

**МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ И НАУКИ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ФЕДЕРАЛЬНОЕ ГОСУДАРСТВЕННОЕ БЮДЖЕТНОЕ
ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ
«ИНГУШСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ»**

Кафедра химии



УТВЕРЖДАЮ

Проректор по учебной работе

Батыгов З.О.

З.О. Батыгов 2018 г.

РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ

ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ

Факультет: химико-биологический

Направление подготовки /специальность: 04.05.01

Фундаментальная и прикладная химия

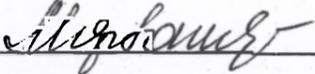
Программа: специалитет

Квалификация (степень) выпускника: Химик. Преподаватель химии

Форма обучения: очная

МАГАС 20 18 г.

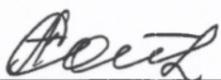
Составители рабочей программы

доцент, к.х.н.  / Маргазанова Р.М./

Рабочая программа утверждена на заседании кафедры химии

Протокол заседания № 6 от «24» апреля 2018 г.

/ Заведующий кафедрой

 / Султыгова З.Х. /

Составители рабочей программы

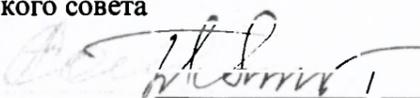
Рабочая программа одобрена учебно-методическим советом

химико-биологического факультета

Протокол заседания № 17 от «28» апреля 2018 г.

Протокол заседания № 17 от «28» апреля 2018 г.

Председатель учебно-методического совета

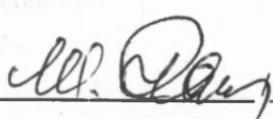
 / Плиева А.М. /

Программа рассмотрена на заседании Учебно-методического совета университета

протокол № 5 от «23» мая 2018 г.

Протокол заседания № 5 от «23» мая 2018 г.

Председатель Учебно-методического совета университета

 / Хашагульгов Ш.Б. /

Программа рассмотрена на заседании Учебно-методического совета университета

протокол № 5 от «23» мая 2018 г.

Председатель Учебно-методического совета университета

1. ЦЕЛИ ОСВОЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ

Целями освоения дисциплины «Фармацевтическая химия» являются:

- формирование у студентов теоретического мышления, навыков и умений на основе общих закономерностей химико-биологических наук и их частных проявлений для осуществления фармацевтического анализа на стадиях разработки, производства, транспортировки, хранения и потребления лекарственных средств для обеспечения соответствия качества требованиям научной документации (НД);
- освоение теоретических основ фармацевтической химии, лежащих в основе частной фармацевтической химии – фармацевтической химии лекарственных веществ.

2. МЕСТО ДИСЦИПЛИНЫ В СТРУКТУРЕ ОПОП ВО

Дисциплина «Фармацевтическая химия» относится к вариативной части обязательных дисциплин; изучается в 7 семестре.

Данный курс опирается на знания физики, математики, биологии.

Таблица 2.1.

Связь дисциплины «Фармацевтическая химия» с предшествующими дисциплинами и сроки их изучения

Код дисциплины	Дисциплины, предшествующие дисциплине «Физические методы исследования»	Семестр
Б1.Б.6	Математика	1-4
Б1.Б.11	Биология с основами экологии	1-4
Б1.Б.12	Неорганическая химия	1,2
Б1.Б.13	Аналитическая химия	3,4
Б1.Б.14	Органическая химия	5,6

Таблица 2.2.

Связь дисциплины «Физические методы исследования» с последующими дисциплинами и сроки их изучения

Код дисциплины	Дисциплины, следующие за дисциплиной «Физические методы исследования»	Семестр
Б1.Б.18	Химическая технология	8
Б1.Б.5	История и методология химии	9

В результате освоения дисциплины обучающийся должен:

Знать:

- значимость фармацевтической химии в общем направлении развития здравоохранения;
- исторические и научные предпосылки и принципы создания лекарственных средств;
- закономерности взаимосвязи химической структуры лекарственных веществ с физическими, химическими и фармакологическими свойствами как основы целенаправленного синтеза и разработки методов оценки качества лекарственных средств;
- источники и способы получения лекарственных веществ для обоснования требований к их чистоте, гарантирующих эффективность и безопасность применения;
- общие и частные методы анализа фармацевтических (физические, химические и физико-химические) лекарственных средств как систему исследования их качества;
- основные принципы стандартизации и организацию контроля как основу управления качеством лекарственных средств.

