

МИНОБРНАУКИ РОССИИ
ФЕДЕРАЛЬНОЕ ГОСУДАРСТВЕННОЕ БЮДЖЕТНОЕ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ
ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ
«ВОРОНЕЖСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ»
(ФГБОУ ВО «ВГУ»)

УТВЕРЖДАЮ

Заведующий кафедрой
органической химии

Х.С. Шихалиев

26.05.2023 г.

РАБОЧАЯ ПРОГРАММА УЧЕБНОЙ ДИСЦИПЛИНЫ
Б1.В.05 Основы медицинской химии

1. Код и наименование направления подготовки/специальности: 04.04.01. "Химия"
2. Профиль подготовки/специализация: органическая химия
3. Квалификация выпускника: магистр
4. Форма обучения: очная
5. Кафедра, отвечающая за реализацию дисциплины:
1003 кафедра органической химии
6. Составители программы:
Вандышев Дмитрий Юрьевич, к.х.н., доцент
7. Рекомендована: НМС химического факультета, 25.04.2023, протокол № 4
8. Учебный год: 2024-2025 Семестр(ы)/Триместр(ы): 3

9. Цели и задачи учебной дисциплины

Целью освоения учебной дисциплины является формирование системных знаний:

- о поиске и структурному дизайну физиологически активных веществ,
- по выявлению взаимосвязи между химической структурой и физиологической активностью (*in silico*);
- по конструированию необходимых структур, обладающих заданными свойствами;
- о биологических и фармакологических методах оценки потенциальных лекарственных веществ *in vivo* и *in vitro*.

Задачи учебной дисциплины:

- изучение механизмов действия основных классов лекарственных веществ;
- изучение принципов взаимодействия лекарственных веществ с рецепторами, ферментами и нуклеиновыми кислотами;
- изучение механизмов распределения и метаболизма лекарственных веществ в организме;
- изучение принципов комбинаторной химии и методологии поиска новых лекарственных средств;
- изучение математических методов установления связи "структура-свойство".

10. Место учебной дисциплины в структуре ООП:

Курс входит в часть, формируемую участниками образовательных отношений (дисциплины). Студент для освоения курса должен быть знаком с основами:

- 1) органической химии
- 2) физической химии
- 3) фармацевтической химии
- 4) биологии с основами экологии
- 5) химических основ жизни
- 6) коллоидной химии
- 7) химии высокомолекулярных соединений
- 8) химии биологически активных соединений.

Студент должен иметь представления о методах синтеза органических соединений, методах анализа, а также математических методах в химии и биологии (ПК-1.1, ПК-1.2, ПК-3.1, ПК-3.2)

11. Планируемые результаты обучения по дисциплине/модулю (знания, умения, навыки), соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы (компетенциями) и индикаторами их достижения:

Код	Название компетенции	Код(ы)	Индикатор(ы)	Планируемые результаты обучения
ПК-1	Способен проводить сбор, систематизацию и критический анализ научной, технической и патентной информации, необходимой для решения исследовательских задач химической направленности	ПК-1.1	Обеспечивает сбор научной, технической и патентной информации, необходимой для решения исследовательских задач	Знать: <ul style="list-style-type: none">- стандартные методы получения, идентификации и исследования свойств веществ и материалов, правила обработки и оформления результатов работы, нормы ТБ;- методы планирования эксперимента.- источники научно-технической информации, журналы отечественной и международной научной периодики, основы поиска патентной информации; Уметь: <ul style="list-style-type: none">- осуществлять поиск научно-технической информации с использованием ресурсов сети Интернет, баз данных; оформлять отчет о результатах поиска информации; Владеть: <ul style="list-style-type: none">- приемами поиска научно-технической информации и методами составления
		ПК-1.2	Составляет аналитический обзор собранной научной, технической и патентной информации по тематике исследовательского проекта	

