

федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение  
высшего образования  
«Тольяттинский государственный университет»

Б1.В.ДВ.05.01  
Б1.В.ДВ.06.02  
(индекс дисциплины)

## РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ

Медицинская химия 1, 2  
(наименование дисциплины)

по направлению подготовки (специальности)  
04.03.01 Химия

(код и наименование направления подготовки, специальности в соответствии с ФГОС ВПО/ ФГОС ВО)

Медицинская и фармацевтическая химия  
(направленность (профиль)/специализация)

Форма обучения: очная

Год набора: 2017

### Распределение часов дисциплины по семестрам и видам занятий (по учебному плану)

Количество ЗЕТ	18											
Часов по РУП	648											
Виды контроля в семестрах:	Экзамены			Зачеты			Курсовые проекты		Курсовые работы		Контрольные работы (для заочной формы обучения)	
	7,8								7,8			
	№№ семестров											
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	Итого
ЗЕТ по семестрам							7	11				18
Лекции							50	60				110
Лабораторные							-	60				60
Практические							50	36				86
Контактная работа							100	156				256
Сам. работа							116	204				320
Контроль							36	36				72
Итого							252	396				648

Тольятти, 2017

Рабочая программа составлена на основании ФГОС ВПО/ФГОС ВО и учебного плана направления подготовки (специальности) 04.03.01 Химия

*(код и наименование направления подготовки, специальности в соответствии с ФГОС ВПО/ ФГОС ВО)*

**Рецензирование рабочей программы дисциплины:**

☒

Отсутствует

☒

Учебная (рабочая) программа одобрена на заседании кафедры «Химия, химические процессы и технологии» (протокол заседания № 7 от 02 февраля 2017 г.).

☐

Рецензент

\_\_\_\_\_  
*(должность, ученое звание, степень)*

«\_\_» \_\_\_\_\_ 20\_\_ г.

\_\_\_\_\_  
*(подпись)*

\_\_\_\_\_  
*(И.О. Фамилия)*

**Срок действия рабочей программы дисциплины до 02 февраля 2021 г.**

**Информация об актуализации рабочей программы дисциплины:**

Протокол заседания кафедры № \_\_\_\_ от «\_\_» \_\_\_\_\_ 20\_\_ г.

Протокол заседания кафедры № \_\_\_\_ от «\_\_» \_\_\_\_\_ 20\_\_ г.

Протокол заседания кафедры № \_\_\_\_ от «\_\_» \_\_\_\_\_ 20\_\_ г.

Протокол заседания кафедры № \_\_\_\_ от «\_\_» \_\_\_\_\_ 20\_\_ г.

**УТВЕРЖДАЮ**

Заведующий кафедрой «Химия, химические процессы и технологии»

*(разработавшей РПД)*

«\_\_» \_\_\_\_\_ 20\_\_ г.

\_\_\_\_\_  
*(подпись)*

Г.И. Остапенко

*(И.О. Фамилия)*

**АННОТАЦИЯ**  
**дисциплины (учебного курса)**  
**Б1.В.ДВ.05.01 Медицинская химия 1**  
**Б1.В.ДВ.06.01 Медицинская химия 2**  

---

(индекс и наименование дисциплины (учебного курса))

**1. Цель и задачи изучения дисциплины (учебного курса)**

Цель – сформировать фундаментальные представления о современных подходах к конструированию новых физиологически активных веществ и лекарственных препаратов.

Задачи:

1. Заложить основные представления о биологических мишенях.
2. Сформировать базовые знания в области фармакологии и токсикологии.
3. Освоить современный аппарат QSAR-моделирования (Количественное соотношение структура-свойства).
4. Сформировать базовые навыки компьютерного моделирования и конструирования лекарственных препаратов.
5. Освоить основные методы химической модификации структуры лидирующего соединения.
6. Заложить базовые знания о дизайне лекарственных средств на примере различных классов физиологически активных соединений.

**2. Место дисциплины (учебного курса) в структуре ОПОП ВО**

Данная дисциплина (учебный курс) относится Блоку 1 «Дисциплины (модули)» (вариативная часть, дисциплины по выбору).

Дисциплины, учебные курсы, на освоении которых базируется данная дисциплина (учебный курс) – «Общая и неорганическая химия», «Органическая химия», «Физическая химия», «Химия гетероциклических соединений», «Специальный лабораторный практикум по органической химии», «Биохимия», «Микробиология», «Химия биологически активных соединений».

Дисциплины, учебные курсы, для которых необходимы знания, умения, навыки, приобретаемые в результате изучения данной дисциплины (учебного курса) – «Подготовка к процедуре защиты и процедура защиты ВКР».

**3. Планируемые результаты обучения по дисциплине (учебному курсу), соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы**