Уметь:

- характеризовать общие и частные физико-химические свойства лекарственных веществ в соответствии с химической структурой для прогнозирования возможных

изменений при хранении и транспортировке; для выбора исследования стабильности лекарственных веществ;

- осуществлять все виды фармацевтического анализа для контроля качества лекарственных средств на предприятиях фармацевтической промышленности на основе государственных принципов и положений, регламентирующих их качество.

Владеть:

- методологией оценки качества лекарственных препаратов на основе общих и частных закономерностей фармацевтической химии;
- методами анализа фармацевтических лекарственных средств.

3. КОМПЕТЕНЦИИ ОБУЧАЮЩЕГОСЯ, ФОРМИРУЕМЫЕ В РЕЗУЛЬТАТЕ ОСВОЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ

Процесс изучения дисциплины направлен на формирование элементов следующих компетенций в соответствии с ФГОС ВО и ОПОП ВО по данному направлению подготовки:

- а) профессиональных (ПК) – ПК-1, ПК-2, ПК-8, ПК-11.

Таблица 3.1.

Матрица связи компетенций, формируемых на основе изучения дисциплины «Физические методы исследования», с временными этапами освоения ее содержания

Коды компетенций (ФГОС)	Компетенция	Семестр изучения
ПК-1	Способность проводить научные исследования по сформулированной тематике и получать новые научные и прикладные результаты	7

ПК-2	Владение базовыми навыками использования современной аппаратуры при проведении научных исследований	7
ПК-8	Владение основными химическими, химическими, физическими и техническими аспектами химического промышленного производства с учетом сырьевых и энергетических затрат	7
ПК-11	Владение методами отбора материала, проведения теоретических занятий и лабораторных работ, основами управления процессом обучения в образовательных организациях	7

4. ОБЪЕМ ДИСЦИПИНЫ И ВИДЫ УЧЕБНОЙ РАБОТЫ

Таблица 4.1.

Объем дисциплины и виды учебной работы

Вид учебной работы	Всего часов	7 семестр
Общая трудоемкость дисциплины	72	72
Аудиторные занятия	52	52
Лекции	16	16
Лабораторные занятия	34	34
Контроль самостоятельной работы (КСР)	2	2
Самостоятельная работа студентов (СРС)	20	20

**5. СОДЕРЖАНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ, СТРУКТУРИРОВАННОЕ ПО ТЕМАМ
(РАЗДЕЛАМ) С УКАЗАНИЕМ ОТВЕДЕННОГО НА НИХ КОЛИЧЕСТВА
АКАДЕМИЧЕСКИХ ИЛИ АСТРОНОМИЧЕСКИХ ЧАСОВ И ВИДОВ УЧЕБНЫХ
ЗАНЯТИЙ**

Таблица 5.1.

Структура и содержание дисциплины

№ п/п	Раздел дисциплины	Семестр	Неделя семестра	Виды учебной работы, включая самостоят. работу			Форма текущего контроля успеваемости, форма промежуточного контроля и аттестации
				Лек- ции	лаборат. занятия	Самостоят. работа	
1	Фармацевтическая химия. Основные этапы в развитии. Классификация лекарственных средств.	7	1	1	-	1	собеседование
2	Строение клетки. Распре- деление лекарств. Биоло- гические мембраны.	7	2	1	3	2	собеседование
3	Проблемы ионизации и липофильности ФАВ. Депонирование, выведение, метаболизм.	7	3	1	3	2	собеседование
4	Взаимодействие ФАВ с ре- цепторами.	7	4	1	3	1	собеседование
5	Нейромедиаторы, их син- тез в организме. Синергизм и антагонизм.	7	5-6	1	3	2	контрольная работа № 1
6	Эффекты медиаторов. Аго- нисты и антагонисты раз- личных типов рецепторов.	7	7-8	1	4	2	собеседование
7	Избранные группы лекар- ственных препаратов. Принцип действия.	7	9-10	2	3	2	тестовый контроль
8	Принципы создания проти- вовирусных препаратов.	7	11-12	2	3	2	собеседование

9	Анальгетики ненаркотического действия, их механизм.	7	13-14	2	4	2	контрольная работа № 2
10	Принципы создания противораковых препаратов.	7	15-16	2	4	2	собеседование
11	Синтез некоторых лекарственных препаратов.	7	17-18	2	4	2	тестовый контроль
	ИТОГО:			16	34	20	

Таблица 5.2.