				отчетов о результатах поиска; - навыками проведения химического эксперимента и оформления его результатов; - навыками планирования, анализа и обобщения результатов эксперимента.
ПК-3	Способен на основе критического анализа результатов НИР и НИОКР оценивать перспективы их практического применения и продолжения работ в области химии высокомолекулярных соединений, аналитической и органической химии	ПК-3.1	Систематизирует информацию, полученную в ходе НИР и НИОКР, анализирует ее и сопоставляет с литературными данными	Знать: - принципы систематизации научной и научно-практической информации в области медицинской химии; - современные направления молекулярного дизайна лекарственных средств и способы предсказания их активности при помощи методов хемо- и биоинформатики. Уметь: - систематизировать и сопоставлять экспериментальные и литературные данные в соответствии с поставленной исследовательской задачей. Владеть: - навыками анализа полученных результатов для определения и выбора перспективных направлений развития работ и практического применения
		ПК-3.1	Определяет возможные направления развития работ и перспективы практического применения полученных результатов	

12. Объем дисциплины в зачетных единицах/час. — 7/252.

Форма промежуточной аттестации экзамен

13. Трудоемкость по видам учебной работы

Вид учебной работы	Трудоемкость			
	Всего	По семестрам		
		3 семестр	№ семестра	...
Аудиторные занятия	74	74		
в том числе:	лекции	18	18	
	практические	18	18	
	лабораторные	38	38	
Самостоятельная работа	142	142		
в том числе: курсовая работа (проект)	-	-		
Форма промежуточной аттестации (экзамен – 36 час.)	36	36		
Итого:	252	252		

13.1. Содержание дисциплины

№ п/п	Наименование раздела дисциплины	Содержание раздела дисциплины	Реализация раздела дисциплины с помощью онлайн-курса, ЭУМК*
1. Лекции			
1.1	Строение клетки	Структура и строение клетки, мембранные липиды, перенос веществ через мембраны	ЭУМК «Основы медицинской химии» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=2309
1.2	Взаимосвязь между физико-химическими свойствами и биологической	Растворимость и липофильность, поверхностно-активные, мембран-активные фармакологические объекты и ион-проводящие антибиотики, связь между фармакологической активностью,	ЭУМК «Основы медицинской химии» https://edu.vsu.ru/

	активностью органических веществ	электронными свойствами и константами ионизации, стереохимические аспекты действия лекарств	course/view.php?id=2309
1.3	Рецепторы, ферменты и нуклеиновые кислоты как мишени физиологически активных веществ	Семейства рецепторов, основные теории рецепции, системы передач рецепторного сигнала и вторичные посредники. Классы ферментов, принципы действия ферментов, кинетика и регуляция ферментативной активности, ингибиторы. Строение нуклеиновых кислот их биосинтез и механизм действия лекарственных средств	ЭУМК «Основы медицинской химии» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=2309
1.4	Фармакокинетика, элементы фармакодинамики. Метаболизм.	Основные понятия фармакокинетики и ее математические модели, метаболические пути, связь структуры и степени метаболизма лекарственных веществ. Понятие фармакологического эффекта. Аффинитет и внутренняя активность лекарственных веществ	ЭУМК «Основы медицинской химии» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=2309
1.5	Методология поиска новых лекарственных средств, усовершенствование структуры лидера	Источники поиска новых лекарственных средств, биологические испытания новых соединений, современные методы усовершенствования структуры лидера	ЭУМК «Основы медицинской химии» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=2309
1.6	Комбинаторный синтез	Стратегия конструирования и синтеза химических библиотек, комбинаторный синтез в растворах и на твердом носителе, методы установления структуры индивидуальных компонентов библиотек, перспективы развития	ЭУМК «Основы медицинской химии» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=2309
1.7	Количественные соотношения структура-активность. Deskрипторы, регрессионные модели, статистические методы классификации молекул по биологической активности	Количественные соотношения структура-активность, основные методологические понятия, deskрипторы молекулярной структуры, регрессионные модели биологической активности органических молекул, статистические методы классификации молекул по их биологической активности	ЭУМК «Основы медицинской химии» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=2309
2. Практические занятия			
2.1	Строение клетки	Структура и строение клетки, мембранные липиды, перенос веществ через мембраны	
2.2	Взаимосвязь между физико-химическими свойствами и биологической активностью органических веществ	Растворимость и липофильность, поверхностно-активные, мембран-активные фармакологические объекты и ион-проводящие антибиотики, связь между фармакологической активностью, электронными свойствами и константами ионизации, стереохимические аспекты действия лекарств	
2.3	Рецепторы, ферменты и нуклеиновые кислоты как мишени физиологически активных веществ	Семейства рецепторов, основные теории рецепции, системы передач рецепторного сигнала и вторичные посредники. Классы ферментов, принципы действия ферментов, кинетика и регуляция ферментативной активности, ингибиторы. Строение нуклеиновых кислот их биосинтез и механизм действия лекарственных средств	
2.4	Фармакокинетика, элементы фармакодинамики. Метаболизм.	Основные понятия фармакокинетики и ее математические модели, метаболические пути, связь структуры и степени метаболизма лекарственных веществ. Понятие фармакологического эффекта. Аффинитет и внутренняя активность лекарственных веществ	
2.5	Методология поиска новых лекарственных средств,	Источники поиска новых лекарственных средств, биологические испытания новых соединений, современные методы усовершенствования	