<b>Формируемые и контролируемые компетенции</b>	<b>Планируемые результаты обучения</b>
<p>способность использовать полученные знания теоретических основ фундаментальных разделов химии при решении профессиональных задач (ОПК-1)</p>	<p>Знать: основные подходы молекулярного моделирования и конструирования лекарственных препаратов, их классификацию, и основные сферы применения.</p>
	<p>Уметь: используя знания в области органического синтеза планировать и осуществлять сложные многостадийные синтетические схемы получения фармакологически активных соединений.</p>
	<p>Владеть: основными методологическими подходами, базирующимися на понимании основных количественных соотношений структура-свойство, а также о строении биологической мишени, для конструирования лекарственных препаратов.</p>
<p>владеть системой фундаментальных химических понятий (ПК-3)</p>	<p>Знать: основные фундаментальные химические законы, лежащие в основе биохимических, биофизических процессов и фармакологических свойствах физиологически активных соединений</p>
	<p>Уметь: использовать основные фундаментальные химические законы, лежащие в основе биохимических, биофизических процессов и фармакологических свойствах физиологически активных соединений</p>
	<p>Владеть: основными теоретическими (компьютерное моделирование, математическое моделирование равновесных процессов химических и биохимических процессов), и практическими методами (навыки многостадийного органического синтеза, элементарные биохимические и фармакологические испытания, физико-химические методы анализа).</p>
<p>способность применять основные естественнонаучные законы и</p>	<p>Знать: основные фундаментальные химические законы, лежащие в основе биохимических, биофизических процессов и фармакологических свойствах</p>

закономерности развития химической науки при анализе полученных результатов (ПК-4)	физиологически активных соединений
	Уметь: использовать основные фундаментальные химические законы, лежащие в основе биохимических, биофизических процессов и фармакологических свойствах физиологически активных соединений
	Владеть: основными теоретическими (компьютерное моделирование, математическое моделирование равновесных процессов химических и биохимических процессов), и практическими методами (навыки многостадийного органического синтеза, элементарные биохимические и фармакологические испытания, физико-химические методы анализа).

### Тематическое содержание дисциплины (учебного курса)

Раздел, модуль	Подраздел, тема
Лекарства и мишени лекарств	Что такое лекарство?
	Мишени лекарств
	Межмолекулярные взаимодействия
	Проблемы фармакокинетики и лекарственных соединений
	Классификация лекарственных средств
Биомишени	Белки: структура и свойства
	Ферменты: структура и свойства
	Рецепторы: структура и свойства
	Рецепторы и сигнальная трансдукция
	Нуклеиновые кислоты: структура и свойства
Фармакодинамика и фармакокинетика	Ферменты в качестве мишеней лекарственных средств
	Рецепторы в качестве мишеней лекарственных средств
	Нуклеиновые кислоты в качестве мишеней лекарственных средств
	Прочие мишени лекарственных средств
	Фармакокинетика
Поиск, дизайн и разработка лекарственных средств	Открытие лекарств: поиск лидера
	Дизайн лекарств: оптимизация взаимодействий с биологической мишенью
	Дизайн лекарств: оптимизация доступности для биологической мишени
	Вывод лекарственного средства на рынок
Методы медицинской химии для поиска и разработки новых лекарственных средств	Комбинаторный и параллельный синтез
	Компьютерная медицинская химия
	Количественный взаимодействия структура-свойство

**Общая трудоемкость дисциплины (учебного курса) – 18 ЗЕТ.**

#### 4. Структура и содержание дисциплины (учебного курса) Медицинская химия 1, 2

(наименование дисциплины (учебного курса))

Семестр изучения 7, 8

Раздел, модуль	Подраздел, тема	Виды учебной работы							Необходимые материально- технические ресурсы	Формы текущего контроля (наимено- вание оце- ночного средства)	Рекоменду- емая лите- ратура (№)
		Контактная работа (в часах)					Самостоятельная работа				
		всего			в т.ч. в интерак- тивной форме	Формы проведения лекций, лабораторных, практических занятий, методы обучения, реализующие применяемую образовательную технологию	в часах	формы организации самостоятельной работы			
		лекций	лабораторных	практических							
Медицинская химия 1											
Лекарства и мишени лекарств	Что такое лекарство?	2	-	2		традиционная	6	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям	мультимедийный проек- тор, ноутбук, раздаточ- ный материал	Контроль- ная работа	1-6
	Мишени лекарств	2	-	4		традиционная	6	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям			1-6
	Межмолекулярные взаимодействия	2	-	2		традиционная	8	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям			1-6
	Проблемы фармако- кинетики и лекар- ственные соединения	2	-	4		традиционная	8	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям			1-6
	Классификация лекар- ственных средств	2	-	2		традиционная	8	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям			1-6
Биомишени	Белки: структура и свойства	2	-	4		традиционная	6	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям	мультимедийный проек- тор, ноутбук, раздаточ- ный материал	Контроль- ная работа	1-6
	Ферменты: структура и свойства	4	-	4		традиционная	6	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям			1-6
	Рецепторы: структура и свойства	4	-	4		традиционная	6	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям			1-6
	Рецепторы и сигналь- ная трансдукция	4	-	4		традиционная	6	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям			1-6
	Нуклеиновые кисло- ты: структура и свой- ства	4	-	2		традиционная	6	работа с учебной литера- турой, подготовка к практическим занятиям			1-6
Фармакодинамика и фармакокинети-	Ферменты в качестве мишеней лекарствен-	4	-	4		традиционная	6	работа с учебной литера- турой, подготовка к	мультимедийный проек- тор, ноутбук, раздаточ-	Контроль- ная работа	1-6

