в области общей, неорганической и органической химии, биохимии, а также в области химии биологически активных веществ.

Цель дисциплины – научить студентов разбираться в основах фармакологии и структурного дизайна физиологически активных веществ, то есть видеть взаимосвязь между химической структурой и физиологической активностью, а также решать обратную задачу «структура – свойство» – конструировать необходимые структуры, обладающие заданным свойством.

Задачи дисциплины:

- рассмотрение фармакодинамики препаратов, а именно, взаимодействия с рецепторными системами, краткая характеристика таких систем и некоторых нейромедиаторов;
- изучение вопросов физиологии и патологической биохимии человека, касающихся рассматриваемых в рамках дисциплины классов лекарственных препаратов;
- ознакомление с принципами разработки лекарственных средств.

Дисциплина «Медицинская химия. Основы фармакологии» преподается в 3-м семестре. Контроль успеваемости студентов ведется по принятой в университете рейтинговой системе.

Рабочая программа дисциплины может быть реализована с применением электронных образовательных технологий и электронного обучения полностью или частично.

2. ТРЕБОВАНИЯ К РЕЗУЛЬТАТАМ ОСВОЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ

Изучение дисциплины направлено на приобретение следующих **компетенций и индикаторов их достижения:**

Профессиональные компетенции и индикаторы их достижения:

| Задача профессиональной деятельности | Объект или область знания | Код и наименование ПК | Код и наименование индикатора достижения ПК | Основание (профессиональный стандарт, анализ опыта) Обобщенные трудовые функции |
|--|--|--|--|--|
| Научно-исследовательский тип задач профессиональной деятельности | | | | |
| Выполнение фундаментальных и прикладных работ поискового, теоретического и экспериментального характера с целью определения технических характеристик новой техники, а также комплекса работ по разработке технологической документации. | Химическое, химико-технологическое производство Сквозные виды профессиональной деятельности в промышленности (в сфере организации и проведения научно-исследовательских и опытно-конструкторских работ в области химического и химико-технологического производства). | ПК-2. Способен к поиску, обработке, анализу и систематизации научно-технической информации по теме исследования, выбору методик и средств решения задачи | ПК-2.1. Знает алгоритм поиска, оценки и анализа научно-технической информации; ПК-2.2. Умеет обобщать и систематизировать научно-техническую информацию; ПК-2.3. Владеет навыками соотнесения результатов собственной научной работы с отечественным и зарубежным опытом по тематике исследования. | Профессиональный стандарт 40.011 «Специалист по научно-исследовательским и опытно-конструкторским разработкам», утвержденный приказом Министерства труда и социальной защиты Российской Федерации от 04.03.2014 № 121 н, Обобщенная трудовая функция С. Проведение научно-исследовательских и опытно-конструкторских разработок. С /01.6. Осуществление научного руководства проведением исследований по отдельным задачам (уровень квалификации – 6). |
| | | ПК-5 Способен осуществлять самостоятельные научные исследования в области химии и технологии биологически активных веществ | ПК-5.1. Знает методы получения, особенности производства, свойства и механизмы действия биологически активных веществ различных классов; ПК-5.2. Знает теоретические основы функционирования живых организмов в норме и при патологии, необходимые для осуществления научных исследований по химии биологически активных веществ; | |

В результате изучения дисциплины студент магистратуры должен:

Знать:

- классификацию лекарственных препаратов;
- основные понятия фармакокинетики (введение ЛС, всасывание, распределение, депонирование, метаболизм, выведение);
- основные фармакологические эффекты, понятия метаболит, антиметаболит, определение «рецептор», типы рецепторов и т. д.;
- основные подходы для синтеза антиметаболитов.

Уметь:

- работать со специальной литературой: регистром лекарственных средств, Государственной Фармакопеей РФ.

Владеть:

- теоретическими знаниями в области синтеза и анализа фармакологически активных веществ.

3. ОБЪЕМ ДИСЦИПЛИНЫ И ВИДЫ УЧЕБНОЙ РАБОТЫ

| Вид учебной работы | Объем дисциплины | | |
|--|------------------|-------------|--------------|
| | ЗЕ | Акад. ч. | Астр. ч. |
| Общая трудоемкость дисциплины | 4 | 144 | 108 |
| Контактная работа – аудиторные занятия: | 1,42 | 51 | 38,25 |
| Лекции | 0,95 | 34 | 25,5 |
| Практические занятия | 0,47 | 17 | 12,75 |
| в том числе в форме практической подготовки | 0,47 | 17 | 12,75 |
| Самостоятельная работа | 1,58 | 57 | 42,75 |
| Самостоятельное изучение разделов дисциплины | 1,58 | 57 | 42,57 |
| Вид контроля: | | | |
| Экзамен | 1 | 36 | 27 |
| Контактная работа – промежуточная аттестация | 1 | 0,4 | 0,3 |
| Подготовка к экзамену. | | 35,6 | 26,7 |
| Вид итогового контроля: | Экзамен | | |

4. СОДЕРЖАНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

4.1. Разделы дисциплины и виды занятий

| № п/п | Раздел дисциплины | Академ. часов | | | | | |
|-----------|--|---------------|--------------------------------|-----------|---------------|--------------------------------|----------------|
| | | Всего | в т.ч. в форме пр. подг. | Лекции | Прак. зан. | в т.ч. в форме пр. подг. | Сам. работа |
| | Введение | 3 | - | 1 | - | - | 2 |
| 1. | Общая фармакология | 34 | 4 | 10 | 4 | 4 | 20 |
| 1.1 | Фармакокоинетика. Основные понятия | 7 | 1 | 2 | 1 | 1 | 4 |
| 1.2 | Метаболизм ксенобиотиков | 7 | 1 | 2 | 1 | 1 | 4 |
| 1.3 | Фармакодинамика. Основные понятия | 7 | 1 | 2 | 1 | 1 | 4 |
| 1.4 | Нейромедиаторные процессы | 7 | 1 | 2 | 1 | 1 | 4 |
| 1.5 | Ферменты и гормоны | 6 | - | 2 | - | - | 4 |
| 2. | Разработка лекарственных средств | 10 | 2 | 2 | 2 | 2 | 6 |
| 3. | Отдельные классы лекарственных средств | 42 | 5 | 17 | 5 | 5 | 20 |
| 3.1 | Средства, действующие на нервную систему | 10 | 1 | 4 | 1 | 1 | 5 |
| 3.2 | Средства, действующие на сердечно-сосудистую систему | 9 | 1 | 3 | 1 | 1 | 5 |
| 3.3 | Хемиотерапевтические противомикробные средства | 11,5 | 1,5 | 5 | 1,5 | 1,5 | 5 |
| 3.4. | Хемиотерапевтические противораковые средства | 11,5 | 1,5 | 5 | 1,5 | 1,5 | 5 |
| 4. | Избранные вопросы современной медицинской химии | 17 | 4 | 4 | 4 | 4 | 9 |
| | ИТОГО | 108 | 17 | 34 | 17 | 17 | 57 |
| | Экзамен | 36 | - | - | - | - | - |
| | ИТОГО | 144 | - | - | - | - | - |

4.2 Содержание разделов дисциплины

Введение. Предмет медицинской химии. История развития медицинской химии. Ключевые открытия в медицинской химии и их влияние на развитие медицины и общества в целом. Связь медицинской химии с другими отраслями науки. Общественная значимость фармакологии и фармакологической индустрии. Определение лекарства. Взаимосвязь строения и свойств. Фармакокинетика и фармакодинамика. Токсическая и эффективная дозы. Видовые и возрастные различия.

Раздел 1. Общая фармакология

1.1 Фармакокинетика. Основные понятия. Определение фармакокинетики. Строение прокариотической и эукариотической клеток. Строение клеточных мембран. Адсорбция. Способы введения лекарств в организм, их особенности. Биодоступность. Зависимость биодоступности от лекарственной формы. Пути проникновения веществ в клетку. Мембранные поры, каналы и насосы. Активный и пассивный транспорт. Значение липофильности и ионизации веществ. Распределение и накопление лекарств в органах и тканях. Условия подобия лекарству (правила Липински).

1.2 Метаболизм ксенобиотиков. Лекарства как ксенобиотики. Первая стадия метаболизма ксенобиотиков. Оксигеназы смешанных функций и катализируемые ими процессы функционализации липофильных молекул. Индуцирование оксигеназ химически инертными ксенобиотиками на примере тетрахлордibenзодиоксиана. Изменение активности веществ в процессе метаболизма. Пролекарства. Вторая стадия метаболизма ксенобиотиков. Сочетание с глюкуроновой кислотой, сульфатом, глутатионом. Роль микрофлоры кишечника в метаболизме ксенобиотиков. Выведение лекарств из организма. Взаимодействие лекарств. Фармакокинетический синергизм и антагонизм.

1.3 Фармакодинамика. Основные понятия. Определение фармакодинамики. Типы рецепторов: ионотропные и метаботропные рецепторы. Локализация рецепторов в клетке. Условия взаимодействия лекарства с рецептором. Значение хиральности молекул. Модели взаимодействия малой молекулы и макромолекулы: «ключ-замок» и индуцированное соответствие. Силы, участвующие во взаимодействии. Нативные лиганды, агонисты, антагонисты, обратные агонисты. Синергизм и антагонизм – фармакодинамический аспект.

1.4 Нейромедиаторные процессы. Процесс распространения и передачи нервного импульса. Значение и принципиальные способы воздействия на процессы передачи нервных импульсов. Ацетилхолин, холинэстераза, типы холинорецепторов. Норадреналин, адренорецепторы, их типы. Эффект стимуляции и блокады, примеры лекарств. Дофамин, дофаминовые рецепторы. Серотонин и его рецепторы. Стимуляторы и антагонисты гистаминовых рецепторов. ГАМК, ее роль. Пептидные нейромедиаторы. Опиатные рецепторы. Опиаты. Естественные антагонисты опиатных рецепторов. Морфин, механизм воздействия, абстинентный синдром. Психологическая зависимость.

1.5 Ферменты и гормоны. Ферментативный катализ. Принцип действия ферментов. Ферменты – определение, классификация, строение, номенклатура. Коферменты. Регуляторные ферменты. Ингибирование ферментов. Обратимое ингибирование, типы обратимого ингибирования. Необратимое ингибирование. Инактивация. Медленное прочное связывание. Метаболиты и антиметаболиты. Ангиотензин-конвертирующий фермент, его роль. Примеры лекарств, действующих на ферментативные системы – обратимые и необратимые ингибиторы. Определение гормонов, разница между гормонами и нейромедиаторами. Железы внутренней секреции. Классификация гормонов. Пептидные гормоны. Инсулин. Сахарный диабет. Аминные гормоны. Адреналин. Тироксин и гормоны щитовидной железы. Дефицит йода. Стероидные гормоны. Глюкокортикоиды и минералокортикоиды.

Раздел 2. Разработка лекарственных средств

Драг-дизайн – определение. История направленного конструирования лекарственных веществ. Основные понятия. Этапы создания лекарства. Определение и валидация мишени. Комбинаторная химия. Скрининг, его виды. Достоинства и недостатки комбинаторного подхода. Поиск новых лекарственных средств в природных источниках. Подход к драг-дизайну на основе природных соединений. Роль вычислительной техники, молекулярный докинг. Клинические испытания. Добровольцы. Вопросы этики в клинических испытаниях. Двойной слепой метод организации испытаний. Стадии клинических испытаний. Вопросы интеллектуальной собственности. стоимость разработки лекарственных средств. Торговые названия. Дженоерики. Подделка лекарственных средств.