	усовершенствование структуры лидера	структуры лидера	
2.6	Комбинаторный синтез	Стратегия конструирования и синтеза химических библиотек, комбинаторный синтез в растворах и на твердом носителе, методы установления структуры индивидуальных компонентов библиотек, перспективы развития	
2.7	Количественные соотношения структура-активность. Deskрипторы, регрессионные модели, статистические методы классификации молекул по биологической активности	Количественные соотношения структура-активность, основные методологические понятия, deskрипторы молекулярной структуры, регрессионные модели биологической активности органических молекул, статистические методы классификации молекул по их биологической активности	
2.8	Перспективы развития медицинской химии	Защита рефератов. Обобщение пройденного материалы. Обсуждение перспектив дальнейшего развития медицинской химии.	
3. Лабораторные работы			
3.1	Строение клетки	Структура и строение клетки, мембранные липиды, перенос веществ через мембраны	
3.2	Взаимосвязь между физико-химическими свойствами и биологической активностью органических веществ	Растворимость и липофильность, поверхностно-активные, мембран-активные фармакологические объекты и ион-проводящие антибиотики, связь между фармакологической активностью, электронными свойствами и константами ионизации, стереохимические аспекты действия лекарств	
3.3	Рецепторы, ферменты и нуклеиновые кислоты как мишени физиологически активных веществ	Семейства рецепторов, основные теории рецепции, системы передач рецепторного сигнала и вторичные посредники. Классы ферментов, принципы действия ферментов, кинетика и регуляция ферментативной активности, ингибиторы. Строение нуклеиновых кислот их биосинтез и механизм действия лекарственных средств	
3.4	Фармакокинетика, элементы фармакодинамики. Метаболизм.	Основные понятия фармакокинетики и ее математические модели, метаболические пути, связь структуры и степени метаболизма лекарственных веществ. Понятие фармакологического эффекта. Аффинитет и внутренняя активность лекарственных веществ	
3.5	Методология поиска новых лекарственных средств, усовершенствование структуры лидера	Источники поиска новых лекарственных средств, биологические испытания новых соединений, современные методы усовершенствования структуры лидера	
3.6	Комбинаторный синтез	Стратегия конструирования и синтеза химических библиотек, комбинаторный синтез в растворах и на твердом носителе, методы установления структуры индивидуальных компонентов библиотек, перспективы развития	
3.7	Количественные соотношения структура-активность. Deskрипторы, регрессионные модели, статистические методы классификации молекул по биологической активности	Количественные соотношения структура-активность, основные методологические понятия, deskрипторы молекулярной структуры, регрессионные модели биологической активности органических молекул, статистические методы классификации молекул по их биологической активности	

13.2. Темы (разделы) дисциплины и виды занятий

№	Наименование темы	Виды занятий (количество часов)
---	-------------------	---------------------------------