ка	ных средств							практическим занятиям	ный материал		
	Рецепторы в качестве мишеней лекарственных средств	4	-	4		традиционная	6	работа с учебной литературой, подготовка к практическим занятиям			1-6
	Нуклеиновые кислоты в качестве мишеней лекарственных средств	4	-	4		традиционная	6	работа с учебной литературой, подготовка к практическим занятиям			1-6
	Прочие мишени лекарственных средств	4	-	2		традиционная	6	работа с учебной литературой, подготовка к практическим занятиям			1-6
	Фармакокинетика	6	-	4		традиционная	6	работа с учебной литературой, подготовка к практическим занятиям			1-6
Курсовая работа						20	работа с учебной литературой, выполнение курсовой работы			1-6	
	Подготовка к экзамену						36				
	Итого по 7 семестру:	50		50			152				
		100									
		252									
Медицинская химия 2											
Поиск, дизайн и разработка лекарственных средств	Открытие лекарств: поиск лидера	6	2	4		традиционная	16	работа с учебной литературой, подготовка к практическим и лабораторным занятиям	мультимедийный проектор, ноутбук, раздаточный материал	Контрольная работа	1-6
	Дизайн лекарств: оптимизация взаимодействий с биологической мишенью	6	2	4		традиционная	16	работа с учебной литературой, подготовка к практическим и лабораторным занятиям			1-6
	Дизайн лекарств: оптимизация доступности для биологической мишени	6	2	4		традиционная	16	работа с учебной литературой, подготовка к практическим и лабораторным занятиям			1-6
	Вывод лекарственного средства на рынок	8	2	4		традиционная	11	работа с учебной литературой, подготовка к практическим и лабораторным занятиям			1-6
	Открытие лекарств: поиск лидера	8	2	4		традиционная	12	работа с учебной литературой, подготовка к практическим и лабораторным занятиям			1-6
Методы медицинской химии для поиска и разработки новых лекарственных средств	Комбинаторный и параллельный синтез	8	10	4		традиционная	11	работа с учебной литературой, подготовка к практическим и лабораторным занятиям	мультимедийный проектор, ноутбук, раздаточный материал	Контрольная работа	1-6
	Компьютерная медицинская химия	8	30	8		традиционная	11	работа с учебной литературой, подготовка к			1-6

								практическим и лабораторным занятиям			
	Количественный взаимодействия структура-свойство	10	10	4		традиционная	11	работа с учебной литературой, подготовка к практическим и лабораторным занятиям			1-6
Курсовая работа							20	работа с учебной литературой, выполнение курсовой работы			1-6
	Подготовка к экзамену						36				
	Итого по 8 семестру:	60	60	36			240				
		156									
		396									



## 5. Критерии и нормы текущего контроля и промежуточной аттестации

Формы текущего контроля	Условия допуска	Критерии и нормы оценки
Контрольная работа	К первой контрольной работе в семестре допускаются все студенты. К последующей контрольной работе, студент допускается только при условии выполнения им не менее половины заданий из предыдущей контрольной работы.	Каждая контрольная работа состоит из 4-8 заданий. Каждое задание оценивается в 4 балла. Контрольная работа считается успешно выполненной, если студент набирает не менее 10 баллов.

Форма проведения промежуточной аттестации	Условия допуска	Критерии и нормы оценки	
Экзамен (устно)	Выполнение всех контрольных работ текущего контроля не менее чем на 70%	«отлично»	Полные и четкие ответы на вопросы экзаменационного билета; Правильные ответы на дополнительные вопросы по лекционному курсу
		«хорошо»	Достаточно полные ответы на вопросы теоретического характера экзаменационного билета, однако при детализации некоторых ответов испытывает затруднения; Нечетко отвечает на дополнительные вопросы, проявляя при этом неглубокие знания
		«удовлетворительно»	Показывает неполные или неглубокие знания при ответе на теоретические вопросы,

			При ответе на дополнительные вопросы испытывает серьезные затруднения
		«неудовлетворительно»	Не отвечает на вопросы теоретического характера или отвечает неправильно, неполно; Не отвечает или неправильно отвечает на дополнительные вопросы

## 6. Критерии и нормы оценки курсовых работ (проектов)

Оценки	Критерии и нормы оценки
«отлично»	<p>1. Исследование выполнено самостоятельно, имеет научно-практический характер, содержит элементы новизны.</p> <p>2. Студент показал знание теоретического материала по рассматриваемой проблеме, умение анализировать, аргументировать свою точку зрения, делать обобщение и выводы.</p> <p>3. Материал излагается грамотно, логично, последовательно.</p> <p>4. Оформление отвечает требованиям написания курсовой работы.</p> <p>5. Во время защиты студент показал умение кратко, доступно (ясно) представить результаты исследования, адекватно ответить на поставленные вопросы.</p>
«хорошо»	<p>1. Исследование выполнено самостоятельно, имеет научно-практический характер, содержит элементы новизны.</p> <p>2. Студент показал знание теоретического материала по рассматриваемой проблеме, однако умение анализировать, аргументировать свою точку зрения, делать обобщения и выводы вызывают у него затруднения.</p> <p>3. Материал не всегда излагается логично, последовательно.</p> <p>4. Имеются недочеты в оформлении курсовой работы.</p> <p>5. Во время защиты студент показал умение кратко, доступно (ясно) представить результаты исследования, однако затруднялся отвечать на поставленные вопросы.</p>
«удовлетворительно»	<p>1. Исследование не содержит элементы новизны.</p> <p>2. Студент не в полной мере владеет теоретическим материалом по рассматриваемой проблеме, умение анализировать, аргументировать свою точку зрения, делать обобщение и выводы вызывают у него затруднения.</p> <p>3. Материал не всегда излагается логично, последовательно.</p> <p>4. Имеются недочеты в оформлении курсовой работы.</p> <p>5. Во время защиты студент затрудняется в пред-</p>

	ставлении результатов исследования и ответах на поставленные вопросы.
«неудовлетворительно»	Выполнено менее 50% требований к курсовой работе (смотрите оценку «отлично») и студент не допущен к защите курсовой работы.