Раздел 3. Отдельные классы лекарственных средств

3.1 Средства, действующие на нервную систему. Способы классификации лекарственных средств. Классификация по лечебному действию, по строению, по источникам получения. Группы лекарственных средств по Машковскому. Особое положение средств для диагностики. Средства для наркоза: средства для ингаляционного и неингаляционного наркоза. Психотропные лекарственные средства. Нейролептики. Социальная значимость нейролептических препаратов. Успокоительные (анксиолитические) препараты, их основное и побочное действие. Клиническая депрессия и антидепрессанты. Ингибиторы моноаминоксидазы и ингибиторы обратного захвата серотонина. Снотворные средства. Требования, предъявляемые к снотворным средствам. Противосудорожные (противоэпилептические) препараты. Ноотропные препараты. Обезболивающие препараты. Наркотические обезболивающие средства – опиаты и опиоиды. Привыкание, физиологическая зависимость. Ненаркотические обезболивающие средства и нестероидные противовоспалительные препараты. Вещества, возбуждающие нервную систему – интенсификация процессов возбуждения в головном и спинном мозге. Средства для лечения паркинсонизма – холинэргические и дофаминэргические. Рвотные и противорвотные препараты.

Средства, влияющие на холинэргические синапсы. взаимодействие лекарств с М- и Н-холинорецепторами. Вещества, взаимодействующие с адренорецепторами. Альфа-адреномиметики и адреноблокаторы. Бета-адреномиметики и адреноблокаторы. Вещества, взаимодействующие с гистаминовыми рецепторами. Противоаллергические и противоязвенные антигистаминовые препараты. Средства для местной анестезии. Способы применения средств для местной анестезии.

3.2 Средства, действующие на сердечно-сосудистую систему. Классификация средств, действующих на сердечно-сосудистую систему. Кардиотонические средства. Сердечные гликозиды – препараты наперстянки. Опасности, связанные с применением сердечных гликозидов. Синтетические кардиотонические средства. Аритмия. Антиаритмические препараты различных классов. Антигипертензивные препараты. Ингибиторы ангиотензин-конвертирующего фермента. Блокаторы ангиотензиновых рецепторов. Спазмолитики. Мочегонные препараты. Салуретики, калий-сберегающие препараты, осмотические диуретики.

3.3 Хемиотерапевтические противомикробные средства. Различие хемиотерапевтических и фармакодинамических лекарственных средств. Антибактериальные препараты – история появления, общественная значимость. Мишени для воздействия на бактериальную клетку. Антибиотики как природные или полусинтетические антибактериальные препараты. Группы антибиотиков – бета-лактамы, тетрациклины, аминогликозиды, макролиды. Резистентность бактерий к антибиотикам. Причины возникновения резистентности. Перекрестная резистентность. Фармакологические методы борьбы с резистентностью. Ингибиторы бета-лактамаз. Комбинированные препараты. Административные методы борьбы с резистентностью бактерий. Синтетические антибактериальные препараты. Сульфамидные производные.

Синергетический и антагонистический результат совместного применения антибактериальных препаратов. Производные хинолина. Фторхинолоны. Производные нитрофурана. Препараты для лечения туберкулеза. Противовирусные препараты.

3.4 Хемиотерапевтические противораковые средства. Онкологические заболевания как болезни, актуальные для развитых стран. Принципиальные подходы к химиотерапии раковых заболеваний. Классификация противораковых средств. Антипролифератические препараты. Неоангиогенез. Алкиляторы как противораковые средства. Производные бета-хлорэтиламинов. Антиметаболиты. Производные фторурацила. Природные антипролифератические средства. Противораковые антибиотики. Стабилизаторы веретена деления. Топоизомеразы, их ингибирование как способ остановки репликации ДНК. Препараты на основе платины. Плоско-квадратная структура комплексов. Побочные эффекты антипролифератических препаратов.

Раздел 4. Избранные вопросы современной медицинской химии. Вопросы доказательной медицины. Разница в подходе к спорным методикам в различных научных школах. Эффект плацебо и способы его нивелирования. Опасность гомеопатии и иных антинаучных методик. Прионные заболевания, прионы как особый класс инфекционных агентов. Анигипоксанты и антиоксиданты. Иммуносупрессоры и иммуномодуляторы. Основные положения стандартов GLP и GMP (надлежащей лабораторной и производственной практики). Особенности получения лекарственных средств из растительного сырья. Методы установления первичной, вторичной и третичной структуры белков. Жизненный цикл и классификация вирусов. Нобелевские премии по химии за последние годы с точки зрения применения в медицинской химии.