Конкретизация результатов освоения дисциплины

<i>ПК-1 Способность проводить научные исследования по сформулированной тематике и получать новые научные и прикладные результаты</i>		
Знать: методы экспериментальных исследований в химии, метод регрессионного анализа; методы оптимизации экспериментальных исследований; способы планирования эксперимента; возможности в области использования аппаратуры и оборудования для выполнения исследований.	Уметь: осуществлять выбор оборудования и методик для решения конкретных задач, эксплуатировать современную аппаратуру и оборудование; планировать химический эксперимент; обрабатывать экспериментальные данные.	Владеть: навыками работы с современной аппаратурой и методиками обработки экспериментальных результатов.
<i>ПК-2 Владение навыками использования современной аппаратуры при проведении научных исследований</i>		
Знать: технические данные современной аппаратуры, целью получения достоверных результатов научных исследований.	Уметь: использовать современную аппаратуру при проведении научных исследований.	Владеть: навыками работы на современной аппаратуре при проведении научных исследований.
<i>ПК- 8 Владение основными химическими, химическими, физическими и техническими аспектами химического промышленного производства с учетом сырьевых и энергетических затрат</i>		

Знать: основы химического промышленного производства	Уметь: использовать в работе основные аспекты химического промышленного производства	Владеть: основными химическими, физическими и техническими аспектами химического промышленного производства с учетом сырьевых и энергетических затрат
<i>ПК-11 Владение методами отбора материала, проведения теоретических занятий и лабораторных работ, основами управления процессом обучения в образовательных организациях</i>		
Знать: строение содержания базового курса химии в общеобразовательной школе; методики преподавания химии; методы отбора материала; понятие «комплексное психолого-педагогическое исследование»; логическую структуру психолого-педагогического исследования; методологию, методы и методики, критерии и мониторинг результатов психолого-педагогического исследования; требования к логике изложения и к оформлению результатов исследования; основы управления процессом обучения в образовательных организациях.	Уметь: анализировать планы, учебные программы; отбирать материал преподавания; разрабатывать рабочие программы и планы уроков; создавать условия для реализации задач разностороннего воспитания детей.	Владеть: методами и средствами управления педагогическим и ученическим коллективами и создания комфортного психологического климата школьного коллектива.

Содержание дисциплины

Фармацевтическая химия: определения и цели. Основные фазы рационального поиска и конструирования лекарственных препаратов. Соединение-лидер и стратегии его поиска.

Липиды как мишени действия ФАВ. Ионофоры и каналобразующие соединения. Особенности их химической структуры и механизм действия. Амфотерицин В, Грамицидин, Валиномицин. Синтетические аналоги природных ионофоров.

Ферменты как мишени действия ФАВ. Конкурентное обратимое ингибирование (примеры). Особенности химического строения конкурентных ингибиторов. Понятие фармакофора. Необратимое ингибирование, структурные особенности ингибиторов (газы нервно-паралитического действия). Аналоги переходного состояния, принцип их конструирования (примеры). Суицидные субстраты, особенности их структуры и механизма. Аллостерическое ингибирование. Особенности структуры аллостерических ингибиторов в системах с контролем по принципу обратной связи.

Рецепты как мишени действия ФАВ. Структура нейрона, химические основы возникновения и проведения нервных импульсов, синапс. Нейромедиаторы. Классификация рецепторов по механизму передачи сигнала. Ионные каналы. Механизмы передачи сигнала с помощью вторичных мессенджеров. Агонисты (примеры), их структурные характеристики. Понятие сродства соединения к рецептору и его внутренней активности. Понятие эутомера и дистомера. Антагонисты (примеры), принципы конструирования их структуры. Аллостерические агонисты и антагонисты. Частичные агонисты.

Ацетилхолиновые рецепторы. Классификация, структура и механизм передачи сигнала. Природные и синтетические агонисты (ацетилхолин, мускарин, никотин, карбахол). Понятия изостера и биоизостера. Природные антагонисты (примеры), особенности их структур и принципы создания синтетических антагонистов ацетилхолиновых рецепторов (примеры).

Синтез серотонина в организме и основная реакция его метаболизма. Серотониновые рецепторы, их классификация и механизм передачи сигнала. Примеры конструирования агонистов и антагонистов серотонина, их использование в клинической практике (буспирон, суматриптан, кетансерин, ондасетрон и др.).

Рецепторы глутаминовой кислоты. Классификация и механизм передачи сигнала. NMDA подтип. Принципы конструирования агонистов и антагонистов различных сайтов связывания лигандов (примеры). АМПА-Каинатный подтип: успехи и проблемы в создании лигандов. Агонисты и антагонисты первой группы метаботропных глутаматных рецепторов (примеры).