## 7. Примерная тематика письменных работ (курсовых, рефератов, контрольных, расчетно-графических и др.)

№ п/п	Темы
1.	Анализ межмолекулярных взаимодействий в комплексах белок-лиганд (на примере ингибиторов EGFR)
2.	Комбинаторный синтез малой библиотеки (на примере тиомочевин и тиазол-2-аминов)
3.	Высокопроизводительный молекулярный докинг коммерческих комбинаторных библиотек (на примере библиотек ENAMINE, ChemDiv, ХИМРАР)
4.	Оптимизация структуры лиганда ингибитора EGFR-киназы
5.	Построение и валидация фармакоформной модели ингибиторов EGFR

## 8. Вопросы к экзамену (зачету)

№ п/п	Вопросы
<b>Медицинская химия 1</b>	
1.	Что такое лекарство? История и основные вехи развития медицинской химии.
2.	Классификация лекарственных средств.
3.	Основные межмолекулярные взаимодействия.
4.	Белки структура и свойства. Первичная, вторичная, третичная и четвертичная структура белка.
5.	Белки: структура и свойства. Трансляция и пост-трансляционная модификация.
6.	Белки: структура и свойства. Протеомика.
7.	Ферменты: структура и свойства. Ферменты как катализаторы.
8.	Ферменты: структура и свойства. Кинетика ферментативных реакций.
9.	Ферменты: структура и свойства. Активный сайт ферментов (каталитический центр).
10.	Ферменты: структура и свойства. Связывание субстрата в активный сайт связывания.
11.	Ферменты: структура и свойства. Регуляция ферментов.
12.	Ферменты: структура и свойства. Изоферменты.
13.	Рецепторы: структура и свойства. Роль рецепторов в организме.

14.	Рецепторы: структура и свойства. Нейротрансмиттеры и гормоны.
15.	Рецепторы: структура и свойства. Типы и субтипы рецепторов.
16.	Рецепторы: структура и свойства. Активация рецепторов.
17.	Рецепторы: структура и свойства. Рецепторы ионных каналов.
18.	Рецепторы: структура и свойства. G-белки.
19.	Рецепторы: структура и свойства. Киназные рецепторы.
20.	Рецепторы: структура и свойства. Внутриклеточные рецепторы.
21.	Рецепторы: структура и свойства. Регуляция активности рецепторов.
22.	Рецепторы: структура и свойства. Генетический полиморфизм и рецепторы.
23.	Пути передачи сигналов для рецепторов, связанных с G-белком.
24.	Передача сигналов с участием G-белков и аденилциклазы.
25.	Передача сигналов с участием G-белков и фосфолипазы C.
26.	Передача сигналов с участием киназ-связанных рецепторов.
27.	Нуклеиновые кислоты: структура и свойства. Структура ДНК.
28.	Нуклеиновые кислоты: структура и свойства. Рибонуклеиновые кислоты и синтез белка.
29.	Нуклеиновые кислоты: структура и свойства. Генетические болезни.
30.	Нуклеиновые кислоты: структура и свойства. Молекулярная биология и генетическая инженерия.
31.	Ингибиторы, действующие на активный сайт связывания ферментов.
32.	Ингибиторы, действующие на аллостерический сайт связывания.
33.	Неконкурентные и конкурентные ингибиторы.
34.	Аналоги переходного состояния: ингибиторы ренина.
35.	Суицидные субстраты.
36.	Селективность ингибирования изоферментов.
37.	Медицинское использование ингибиторов ферментов.
38.	Дизайн агонистов
39.	Дизайн антагонистов
40.	Частичные агонисты
41.	Обратимые агонисты
42.	Десенсибилизация и сенсibilизация. Толерантность и зависимость.
43.	Аффинность, эффективность и действенность.
44.	Взаимодействие лекарственных средств и ДНК. Алкилирующие агенты.
45.	Контроль генной транскрипции.
46.	Агенты, которые действуют на ДНК.
47.	Транспорт белков, как мишень действия лекарств.
48.	Структурные белки, как мишень действия лекарств.
49.	Биосинтетические строительные блоки, как мишень действия лекарств.
50.	Белок-белок взаимодействия
51.	Липиды, как мишень действия лекарств.
52.	Углеводы, как мишень действия лекарств.