5. СООТВЕТСТВИЕ СОДЕРЖАНИЯ ТРЕБОВАНИЙ К РЕЗУЛЬТАТАМ ОСВОЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ

| № | В результате освоения дисциплины студент должен: | | Раздел 1 | Раздел 2 | Раздел 3 | Раздел 4 |
|--|--|---|-------------|-------------|-------------|-------------|
| | Знать: | | | | | |
| 1 | – классификацию лекарственных препаратов; | | | | + | + |
| 2 | – основные понятия фармакокинетики (введение ЛС, всасывание, распределение, депонирование, метаболизм, выведение); | | + | | | + |
| 3 | – основные фармакологические эффекты, понятия метаболит, антиметаболит, определение «рецептор», типы рецепторов и т. д.; | | + | | | + |
| 4 | – основные подходы для синтеза антиметаболитов. | | | + | + | + |
| | Уметь: | | | | | |
| 5 | – работать со специальной литературой: регистром лекарственных средств, Государственной Фармакопеей РФ. | | + | + | + | + |
| | Владеть: | | | | | |
| 6 | – теоретическими знаниями в области синтеза и анализа фармакологически активных веществ. | | + | + | + | + |
| В результате освоения дисциплины студент должен приобрести следующие <i>профессиональные компетенции и индикаторы их достижения:</i> | | | | | | |
| | Код и наименование ПК | Код и наименование индикатора достижения ПК | | | | |
| 7 | ПК-2. Способен к поиску, обработке, анализу и систематизации научно-технической информации по теме исследования, выбору методик и средств решения задачи | ПК-2.1. Знает алгоритм поиска, оценки и анализа научно-технической информации; | + | + | + | + |
| | | ПК-2.2. Умеет обобщать и систематизировать научно-техническую информацию; | + | + | + | + |
| | | ПК-2.3. Владеет навыками соотнесения результатов собственной научной работы с отечественным и зарубежным опытом по тематике исследования. | + | + | + | + |
| 8 | ПК-5 Способен осуществлять самостоятельные научные исследования в области | ПК-5.1. Знает методы получения, особенности производства, свойства и механизмы действия биологически активных веществ различных классов; | | + | + | + |

| | | | | | | |
|--|--|--|---|---|---|---|
| | химии и технологии биологически активных веществ | ПК-5.2. Знает теоретические основы функционирования живых организмов в норме и при патологии, необходимые для осуществления научных исследований по химии биологически активных веществ; | + | + | + | + |
|--|--|--|---|---|---|---|

6. ПРАКТИЧЕСКИЕ И ЛАБОРАТОРНЫЕ ЗАНЯТИЯ

6.1. Практические занятия

Примерные темы практических занятий по дисциплине.

| № п/п | № раздела дисциплины | Темы практических занятий | Часы |
|-------|----------------------|---|------|
| 1 | 1 | Фармакокоинетика. Основные понятия | 1 |
| 2 | | Метаболизм ксенобиотиков | 1 |
| 3 | | Фармакодинамика. Основные понятия | 1 |
| 4 | | Нейромедиаторные процессы | 1 |
| 6 | 2 | Основные принципы процесса разработки лекарственных средств | 2 |
| 7 | 3 | Средства, действующие на нервную систему | 1 |
| 8 | | Средства, действующие на сердечно-сосудистую систему | 1 |
| 9 | | Хемиотерапевтические противомикробные средства | 1,5 |
| 10 | | Хемиотерапевтические противораковые средства | 1,5 |
| 11 | 4 | Избранные вопросы современной медицинской химии | 4 |

7. САМОСТОЯТЕЛЬНАЯ РАБОТА

Самостоятельная работа проводится с целью углубления знаний по дисциплине и предусматривает:

- ознакомление и проработку рекомендованной литературы, работу с электронно-библиотечными системами, включая переводы публикаций из научных журналов, цитируемых в базах Scopus, Web of Science, Chemical Abstracts, РИНЦ;
- посещение отраслевых выставок и семинаров;
- участие в семинарах РХТУ им. И. Менделеева по тематике дисциплины;
- подготовку к выполнению контрольных работ по материалу лекционного курса;
- подготовку реферата по индивидуальной тематике;
- подготовку к сдаче экзамена по дисциплине.

Планирование времени на самостоятельную работу, необходимого на изучение дисциплины, студентам лучше всего осуществлять на весь период изучения, предусматривая при этом регулярное повторение пройденного материала. Материал, законспектированный на лекциях, необходимо регулярно дополнять сведениями из литературных источников, представленных в рабочей программе. При работе с указанными источниками рекомендуется составлять краткий конспект материала, с обязательным фиксированием библиографических данных источника.

8. ПРИМЕРЫ ОЦЕНОЧНЫХ СРЕДСТВ ДЛЯ КОНТРОЛЯ ОСВОЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ

Совокупная оценка по дисциплине складывается из оценок за выполнение контрольных работ (максимальная оценка 45 баллов), реферата (максимальная оценка 15 баллов) и итогового контроля в форме экзамена (максимальная оценка 40 баллов).

8.1. Примерная тематика реферативно-аналитической работы.

Примерный перечень тем рефератов:

Для указанного лекарственного препарата необходимо провести реферативно-аналитическое исследование и подготовить реферат. В реферате должны быть отражены следующие вопросы: история разработки препарата, его основное биологическое действие, применение в медицинской практике, особенности фармакокинетики и фармакодинамики, актуальная схема синтеза действующего вещества, лекарственные формы, в виде которых препарат применяется, спектр побочного действия препарата, особенности метаболизма и выведения.

- 1) Абиратерон
- 2) Ацетаминофен
- 3) Амфетамин
- 4) Атазанавир
- 5) Атенолол
- 6) Бупренофин
- 7) Бупивакаин
- 8) Валсатран
- 9) Галоперидол
- 10) Гидрокортизон
- 11) Дабигатран
- 12) Дарунавир
- 13) Дигоксин
- 14) Доксициклин
- 15) Дулоксетин
- 16) Кетоконазол
- 17) Левотироксин
- 18) Лидокаин
- 19) Лизиноприл
- 20) Метилфенидат
- 21) Мельдоний
- 22) Модафинил
- 23) Остельмавир
- 24) Омепразол
- 25) Оксикодон
- 26) Ралоксифен
- 27) Сальбутамол

- 28) Сальварсан
- 29) Силденафил
- 30) Солифенацин
- 31) Тенофовир
- 32) Талидомид
- 33) Флутиказон
- 34) Флуцитозин
- 35) Фуросемид
- 36) Циклофосфан

8.2. Примеры контрольных вопросов для текущего контроля освоения дисциплины

Для текущего контроля предусмотрено 3 контрольных работы (по одной контрольной работе для первого, третьего и четвертого разделов). Максимальная оценка за контрольные работы составляет по 15 баллов за каждую.