п/п	(раздела) дисциплины	Лекции	Практические	Лабораторные	Самостоятельная работа	Всего
1	Строение клетки	2	2	2	15	21
2	Взаимосвязь между физико-химическими свойствами и биологической активностью органических веществ	2	2	4	15	23
3	Рецепторы, ферменты и нуклеиновые кислоты как мишени физиологически активных веществ	6	2	14	30	52
4	Фармакокинетика, элементы фармакодинамики. Метаболизм.	2	2	2	20	26
5	Методология поиска новых лекарственных средств, усовершенствование структуры лидера	2	2	6	15	25
6	Комбинаторный синтез	2	2	4	15	23
7	Количественные соотношения структура-активность. Дескрипторы, регрессионные модели, статистические методы классификации молекул по биологической активности	2	2	6	12	22
8	Перспективы развития медицинской химии	-	4	-	20	24
	Итого:	18	18	38	142	216

14. Методические указания для обучающихся по освоению дисциплины:

Организация изучения дисциплины предполагает:

- изучение основных и дополнительных литературных источников (п.15) в процессе лекционного курса;
- решение практических задач, предложенных преподавателем для работы на практических и лабораторных занятиях;
- тестирование или выполнение контрольных работ;
- текущий контроль успеваемости в форме устного опроса по основным разделам дисциплины

Текущая аттестация обеспечивает проверку освоения учебного материала, приобретения знаний, умений и навыков в процессе аудиторной и самостоятельной работы студентов, формирования профессиональных компетенций (ПК-1 и ПК-3).

При подготовке к текущей аттестации студенты изучают и конспектируют рекомендуемую преподавателем учебную литературу по темам лекционных и практических занятий, самостоятельно осваивают понятийный аппарат, закрепляют теоретические знания.

Планирование и организация текущих аттестации знаний, умений и навыков осуществляется в соответствии с содержанием рабочей программы и календарно- тематическим планом с применением фонда оценочных средств.

Текущая аттестация является обязательной, ее результаты оцениваются в балльной системе и по решению кафедры могут быть учтены при промежуточной аттестации обучающихся. Формой промежуточной аттестации знаний, умений и навыков обучающихся является экзамен.

Обучение лиц с ограниченными возможностями здоровья осуществляется с учетом их индивидуальных психофизических особенностей и в соответствии с индивидуальной программой реабилитации.

Для лиц с нарушением слуха информация по учебной дисциплине предоставляется на бумажном или электронном носителе. На лекционных и практических занятиях при необходимости допускается присутствие ассистента, а также, сурдопереводчиков и тифлосурдопереводчиков. Промежуточная аттестация для лиц с нарушениями слуха проводится в письменной форме, при этом используются общие критерии оценивания. При необходимости, время подготовки на экзамене может быть увеличено.

Для лиц с нарушением зрения допускается аудиальное предоставление информации (например, с использованием программ-синтезаторов речи), а также использование на лекциях звукозаписывающих устройств (диктофонов и т.д.). На лекционных и практических занятиях при необходимости допускается присутствие ассистента. При проведении промежуточной аттестации для лиц с нарушением зрения тестирование может быть заменено на устное собеседование по вопросам. При необходимости, время подготовки на экзамене может быть увеличено.

Лица с нарушениями опорно-двигательного аппарата с учетом состояния их здоровья часть занятий может быть реализована дистанционно. Лица с нарушениями опорно-двигательного аппарата с учетом состояния их здоровья часть занятий может быть реализована дистанционно. Промежуточная аттестация для лиц с нарушениями опорно-двигательного аппарата проводится на общих основаниях, при необходимости процедура экзамена может быть реализована дистанционно.

При реализации дисциплины с использованием дистанционных образовательных технологий используются инструменты электронной информационно-образовательной среды ВГУ «Электронный университет ВГУ» (<https://edu.vsu.ru>) и/или «МООК ВГУ» (<https://mooc.vsu.ru>), сервисы видеоконференций (BigBlueButton, Discord и др.), электронная почта, мессенджеры и соцсети.