52.	Фармакокинетика. Три фазы действия лекарств.
54.	Фармакокинетика. Абсорбция лекарств.
55.	Фармакокинетика. Распределение лекарств.
56.	Фармакокинетика. Метаболизм лекарств.
57.	Фармакокинетика. Экскреция лекарств.
58.	Фармакокинетика. Введение лекарств.
59.	Фармакокинетика. Доза лекарств.
60.	Фармакокинетика. Доставка лекарств.
<b>Медицинская химия 2</b>	
61.	Открытие лекарства: определение лидера. Выбор болезни.
62.	Открытие лекарства: определение лидера. Выбор биологической мишени.
63.	Открытие лекарства: определение лидера. Выбор бионализа.
64.	Открытие лекарства: определение лидера. Поиск соединения лидера.
65.	Открытие лекарства: определение лидера. Выделение и очистка.
66.	Дизайн лекарств. Оптимизация взаимодействий с биомишенью. Отношение структура-активность.
67.	Дизайн лекарств. Оптимизация взаимодействий с биомишенью. Идентификация фармакофора.
68.	Дизайн лекарств. Оптимизация взаимодействий с биомишенью. Оптимизация лидера: стратегии дизайна лекарств.
69.	Дизайн лекарств. Оптимизация доступности для биомишени. Оптимизация гидрофильных/гидрофобных свойств.
70.	Дизайн лекарств. Оптимизация доступности для биомишени. Повышение устойчивости к химической и ферментативной деградации.
71.	Дизайн лекарств. Оптимизация доступности для биомишени. Повышение устойчивости к метаболизму.
72.	Дизайн лекарств. Оптимизация доступности для биомишени. Ориентация на биомишень.
73.	Дизайн лекарств. Оптимизация доступности для биомишени. Понижение токсичности.
74.	Дизайн лекарств. Оптимизация доступности для биомишени. Пролектарства.
75.	Дизайн лекарств. Оптимизация доступности для биомишени. Лекарственные альянсы.
76.	Эндогенные соединения как лекарственные соединения
77.	Пептиды и пептидомиметики в дизайне лекарственных средств.
78.	Олигонуклеотиды как лекарства.
79.	Вывод лекарства на рынок. Доклинические и клинические испытания.
80.	Вывод лекарства на рынок. Патентование и регулирование.
81.	Вывод лекарства на рынок. Химико-технологическая разработка производства лекарства.
82.	Комбинаторной и параллельный синтез в проектах медицинской хи-

	мии.
83.	Техника твердофазного синтеза.
84.	Планирование и проектирование сложных комбинаторных библиотек.
85.	Тестирование биологической активности.
86.	Параллельный синтез.
87.	Комбинаторный синтез.
88.	Молекулярный докинг.
89.	Биологическая активность и конформационный анализ.
90.	De novo дизайн лекарств.
91.	История и разработка метода QSAR
92.	Биологические данные. Аддитивность вкладов группы
93.	Параметры и характеризующие их индексы
94.	Количественные модели. Дополненный термодинамический подход. Анализ Ганча
95.	Количественные модели. Аддитивная модель. Свободный анализ Вильсона
96.	Количественные модели. Нелинейные зависимости
97.	Статистические методы. Значимость и достоверность QSAR уравнений регрессии
98.	Конструкция серии испытаний в QSAR
99.	Применение Анализа Ганча. Ингибиторы ферментов. Фармакокинетические данные.
100.	Применение свободного анализа Вильсона и прочих моделей.
101.	3D-QSAR. Стереохимия и действие лекарственного вещества
102.	3D-QSAR. Модель активного сайта связывания
103.	3D-QSAR. Метод сравнительного анализа молекулярных полей
104.	3D-QSAR. Метод сравнительного анализа индексов молекулярного подобия
105.	3D-QSAR основанный на рецепторе

## 9. Фонд оценочных средств для проведения промежуточной аттестации обучающихся по дисциплине

### 9.1. Паспорт фонда оценочных средств

№ п/п	Контролируемые разделы (темы) дисциплины	Код контролируемой компетенции (или ее части)	Наименование оценочного средства
1	Лекарства и мишени лекарств	ОПК-1, ПК- 3, ПК-4	Контрольная работа
2	Биомишени	ОПК-1, ПК-3, ПК-4	Контрольная работа
3	Фармакодинамика и фармакокинетика	ОПК-1, ПК-3, ПК-4	Контрольная работа

4	Поиск, дизайн и разработка лекарственных средств	ОПК-1, ПК-3, ПК-4	Контрольная работа
5	Методы медицинской химии для поиска и разработки новых лекарственных средств	ОПК-1, ПК-3, ПК-4	Контрольная работа

## **9.2. Типовые контрольные задания или иные материалы, необходимые для оценки знаний, умений, навыков и (или) опыта деятельности, характеризующих этапы формирования компетенций в процессе освоения образовательной программы**

### **9.2.1. Комплект заданий для контрольной работы**

#### **Контрольная работа**

1. Приведите основные постулаты концепции свободных рецепторов.
2. Каковы недостатки теории Стефенсена? В чем сущность теории Патона и её превосходство над теорией рецепции Стефенсена?
3. Поясните сущность аллостерической теории рецепции.
4. Данный постулат «величина ответа на действие ЛВ определяется не оккупацией всех рецепторов, а зависит от концентрации активных рецепторов, способных стимулировать эффектор» принадлежит какой теории?
5. Что характеризует макроскопическая константа в теории связывания гибких полифункциональных лигандов со специфическими субучастками рецепторов?
6. Опишите сущность теории рецепции Аренса.

#### **Контрольная работа**

1. Дайте определения для следующих понятий:

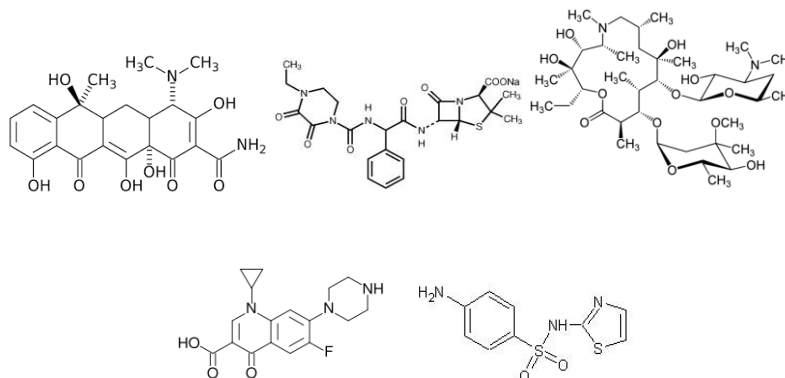
- ✓ Фармакокинетика
- ✓ Фармакодинамика
- ✓ Объем распределения
- ✓ Элиминация
- ✓ Общий клиренс
- ✓ Константа скорости абсорбции
- ✓ Константа скорости элиминации
- ✓ Период полувыведения
- ✓ Цитохромы
- ✓ Лекарственное вещество
- ✓ Лекарственный препарат
- ✓ Лекарственная форма
- ✓ Рецептор
- ✓ Агонист
- ✓ Антагонист