Раздел 1. Общая фармакология. Примеры вопросов к контрольной работе № 1. Максимальная оценка – 15 баллов. Контрольная работа содержит 3 вопроса, по 5 баллов за вопрос.

Вопрос 1.1.

1. Медицинская химия – предмет, история развития. Фармакокинетика – определение, общие положения.
2. Взаимосвязь между структурой органического вещества и биологической активностью. Условия подобия лекарству (Правила Липински). Значение оптической активности молекул.
3. Основные процессы, происходящие с веществами в организме (ADME) – общая характеристика.
4. Строение биологических мембран. Пути проникновения химических веществ через мембраны.
5. Метаболизм лекарственных веществ. Пролекарства.
6. Распространение и передача нервного импульса. Нейромедиаторы. Способы влияния на передачу и распространение нервного импульса.

Вопрос 1.2

1. Фармакодинамика – определение, предмет. Рецепторы. Биохимические мишени для лекарственных средств. Связывание лекарства с мишенью.
2. Мишени для разработки лекарственных средств. Виды рецепторов – сходства и различия
3. Агонисты и антагонисты. Различия, сходства, примеры.

Вопрос 1.3.

1. Холинорецепторы. Способы влияния на передачу нервного импульса.
2. Адренорецепторы. Способы влияния на передачу нервного импульса.
3. ГАМК-рецепторный комплекс. Способы влияния на передачу нервного импульса.
4. Гормоны, их роль в организме. Типы гормонов.

Раздел 2. Разработка лекарственных средств. Итоговый контроль по Разделу 2 проводится в форме реферата, максимальная оценка за который составляет 15 баллов.

Раздел 3. Отдельные классы лекарственных средств. Примеры вопросов к контрольной работе № 2. Максимальная оценка – 15 баллов. Контрольная работа содержит 3 вопроса, по 5 баллов за вопрос.

Вопрос 3.1.

1. Взаимодействие лекарственных веществ в организме.
2. Ингибирование ферментативных реакций – общие положения. Лекарственные средства, вызывающие обратимое ингибирование.
3. Ингибирование ферментативных реакций – общие положения. Лекарственные средства, вызывающие необратимое ингибирование.

Вопрос 3.2.

1. Фармакодинамические и химиотерапевтические препараты – сходства, различия.
2. Средства, влияющие на центральную нервную систему. Средства для наркоза.
3. Обезболивающие и противовоспалительные средства. Проблема привыкания и зависимости.
4. Психотропные средства. Нейролептики, транквилизаторы, антидепрессанты.
5. Психотропные средства. Ноотропные препараты и стимуляторы ЦНС
6. Снотворные средства.
7. Средства для лечения паркинсонизма. Рвотные и противорвотные препараты.
8. Препараты для местной анестезии. Способы их применения.
9. Вещества, влияющие на холинэргические синапсы.

Вопрос 3.3.

1. Природные и синтетические кардиотонические средства
2. Антиаритмические препараты.
3. Антиангинальные средства. Органические нитраты
4. Ангиотензиновая система и средства, влияющие на нее
5. Спазмолитики и диуретики
6. Принципы воздействия на бактерии. Антибиотики.
7. Принципы воздействия на бактерии. Синтетические антибактериальные препараты.
8. Противовирусные препараты.
9. Препараты для химиотерапии рака.

Раздел 4. Примеры вопросов к контрольной работе № 3. Максимальная оценка – 15 баллов. Контрольная работа содержит 5 тестовых вопросов и 5 вопросов, в которых необходимо дать краткий и емкий ответ, тестовые вопросы оцениваются по 1 баллу за вопрос, другие – по 2 балла за вопрос

Вопрос 4.1.

| Отметьте верно или неверно утверждение. Утверждение, неверное частично, считать неверным полностью. | | Верно | Неверно |
|--|---|--------------|----------------|
| 1 | Химические превращения лекарства зависят от способа введения его в организм | | |
| 2 | Клинические исследования проводятся исключительно с привлечением добровольцев, по демографическим данным наиболее близких к потенциальным потребителям исследуемого лекарства | | |
| 3 | Регуляторные центры ферментов могут являться мишенями при разработке лекарств, активные центры – не могут | | |

| | | | |
|----|---|--|--|
| 4 | Необратимые ингибиторы не используются в качестве лекарственных средств | | |
| 5 | Источником стероидных гормонов является гипоталамус, но не гипофиз | | |
| 6 | Любой ксенобиотик, попавший в организм, подвергается химическим превращениям | | |
| 7 | Наибольшее число химических синапсов в человеческом организме являются холинэргическими | | |
| 8 | Заряженные частицы способны проникать внутрь клетки | | |
| 9 | Скорость и продолжительность физиологического ответа клетки на воздействие нейромедиатора зависят от типа рецептора | | |
| 10 | Гормоны могут воздействовать на нейромедиаторные рецепторы | | |

В вопросах укажите верный ответ (или ответы)

11) К межмолекулярным взаимодействиям относятся:

- А. ион-дипольные взаимодействия
- Б. диполь-дипольные взаимодействия
- В. силы Ван-дер-Ваальса
- Г. водородные связи
- Д. ион-ионные взаимодействия
- Е. π -стэкинг

12) Обязательными компонентами клеточной мембраны являются:

- А. Митохондрии
- Б. ДНК
- В. РНК
- Г. Стероидные соединения
- Д. Ксенобиотики
- Е. Белки

13) Вещества, не воздействующие (напрямую) на постсинаптические рецепторы:

- А. Диоксин
- Б. Никотин
- В. Адреналин
- Г. Норадреналин
- Д. Инсулин
- Е. Гамма-аминомасляная кислота

Вопрос 4.2.