Синтез дофамина и адреналина в организме. Классификация и механизм дофаминовых рецепторов. Принципы лечения болезни Паркинсона. Классификация адреналиновых рецепторов. Структурные особенности и клиническое применение лигандов, взаимодействующих с бета-рецепторами (примеры).

Гистамин, его функция в организме, классификация его рецепторов. Антагонисты гистаминовых рецепторов, примеры структур, принципы конструирования, клиническое использование.

Опиатные рецепторы. Классификация и особенности механизма действия. Эндорфины. Морфин, основные соотношения «структура-свойство» для его аналогов. Возможные пути устранения их наркотических свойств. Налоксон, его клиническое применение. Сигма-рецептор.

Нуклеиновые кислоты как мишени действия ФАВ. Интеркалирующие и алкилирующие агенты, их структурные особенности и механизм действия (примеры). Соединения, действующие на РНК (примеры и принцип действия).

Фармакокинетика и фармакодинамика. Основные фармакокинетические характеристики, примеры изменения структуры ФАВ с целью улучшения этих характеристик. Гематоэнцефалический барьер и способы его преодоления. Судьба ксенобиотиков в организме – основные метаболические реакции. Принцип действия мутагенов, их структурные особенности. Явления, возникающие при повторном введении лекарственных препаратов.

Количественная характеристика биологической активности. Уравнение Скетчарда. Графическое определение сродства лиганда к рецептору. Понятие и определение (графическое или др.) величин EC_{50} , IC_{50} , ED_{50} , LD_{50} . Терапевтический индекс. Тестирование *in vivo*: трансгенные животные; поведенческие модели (примеры). Клинические испытания – понятия orphan drug; плацебо; двойной слепой метод. Понятие GMP в производстве лекарств.

Принципы конструирования отдельных классов лекарственных препаратов. Принципы создания антибактериальных препаратов. Структурные вариации сульфаниламидов. Принцип действия препаратов бисептол, фурациллин, тетрациклин, левомицетин, налидиксовая кислота. Структурные модификации модификации пенициллина G с целью оптимизации его физиологической активности. Механизм действия клавулановой кислоты.

Принципы создания противовирусных препаратов. Структурные особенности соединений ацикловир и азидотимидин. Механизм действия препаратов ремантадин, вирацепт.

Гормональная регуляция в организме (схема). Классификация гормонов по их структурам (примеры). Примеры создания антагонистов гормональных рецепторов. Особенности механизма действия стероидных гормонов.

Анальгетики ненаркотического действия (механизм действия). Структурные особенности препаратов аспирин, анальгин. Эпибатидин и его необычные свойства.

Принципы создания противораковых препаратов. Механизмы действия дисплатина, таксола, винбластин и винкристина, монастрола.

Возникновение иммунного ответа (схема). Иммуносупрессанты, механизм действия циклоспорина.

6. ОБРАЗОВАТЕЛЬНЫЕ ТЕХНОЛОГИИ

При изучении теоретического курса на лекциях предусматривается изложение материала в виде презентации. Отдельные лекции излагаются по проблемной технологии.

На лекциях используются в качестве демонстрационного материала Периодическая система элементов Д. И. Менделеева и ряд других справочных таблиц.

Некоторые разделы теоретического курса изучаются с использованием опережающей самостоятельной работы: студенты получают задания на ознакомление с новым материалом до его изложения на лекциях.

Перед очередной лекцией, как правило, практикуются «летучки» по материалу предыдущей лекции. Это позволяет определить степень усвоения изложенного ранее материала. Для более основательной оценки усвояемости теоретического материала студентами используются тесты, а также контрольные работы.

7. ПЕРЕЧЕНЬ УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОГО ОБЕСПЕЧЕНИЯ ДЛЯ САМОСТОЯТЕЛЬНОЙ РАБОТЫ ОБУЧАЮЩИХСЯ ПО ДИСЦИПЛИНЕ (МОДУЛЮ)

Лекционные занятия проводятся 1 раз неделю в объеме 1 часа и 2 часов лабораторных занятий в 7 семестре. После окончания изучения каждой темы студенты проходят тестирование, собеседование, выполняют контрольные работы.

7.1. Перечень-учебно-методического обеспечения для обучающихся по дисциплине:

1. Беликов В.Г. Фармацевтическая химия. – М.: МЕДпрес-информ, 2008.
2. Фармацевтическая технология. Под ред. Краснюка И.И. – Академия, 2006.
3. Аксенова Э.Н., Андрианова О.П., Арзамасцев А.П. Руководство к лабораторным занятиям по фармацевтической химии. – М.: Медицина, 2000.