- ✓ Конкурентные антогонисты
  - ✓ Молчаливые (нейтральные) антогонисты
2. Какие виды транспорта лекарств бывают? Охарактеризуйте каждый из видов по направлению изменения градиента концентраций, необходимости энергических затрат, насыщенности и роли транспортных белков.
  3. Изобразите кривую титра плазмы. Укажите соответствующие подписи к ней.
  4. Какие параметры влияют на распределение лекарств?
  5. Какие параметры определяют всасывание лекарств?
  6. На какие виды делятся антагонисты рецепторов с позиции механизма реализации антагонистического действия?
  7. Изобразите кривую доза-эффект. Укажите соответствующие подписи к ней? В чем смысл данной кривой?

### Контрольная работа

1. Какая существует классификация химиотерапевтических средств? На какие разновидности они делятся по специальным показаниям?
2. На какие группы делятся антибиотики по химической структуре и антимикробному спектру?
3. Что такое бактерицидный и бактериостатический эффект?
4. В чем заключается сущность дисково-диффузионного метода? Для каких целей его применяют?
5. В чем заключается механизм действия бета-лактамовых антибиотиков?
6. Охарактеризуйте фармакокинетические параметры пенициллинов.
7. Чем обусловлено появление различных поколений цефалоспоринов? Чем одно поколение отличается от другого?
8. Каков механизм действия сульфаниламидов?
9. Каков антимикробный спектр сульфаниламидов?
10. Какова фармакокинетика фторхинолонов?
11. Определите класс антибиотика



## Контрольная работа

1. Дайте определения следующим понятиям:

- Литики
- Медиаторы
- Холиномиметик
- Антихолинэстеразные препараты
- Ганглиоблокаторы
- Миорелаксанты
- Андреноблокаторы

2. Опишите фармакодинамику М-холиномиметиков.

3. Опишите фармакокинетику М-холиноблокаторов.

4. Опишите применение М-холиноблокаторов

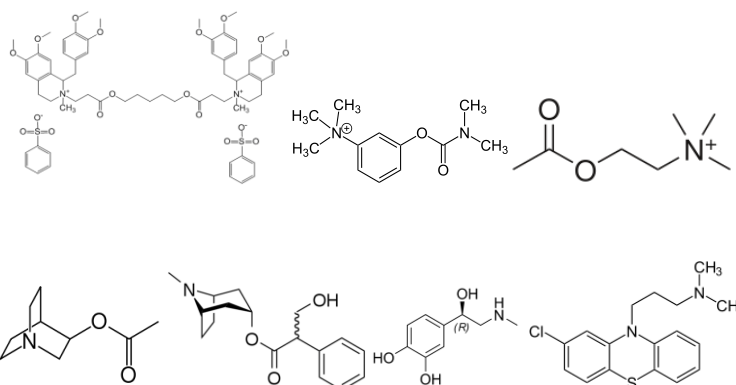
5. Опишите фармакодинамику ганглиоблокаторов.

6. Опишите классификацию миорелаксантов.

7. Опишите классификацию антиадренергических средств.

8. Опишите фармакокинетику  $\beta$ -адреноблокаторов.

9. Классифицируйте нижеприведенные ЛВ



## Контрольная работа

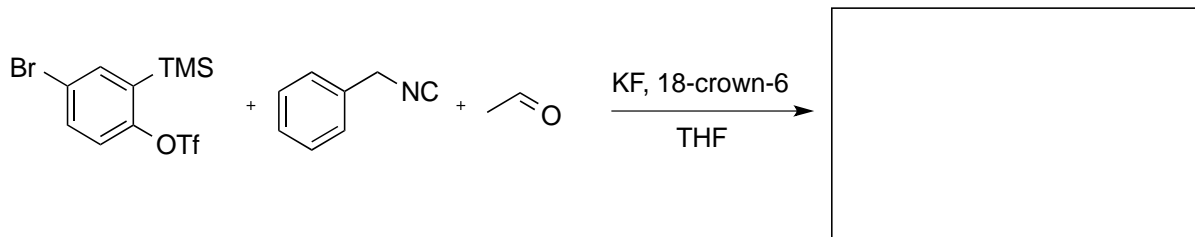
1. Вы проводите трехкомпонентный синтез между реагентами А, В и С. Реагентов типа А - 5, типа В - 6, типа С - 9. Сколько соединений будет содержать комбинаторная библиотека?

2. Выделите из серии соединений базовый скелет.