В вопросах дайте краткий ответ

1. Исследование ингибитора *in vitro* подтверждает необратимость ингибирования определенного фермента, но при исследовании того же вещества на лабораторных животных активность этого фермента через некоторое время восстановилась. Дайте объяснение.
2. За счёт какого механизма прохождения вещества сквозь мембрану в клетках щитовидной железы накапливается йод? Дайте объяснение.
3. Опишите принцип воздействия обратного агониста на рецептор.
4. Укажите, каким образом можно повлиять на передачу сигнала возбуждения в химическом синапсе (Перечислите принципиальные подходы)
5. Укажите условия подобия лекарству («правило пяти»). Приведите обоснования.
6. Опишите сходства и различия метаботропных и ионотропных рецепторов.
7. Укажите, к каким группам препаратов относится *амоксциллин*, согласно различным способам классификации лекарственных средств.
8. Какова причина синергического действия триметоприма и сульфамидных

- препаратов?
9. Приведите требования, предъявляемые к снотворным средствам.
 10. В чем различие механизмов действия антидепрессантов первого поколения (ипрониазид) и трициклических антидепрессантов (дезипрамин).
 11. Почему, несмотря на миорелаксирующее действие препаратов для общего наркоза, на практике применяются специальные миорелаксанты?
 12. Перечислите способы применения средств для местной анестезии.
 13. Природные кардиотонические средства – источник, строение, применение, недостатки.
 14. Почему наличие фосфатной группы в противогепатитном препарате софосбувир (Совалди) увеличивает его эффективность?
 15. Опишите возможные подходы к проблеме борьбы с возникновением у бактерий резистентности к антибактериальным препаратам.

8.3. Вопросы для итогового контроля освоения дисциплины (3 семестр – экзамен)

Экзаменационный билет включает контрольные вопросы по всем разделам рабочей программы дисциплины и содержит 2 вопроса по 20 баллов.

1. Медицинская химия – предмет, история развития. Фармакокинетика – определение, общие положения.
2. Взаимосвязь между структурой органического вещества и биологической активностью. Условия подобия лекарству (Правила Липински). Значение оптической активности молекул.
3. Основные процессы, происходящие с веществами в организме (ADME) – общая характеристика.
4. Строение биологических мембран. Пути проникновения химических веществ через мембраны.
5. Метаболизм лекарственных веществ. Пролекарства.
6. Распространение и передача нервного импульса. Нейромедиаторы. Способы влияния на передачу и распространение нервного импульса.
7. Фармакодинамика – определение, предмет. Рецепторы. Биохимические мишени для лекарственных средств. Связывание лекарства с мишенью.
8. Мишени для разработки лекарственных средств. Виды рецепторов – сходства и различия.
9. Агонисты и антагонисты. Различия, сходства, примеры.
10. Холинорецепторы. Способы влияния на передачу нервного импульса.
11. Адренорецепторы. Способы влияния на передачу нервного импульса.
12. ГАМК-рецепторный комплекс. Способы влияния на передачу нервного импульса.
13. Гормоны, их роль в организме. Типы гормонов.
14. Взаимодействие лекарственных веществ в организме.
15. Ингибирование ферментативных реакций – общие положения.
16. Лекарственные средства, вызывающие обратимое ингибирование.
17. Ингибирование ферментативных реакций – общие положения.
18. Лекарственные средства, вызывающие необратимое ингибирование.
19. Фармакодинамические и химиотерапевтические препараты – сходства, различия.
20. Средства, влияющие на центральную нервную систему. Средства для наркоза.
21. Обезболивающие и противовоспалительные средства. Проблема привыкания и зависимости.
22. Психотропные средства. Нейролептики, транквилизаторы, антидепрессанты.
23. Психотропные средства. Ноотропные препараты и стимуляторы ЦНС.
24. Снотворные средства.

25. Средства для лечения паркинсонизма. Рвотные и противорвотные препараты.
26. Препараты для местной анестезии. Способы их применения.
27. Вещества, влияющие на холинэргические синапсы.
28. Природные и синтетические кардиотонические средства.
29. Антиаритмические препараты.
30. Антиангинальные средства. Органические нитраты.
31. Ангиотензиновая система и средства, влияющие на нее.
32. Спазмолитики и диуретики.
33. Принципы воздействия на бактерии. Антибиотики.
34. Принципы воздействия на бактерии. Синтетические антибактериальные препараты.
35. Противовирусные препараты.
36. Препараты для химиотерапии рака.

Фонд оценочных средств приведен в виде отдельного документа, являющегося неотъемлемой частью основной образовательной программы.

8.4. Структура и примеры билетов для экзамена

Экзамен по дисциплине «Медицинская химия. Основы фармакологии» проводится в 3 семестре и включает контрольные вопросы по всем разделам рабочей программы дисциплины. Билет для экзамена состоит из 2-х вопросов, относящихся к указанным разделам.

Пример билета для экзамена:

| | |
|--|---|
| <p>«Утверждаю»</p> <p>_____ А.У. Абдурахимова</p> <p>«__» _____ 20__ г.</p> | <p>Министерство науки и высшего образования РФ</p> |
| | <p>Филиал РХТУ им. Д.И. Менделеева в г. Ташкенте</p> <p>(Республика Узбекистан)</p> |
| | <p>18.04.01 Химическая технология</p> <p>Магистерская программа – «Химическая технология биологически активных веществ»</p> |
| | <p>«Медицинская химия. Основы фармакологии»</p> |
| <p>Билет № 1</p> | |
| <p>1. Фармакодинамика – определение, предмет. Рецепторы. Биохимические мишени для лекарственных средств. Связывание лекарства с мишенью.</p> | |
| <p>2. Природные и синтетические кардиотонические средства.</p> | |

9. УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

9.1. Рекомендуемая литература.