7.2. Указания для обучающихся по освоению дисциплины

Таблица 7.1..

Содержание самостоятельной работы обучающихся

<i>Номер раздела</i>	<i>Темы/вопросы, выносимые на самостоятельное изучение</i>	<i>Кол-во часов</i>	<i>Формы работы</i>
1.	Фармацевтическая химия. Основные этапы в развитии. Классификация лекарственных средств. Строение клетки. Распределение лекарственных средств. Биологические мембраны.	3	собеседование, тестовый контроль
2.	Проблемы ионизации и липофильности ФАВ. Делонирование, выведение, метаболизм. Взаимодействие ФАВ с рецепторами.	3	собеседование, тестовый контроль
3.	Нейромедиаторы, их синтез в организме. Синергизм и антагонизм.	3	собеседование, тестовый контроль
4.	Эффекты медиаторов. Агонисты и антагонисты. Различных типов рецепторов. Избранные группы лекарственных препаратов. Принцип действия.	3	собеседование, тестовый контроль
5.	Принципы создания противовирусных препаратов. Анальгетики ненаркотического действия, их механизм.	4	собеседование, тестовый контроль
6.	Принципы создания противораковых препаратов. Синтез некоторых лекарственных препаратов.	4	собеседование, тестовый контроль

8. ОЦЕНОЧНЫЕ СРЕДСТВА ДЛЯ ТЕКУЩЕГО КОНТРОЛЯ УСПЕВАЕМОСТИ И ПРОМЕЖУТОЧНОЙ АТТЕСТАЦИИ

Фонды оценочных средств и критерии оценки представлены отдельно, как приложение к рабочей программе.

9. УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ И ИНФОРМАЦИОННОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

а) основная литература:

1. Беликов В.Г. Фармацевтическая химия. – М.: МЕДпресс-информ, 2008.
2. Фармацевтическая технология. Под ред. Краснюка И.И. – Академия, 2006.
3. Аксенова Э.Н., Андрианова О.П., Арзамасцев А.П. Руководство к лабораторным занятиям по фармацевтической химии. – М.: Медицина, 2000.
4. Архипова А.В., Дзбановская И.Э. и другие. Практическое руководство по фармацевтической химии. Под ред. П. Л.Сенова. – М.: Медицина, 1997.
5. Бушкова М.Н. и др. Руководство по анализу лекарств в условиях аптеки. – Киев, 1995.
6. Государственная фармакопея СССР. М.: Медицина, 1987.
7. Кулешова М.И., Гусева Л.Н., Савицкая О.Е., Еремеева В.С. и др. Пособие по качественному анализу фармпрепаратов в двухкомпонентных лекарственных смесях. – М.: Медицина, 1983.
8. Кулешова М.И., Гусева Л.Н., Савицкая О.Е., Еремеева В.С. и другие. Пособие по химическому анализу лекарств. – М.: Медицина, 1974.
9. Мартазанова Р.М., Дзаурова М.М. Лабораторный практикум по дисциплине «Медицинская химия». – Магас, 2008.

б) дополнительная литература:

1. Машковский М.Д. Лекарственные средства, тт 1,2, изд.14.- М.: Новая волна, 2000.
2. Солдатенко А.Т., Колядина Н.М., Шендрик И.В. Основы органической химии лекарственных веществ. – М.: Химия, 2001.
3. Кулешова М.И., Гусева Л.Н., Савицкая О.Е., Еремеева В.С. и другие. Практическое руководство по анализу лекарственных смесей, содержащих ядовитые вещества. – М.: Медицина, 1985.
4. Методики количественного определения некоторых лекарственных средств в смесях (ЦАНИИ). – М.: «Союзхимфармторг», 1968.

в) Программное обеспечение и Интернет-ресурсы

1. http://c-books.narod.ru/pryanishnikov1_2_1.html
2. <http://alhimic.ucoz.ru/load/26>
3. <http://www.chem.msu.su/rus/teaching/org.html>
4. <http://www.xumuk.ru>
5. <http://chemistry.narod.ru>
6. <http://www.media.ssu.samara.ru/lectures/deryabina/index/html>
7. ChemSoft 2004

10. МАТЕРИАЛЬНО-ТЕХНИЧЕСКОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

1. **Теоретический курс**
 - 1) Лекции: презентации.
 - 2) Список вопросов для проведения собеседования..
 - 3) Варианты заданий для контрольных работ.