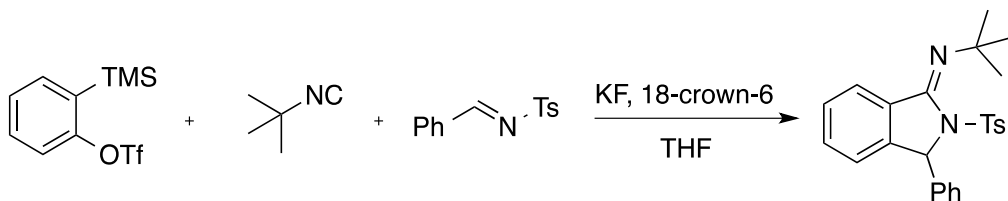


### Контрольная работа

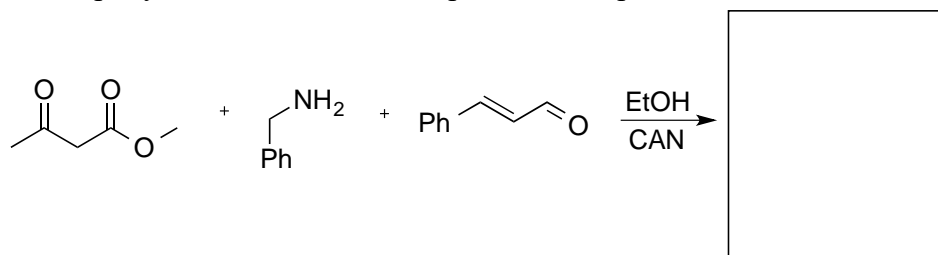
1. Приведите несколько (2-3 способа) препаративных методик генерирования аринов.
2. Изобразите продукт нижеприведенной реакции.



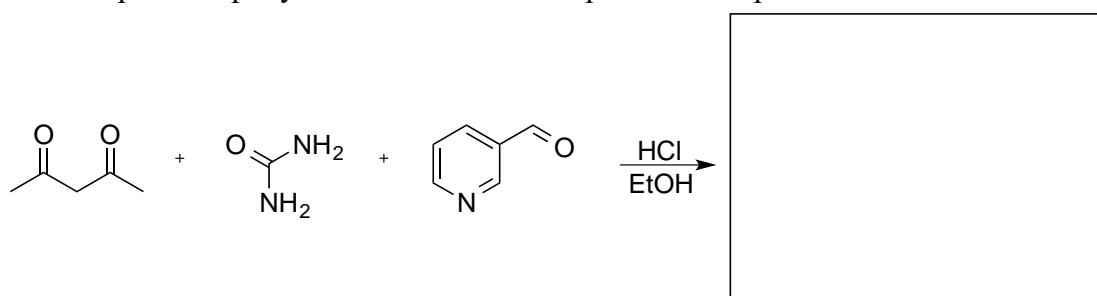
3. Изобразите механизм нижеприведенной реакции.



4. Изобразите продукт и механизм нижеприведенной реакции.



5. Изобразите продукт и механизм нижеприведенной реакции.



### Критерии оценки:

- оценка «отлично» выставляется студенту, если студент выполняет все задания контрольной работы без ошибок;
- оценка «хорошо» выставляется студенту, если студент допускает ошибку в одном из заданий контрольной работы;

- оценка «удовлетворительно» выставляется студенту, если студент допускает ошибку в двух и более заданиях, но при этом правильно решает одно задание контрольной работы;
- оценка «неудовлетворительно» выставляется студенту, если студент не выполняет ни одного задания контрольной работы, либо же в ответе на каждое задание контрольной работы допущена ошибка.

### **10. Образовательные технологии и методические указания по освоению дисциплины (учебного курса)**

В процессе изучения дисциплины «Медицинская химия» используются различные образовательные технологии. Технология традиционного обучения (лекции, семинары, практические занятия, самостоятельная работа) является основной. Интерактивные технологии, включающие в себя лекции с элементами дискуссии, практические занятия с решением ситуационных задач с последующим обсуждением результатов деятельности.

В соответствии с ФГОС ВО при изучении этого курса предусмотрены лекционные, лабораторные, практические занятия и самостоятельная работа. Лекции и самостоятельная работа направлены на теоретическую подготовку, практические и лабораторные занятия ориентированы на практическую подготовку студентов.

#### **Методические рекомендации студенту по изучению дисциплины**

При освоении темы необходимо:

- изучить учебный материал по соответствующему разделу дисциплины, используя лекционный материал и литературу по данной тематике (включая оригинальную литературу, приведенную на лекции).

## 11. Учебно-методическое и информационное обеспечение дисциплины (учебного курса)

### 11.1. Обязательная литература

№ п/п	Библиографическое описание	Тип (учебник, учебное пособие, учебно-методическое пособие, практикум, др.)	Количество в библиотеке
1.	Ким А. М. Органическая химия [Электронный ресурс] : учеб. пособие для вузов / А. М. Ким. - 5-е изд., испр. и доп. - Новосибирск : Сибир. унив. изд-во, 2017. - 842 с. : ил. - ISBN 978-5-379-02004-0.	Учебное пособие	ЭБС «IPRbooks»
2.	Устынюк Ю. А. Лекции по органической химии [Электронный ресурс] . Ч. 1. Вводный концентр / Ю. А. Устынюк. - Москва : Техносфера, 2015. - 504 с. - (Мир химии). - ISBN 978-5-94836-430-8.	Учебное пособие	ЭБС "IPRbooks"
3.	Теоретические основы органической химии : задачник по дисциплинам "Теорет. основы орган. химии", "Механизмы орган. реакций", "Реакц. способность орган. соединений" / А. С. Бунев [и др.]. - ТГУ. - Тольятти : ТГУ, 2014. - 79 с. : ил. - Библиогр.: с. 78. - Список сокр. и обозн.: с. 77. - ISBN 978-5-8259-0800-7 : 89-18.	Учебное пособие	53
4.	Горленко В. А. Органическая химия [Электронный ресурс] : для бакалавров-биологов : учебное пособие. Ч. 2 / В. А. Горленко. - Москва : МПГУ, 2016. - 332 с. : ил. - ISBN 978-5-4263-0212-9.	Учебное пособие	ЭБС «IPRbooks»
5.	Горленко В. А. Органическая химия [Электронный ресурс] : для бакалавров-биологов : учебное пособие. Ч. 1 / В. А. Горленко. - Москва : МПГУ, 2016. - 400 с. : ил. - ISBN 978-5-4263-0211-2.	Учебное пособие	ЭБС «IPRbooks»