А. Основная литература

1. Коваленко Л.В., Попков С.В. Психоактивные соединения. Химия и биологическая активность: Учебное пособие - М.: Издательство РХТУ, 2012. - 124 с.
2. Попков С.В., Кузенков А.В., Бурдейный М.Л., Захарычев В.В., Дашкин Р.Р., Шарипов М.Ю., Ярёмченко И.А. Получение синтетических биологически активных веществ и промежуточных продуктов: учебн. пособие Лабораторный практикум. – М.:

РХТУ им. Д.И. Менделеева, 2017. – 144 с.

3. Граник В.Г. Основы медицинской химии. М: Вузовская книга, 2001. – 384 с. (Базовый учебник).

Б. Дополнительная литература

1. Солдатенков, А. Т. Основы органической химии лекарственных веществ [Текст] / А.Т. Солдатенков, Н.М. Колядина, И.В. Шендрик. - М.: Химия, 2001. - 192 с.

2. Люльман Х., Мор К., Хайн Л. Наглядная фармакология / Пер. с нем. - М.: Мир, 2008. – 383 с.

3. Коваленко, Л. В. Биохимические основы химии биологически активных веществ - М.: БИНОМ. Лаборатория знаний, 2014. - 229 с.

4. Эллиот, В. Биохимия и молекулярная биология. М.: МАИК «Наука-Интерпериодика», 2002. – 237 с. (Базовый учебник).

9.2. Рекомендуемые источники научно-технической информации

- «Journal of medicinal chemistry», ISSN: 0022-2623
- «Medicinal chemistry», ISSN: 1875-6638
- «Известия РАН, серия химическая», ISSN: 0002-3353
- «Успехи химии», ISSN: 0042-1308
- «Tetrahedron», ISSN: 0040-4020
- «Tetrahedron Letters», ISSN: 0040-4039
- «Journal of Organic Chemistry», ISSN: 0022-3263
- «Journal of the American Chemistry Society», ISSN: 0002-7863
- «European Journal of Organic Chemistry», ISSN: 1099-069

10. ПЕРЕЧЕНЬ ИНФОРМАЦИОННЫХ ТЕХНОЛОГИЙ, ИСПОЛЬЗУЕМЫХ В ОБРАЗОВАТЕЛЬНОМ ПРОЦЕССЕ

Информационную поддержку изучения дисциплины осуществляет Информационно-библиотечный центр (ИБЦ) РХТУ им. Д.И. Менделеева, который обеспечивает обучающихся основной учебной, учебно-методической и научной литературой, необходимой для организации образовательного процесса по дисциплине. Общий объем многоотраслевого фонда ИБЦ на 01.01.2024 составляет 1 559 436 экз.

Фонд ИБЦ располагает учебной, учебно-методической и научно-технической литературой в форме печатных и электронных изданий, а также включает официальные, справочно-библиографические, специализированные отечественные и зарубежные периодические и информационные издания. ИБЦ обеспечивает доступ к профессиональным базам данных, информационным, справочным и поисковым системам.

Каждый обучающийся обеспечен свободным доступом из любой точки, в которой имеется доступ к сети Интернет и к электронно-библиотечной системе (ЭБС) Университета, которая содержит различные издания по основным изучаемым дисциплинам и сформирована по согласованию с правообладателями учебной и учебно-методической литературы.

Для более полного и оперативного справочно-библиографического и информационного обслуживания в ИБЦ реализована технология Электронной доставки документов.

Полный перечень электронных информационных ресурсов, используемых в процессе обучения, представлен в основной образовательной программе.

10. МАТЕРИАЛЬНО-ТЕХНИЧЕСКОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

В соответствии с учебным планом занятия по дисциплине «Медицинская химия. Основы фармакологии» проводятся в форме лекций, практических занятий и самостоятельной работы обучающегося.

11.1. Оборудование, необходимое в образовательном процессе:

Лекционная учебная аудитория, оборудованная электронными средствами демонстрации (компьютер со средствами звуковоспроизведения, проектор, экран) и учебной мебелью.

11.2. Учебно-наглядные пособия:

Иллюстрации к разделам лекционного курса и практическим занятиям; графики и таблицы, иллюстрирующие лекционный материал.

11.3. Компьютеры, информационно-телекоммуникационные сети, аппаратно-программные и аудиовизуальные средства:

Персональные компьютеры в аудитории для самостоятельной подготовки обучающихся, укомплектованные принтерами и программными средствами; проекторы и экраны; цифровые камеры; копировальные аппараты; локальная сеть с выходом в Интернет.

11.4. Печатные и электронные образовательные и информационные ресурсы:

Электронные образовательные ресурсы: электронные презентации к разделам лекционного курса; учебно-методические разработки в электронном виде.

11.5. Перечень лицензионного программного обеспечения:

| № п/п | Наименование программного продукта | Реквизиты договора поставки | Примечание | Срок окончания действия лицензии |
|-------|---|--|--|--|
| 1. | Microsoft Office Standard 2013 | Контракт № 62-64ЭА/2013 от 02.12.2013 | Лицензия на ПО, принимающее участие в образовательных процессах. | Бессрочная |
| 2. | Microsoft Office Professional Plus 2019 В составе: Word, Excel, Power Point, Outlook, OneNote, Access, Publisher, InfoPath | Контракт № 28-35ЭА/2020 от 26.05.2020 | Лицензия на ПО, принимающее участие в образовательных процессах. | 12 месяцев (ежегодное продление подписки с правом перехода на обновлённую версию продукта) |
| 3. | Kaspersky Endpoint Security для бизнеса – Стандартный Russian Edition. | Контракт № 90-133ЭА/2021 от 07.09.2021 | Лицензия на ПО, не принимающее прямого участия в образовательных процессах (инфраструктурное/вспомогательное ПО) | 12 месяцев (ежегодное продление подписки с правом перехода на обновлённую версию продукта) |
| 4. | Антиплагиат.ВУЗ 5.0 | Контракт № 13-143К/2025 от 30.04.2025 | не ограничено, лимит проверок | 19.05.2026 |

12. ТРЕБОВАНИЯ К ОЦЕНКЕ КАЧЕСТВА ОСВОЕНИЯ ПРОГРАММЫ

| Наименование разделов | Основные показатели оценки | Формы и методы контроля и оценки |
|--|--|---|
| Раздел 1. Общая фармакология | <p><i>Знает:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - основные понятия фармакокинетики (введение ЛС, всасывание, распределение, депонирование, метаболизм, выведение); - основные фармакологические эффекты, понятия метаболит, антиметаболит, определение «рецептор», типы рецепторов и т.д. <p><i>Умеет:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - работать со специальной литературой: регистром лекарственных средств, Государственной Фармакопеей РФ. <p><i>Владеет:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - теоретическими знаниями в области синтеза и анализа фармакологически активных веществ. | <p>Оценка за контрольную работу №1</p> <p>Оценка за экзамен</p> |
| Раздел 2. Разработка лекарственных средств | <p><i>Знает:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - основные подходы для синтеза антиметаболитов <p><i>Умеет:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - работать со специальной литературой: регистром лекарственных средств, Государственной Фармакопеей РФ. <p><i>Владеет:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - теоретическими знаниями в области синтеза и анализа фармакологически активных веществ. | <p>Оценка за реферат</p> <p>Оценка за экзамен</p> |
| Раздел 3. Отдельные классы лекарственных средств | <p><i>Знает:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - классификацию лекарственных препаратов; - основные подходы для синтеза антиметаболитов; <p><i>Умеет:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - работать со специальной литературой: регистром лекарственных средств, Государственной Фармакопеей РФ. <p><i>Владеет:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - теоретическими знаниями в области синтеза и анализа фармакологически активных веществ. | <p>Оценка за контрольную работу №2</p> <p>Оценка за экзамен</p> |
| Раздел 4. Избранные вопросы современной медицинской химии | <p><i>Знает:</i></p> <ul style="list-style-type: none"> - классификацию лекарственных препаратов; - основные понятия фармакокинетики (введение ЛС, всасывание, распределение, депонирование, метаболизм, выведение); - основные фармакологические эффекты, понятия метаболит, | <p>Оценка за контрольную работу №3</p> <p>Оценка за экзамен</p> |

| | | |
|--|--|--|
| | <p>антиметаболит, определение «рецептор», типы рецепторов и т.д.</p> <p>- основные подходы для синтеза антиметаболитов;</p> <p><i>Умеет:</i></p> <p>- работать со специальной литературой: регистром лекарственных средств, Государственной Фармакопеей РФ.</p> <p><i>Владеет:</i></p> <p>- теоретическими знаниями в области синтеза и анализа фармакологически активных веществ.</p> | |
|--|--|--|

13. ОСОБЕННОСТИ ОРГАНИЗАЦИИ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОГО ПРОЦЕССА ДЛЯ ИНВАЛИДОВ И ЛИЦ С ОГРАНИЧЕННЫМИ ВОЗМОЖНОСТЯМИ ЗДОРОВЬЯ

Обучение инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья осуществляется в соответствии с:

– Порядком организации и осуществления образовательной деятельности по образовательным программам – программам бакалавриата, программам специалитета, программам магистратуры (Приказ Министерства науки и высшего образования Российской Федерации от 06.04.2021 № 245);

– Положением о порядке организации и осуществления образовательной деятельности по образовательным программам высшего образования – программам бакалавриата, программам специалитета, программам магистратуры федерального государственного бюджетного образовательного учреждения высшего образования «Российский химико-технологический университет имени Д.И. Менделеева», принятым решением Ученого совета РХТУ им. Д.И. Менделеева от 28.12.2022, протокол № 5;

– Методическими рекомендациями по организации образовательного процесса для обучения инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья в образовательных организациях высшего образования, в том числе оснащенности образовательного процесса (утверждены заместителем Министра образования и науки РФ А.А. Климовым от 08.04.2014 № АК-44/05вн).

**Дополнения и изменения к рабочей программе дисциплины
«Медицинская химия. Основы фармакологии»**

**основной образовательной программы
по направлению подготовки 18.04.01 Химическая технология,
магистерская программа – «Химическая технология биологически активных
веществ»**

Форма обучения: **очная**

| Номер изменения/ дополнения | Содержание дополнения/изменения | Основание внесения изменения/дополнения |
|-----------------------------------|---------------------------------|--|
| 1. | | протокол заседания Ученого совета № _____ от «___» _____ 20__ г. |
| | | протокол заседания Ученого совета № _____ от «___» _____ 20__ г. |
| | | протокол заседания Ученого совета № _____ от «___» _____ 20__ г. |
| | | протокол заседания Ученого совета № _____ от «___» _____ 20__ г. |
| | | протокол заседания Ученого совета № _____ от «___» _____ 20__ г. |



РХТУ им. Д.И. Менделеева
ДОКУМЕНТ ПОДПИСАН ПРОСТОЙ
ЭЛЕКТРОННОЙ ПОДПИСЬЮ

Владелец: Макаров Николай Александрович
И.о. директора, Филiaal РХТУ
им. Д.И. Менделеева в г.
Ташкенте (Республика
Узбекистан)

Подписан: 04:02:2026 11:56:35