### 11.2. Дополнительная литература и учебные материалы (аудио-, видеопособия и др.)

- фонд научной библиотеки ТГУ:

№ п/п	Библиографическое описание	Тип (учебник, учебное пособие, учебно-методическое пособие, практикум, аудио-, видеопособия и др.)	Количество в библиотеке
6.	Шабаров Ю. С. Органическая химия [Электронный ресурс] : учебник / Ю. С. Шабаров. - Изд. 5-е, стер. - Санкт-Петербург : Лань, 2011. - 848 с. : ил. - (Учебники для вузов. Специальная литература). - ISBN 978-5-8114-1069-9.	Учебник	ЭБС «Лань»
7.	Самуилов Я.Д. Реакционная способность органических соединений [Электронный ресурс] : учебное пособие / Я.Д. Самуилов, Е.Н. Черезова ; Казан. гос. технол. ун-т. – Казань, 2010. - 419 с. - ISBN 978-5-7882-0941-8.	Учебное пособие	ЭБС «IPRbooks»
8.	Щербина А. Э. Органическая химия. [Электронный ресурс] : Основной курс : учебник / А. Э. Щербина, Л. Г. Матусевич. - Минск ; Москва: Новое знание : ИНФРА-М, 2013. - 808 с.: ил. (Высшее образование - Бакалавриат). - ISBN 978—985-475-551-9.	Учебник	ЭБС «ZNANIUM.COM»
9.	Цышевский Р.В. Квантово-химические расчеты механизмов химических реакций [Электронный ресурс] : учебно-методическое пособие / Р.В. Цышевский, Г.Г. Гарифзянова, Г.М. Храпковский. - Казань : КНИТУ, 2012. - 88 с. - ISBN 978-5-7882-1301-9.	Учебно-методическое пособие	ЭБС «IPRbooks»

СОГЛАСОВАНО

Директор научной библиотеки

«\_\_» \_\_\_\_\_ 20\_\_ г.  
МП

\_\_\_\_\_  
(подпись)

А.М. Асаева  
(И.О. Фамилия)

### 11.3. Перечень ресурсов информационно-телекоммуникационной сети "Интернет"

- **Oriental Journal Of Chemistry** [Электронный ресурс] : науч. журн. / Scientific Publishers – Электронный журнал – Индия, 2008 – . – Режим доступа к журналу: <http://www.orientjchem.org/Archive.php>.
- **Бутлеровские сообщения** [Электронный ресурс] : науч. журн. / ООО «Инновационно-издательский дом «Бутлеровское наследие» – Казань, 1999 – . – Режим доступа к журналу: <https://butlerov.com/stat/reports/view.asp?lang=ru>.

### 11.4. Перечень программного обеспечения

№ п/п	Наименование ПО	Количество лицензий	Реквизиты договора (дата, номер, срок действия)
1.	Windows	1398	Договор № 690 от 19.05.2015г., срок действия - бессрочно
2.	Office Standart	1398	Договор № 690 от 19.05.2015г., срок действия - бессрочно; Договор № 727 от 20.07.2016г., срок действия - бессрочно

### 11.5. Описание материально-технической базы, необходимой для осуществления образовательного процесса по дисциплине (модулю)

№ п/п	Наименование оборудованных учебных кабинетов, лабораторий, мастерских и др. объектов для проведения практических и лабораторных занятий	Перечень основного оборудования	Фактический адрес учебных кабинетов, лабораторий, мастерских и др.	Площадь, м <sup>2</sup>	Количество посадочных мест
1	Учебная аудитория для проведения занятий лекционного типа. Учебная аудитория для проведения занятий семинарского типа. Учебная аудитория для курсового проектирования (выполнения курсовых работ). Учебная аудитория для проведения групповых и индивидуальных консультаций. Учебная аудитория для проведения занятий текущего контроля и промежуточной аттестации.	Столы ученические двухместные (моноблоки), стол преподавательский, стул преподавательский, доска аудиторная (меловая).	445020, Самарская область, г. Тольятти, ул. Белорусская 16Б, позиция по ТП №19, 2 этаж (А-215)	62,30	44



№ п/п	Наименование оборудо- ванных учебных каби- нетов, лабораторий, ма- стерских и др. объектов для проведения практи- ческих и лабораторных занятий	Перечень основного оборудования	Фактический адрес учебных кабинетов, лабораторий, ма- стерских и др.	Площадь, м <sup>2</sup>	Количество посадочных мест
2	Компьютерный класс. Помещение для самостоятельной работы. Учебная аудитория для проведения занятий семинарского типа. Учебная аудитория для курсового проектирования (выполнения курсовых работ). Учебная аудитория для проведения групповых и индивидуальных консультаций. Учебная аудитория для проведения занятий текущего контроля и промежуточной аттестации.	Столы ученические, стулья ученические, ПК с выходом в сеть Интернет	445020 Самарская обл. г. Тольятти, ул. Белорусская, 14, позиция по ТП № 48, 4 этаж (Г-401)	84,8	16