15. Перечень основной и дополнительной литературы, ресурсов интернет, необходимых для освоения дисциплины

а) основная литература:

№ п/п	Источник
1	Кольман Я. Наглядная биохимия / Я. Кольман, К.-Г. Рём – М.: «БИНОМ.Лаборатория знаний», 2009. – 470 с.
2	Уэй Т. Физические основы молекулярной биологии: Учебное пособие / Т. Уэй - Долгопрудный: Издательский дом «Интеллект», 2010. – 3
3	Молекулярное моделирование. Теория и практика = Molecular modeling. Basic principles and applications / Х.-Д. Хельтве [и др.]; пер. с англ. А.А. Олиференко [и др.]; под ред. В.А. Палюлина, Е.В. Радченко. — М. : БИНОМ. Лаб. знаний, 2010.— 318 с

б) дополнительная литература:

№ п/п	Источник
4	Синтез лекарственных веществ: учебно-методическое пособие / Ф. Г. Хайрутдинов, З. Г. Ахтямова, В. В. Головин [и др.]; Министрство образования и науки России, Казанский национальный исследовательский технологический университет. – Казань: Казанский национальный исследовательский технологический университет (КНИТУ), 2014. – 136 с.
5	Стефанов, В. Е. Биоинформатика : учебник для академического бакалавриата / В. Е. Стефанов, А. А. Тулуб, Г. Р. Мавропуло-Столяренко. — Москва: Издательство Юрайт, 2019. — 252 с. https://urait.ru/book/bioinformatika-433453
6	Варфоломеев С.Д. Химическая энзимология : учебник для студ., обуч. по специальности 011000 "Химия" и направлению 510500 "Химия" / С.Д. Варфоломеев. — М. : Academia, 2005. — 471
7	Крыльский Д.В. Лекарственные вещества с гетероциклической структурой : учебное пособие по фармацевт. химии / Д.В. Крыльский, А.И. Сливкин ; Воронеж. гос. ун-т. — Воронеж : Воронеж. гос. ун-т, 2007. — 231 с.
8	Методы поиска новых лекарственных средств: учебное пособие / сост. Д.В. Крыльский, А.С.Шестаков. – Воронеж, 2006. – 43 с.
9	Солдатенков А.Т. Основы органической химии лекарственных веществ / А.Т.Солдатенков, Н.М.Колядина, И.В.Шендрик. - М. : Химия, 2003. – 190 с.
10	Варфоломеев С.Д. Биокинетика/ С.Д. Варфоломеев, К.Г. Гуревич. – М. : ФАИР-ПРЕСС, 1999. – 720 с.
11	Граник В.Г. Основы медицинской химии/ В.Г.Граник. – М. : Вузовская книга, 2001. – 384 с
12	Орлов В.Д. Медицинская химия/ В.Д.Орлов, В.В.Липсон, В.В.Иванов. – Харьков : Фолио, 2005. – 461 с.
13	Коноплева, Е. В. Фармакология : учебник и практикум для вузов / Е. В. Коноплева. — Москва : Издательство Юрайт, 2018. — 446 с. https://www.biblio-online.ru/book/1B30F021-32A4-4A7B-

	A34D-C75518A7F495
14	Иванов В. А. Органическая химия и основы биохимии [Электронный ресурс]: учебное пособие / Иванов В. А., Сашина Е. С., Новоселов Н. П. — СПб.: СПГУТД, 2015.— 200 с.
15	Шимановский, Н. Л. Молекулярная и нанофармакология / Н. Л. Шимановский, М. А. Епинетов, М. Я. Мельников. – Москва : Физматлит, 2009. – 622 с. https://www.rubr.ru/rffi/ru/books/o_26822

в) информационные электронно-образовательные ресурсы (официальные ресурсы интернет)*:

№ п/п	Ресурс
16	Зефирова О.Н., Зефиров Н.С. Медицинская химия (MEDICINAL CHEMISTRY). I. Краткий исторический очерк, определения и цели Вестник Московского университета. Серия 2: Химия [Электронный ресурс]. 2000. Т. 41. № 1. С. 43-47. URL: http://elibrary.ru/item.asp?id=5078948
17	Зефирова О.Н., Зефиров Н.С. Медицинская химия (MEDICINAL CHEMISTRY). II. Методологические основы создания лекарственных препаратов Вестник Московского университета. Серия 2: Химия [Электронный ресурс]. 2000. Т. 41. 2. С. 103-108. URL: http://elibrary.ru/item.asp?id=5078962
18	Ларина С.Н., Чебышев Н.В., Ших Е.В., Каркищенко В.Н. Модулирование действия ядерных рецепторов и регуляция биотрансформации лекарств [Электронный ресурс] / Биомедицина. – 2009. - №2. – С.70-80. Научная библиотека КиберЛенинка: http://cyberleninka.ru/article/n/modulirovanie-deystviya-yadernyh-retseptorov-i-regulyatsiyabiottransformatsii-lekarstv
19	https://www.lib.vsu.ru — Зональная научная библиотека ВГУ.
20	http://www.en.edu.ru/ - Естественно-научный образовательный портал - является составной частью федерального портала "Российское образование". Содержит ресурсы и ссылки на ресурсы по естественно-научным дисциплинам (физика, химия и биология).
21	http://window.edu.ru/ - информационная система «Единое окно доступа к образовательным ресурсам».
22	http://www.elibrary.ru – Научная электронная библиотека eLIBRARY.RU - крупнейший российский информационный портал в области науки, технологии, медицины и образования, содержащий рефераты и полные тексты более 12 млн. научных статей и публикаций. На платформе eLIBRARY.RU доступны электронные версии более 1400 российских научно-технических журналов, в том числе более 500 журналов в открытом доступе.
23	http://www.chem.msu.ru/rus/ - Chemnet - официальное электронное издание Химического факультета МГУ в Internet
24	ЭУМК «Основы медицинской химии» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=2309

16. Перечень учебно-методического обеспечения для самостоятельной работы

№ п/п	Источник
1	Крыльский Д.В. Лекарственные вещества с гетероциклической структурой: учебное пособие по фармацевт. химии / Д.В. Крыльский, А.И. Сливкин; Воронеж. гос. ун-т.— Воронеж: Воронеж. гос. ун-т, 2007. — 231 с.
2	Методы поиска новых лекарственных средств: учебное пособие / сост. Д.В. Крыльский, А.С. Шестаков. – Воронеж, 2006. – 43 с.
3	Граник В.Г. Основы медицинской химии/ В.Г.Граник. – М. : Вузовская книга, 2001. – 384 с
4	Орлов В.Д. Медицинская химия/ В.Д.Орлов, В.В.Липсон, В.В.Иванов. – Харьков : Фолио, 2005. – 461 с.
5	Шимановский, Н. Л. Молекулярная и нанофармакология / Н. Л. Шимановский, М. А. Епинетов, М. Я. Мельников. – Москва : Физматлит, 2009. – 622 с. https://www.rubr.ru/rffi/ru/books/o_26822

17. Образовательные технологии, используемые при реализации учебной дисциплины, включая дистанционные образовательные технологии (ДОТ, электронное обучение (ЭО), смешанное обучение):

При реализации дисциплины применяются различные типы лекций (вводная, обзорные, тематические, проблемные) и лабораторные занятия. Для самостоятельной работы студентам рекомендуется использовать список литературы представленный в п.15. При реализации учебной дисциплины используются элементы электронного обучения (ЭО) и дистанционные образовательные технологии (ДОТ) в части освоения лекционного материала, проведения текущей и промежуточной аттестации, проведения части лабораторных работ и самостоятельной работы обучающихся по дисциплине, позволяющие обеспечивать опосредованное взаимодействие (на расстоянии) преподавателей и обучающихся, включая инструменты электронной информационно-образовательной среды ВГУ «Электронный университет ВГУ» («Основы медицинской химии» <https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=2309>), проведение вебинаров,

видеоконференций, взаимодействие в соцсетях, посредством электронной почты, мессенджеров. Для освоения дисциплины также рекомендуются ресурсы для электронного обучения (п. 15).

18. Материально-техническое обеспечение дисциплины:

Ноутбук, мультимедийный проектор, экран. Специализированная мебель, шкаф вытяжной, лабораторные приборы, оборудование, посуда для синтеза и исследования органических соединений, аквадистиллятор ДЭ-10, баня водяная LB-140, весы аналитические HTR-220 CE Shinko VIBRA, комплекс для испарения жидкостей, микроскоп медицинский Биомед-6 (трино), цифровая камера ТС-1.3, рефрактометр ИРФ-454 Б2М, принтер лазерный Samsung ML-1641, ГХ-масс-спектрометр, ВЭЖХ-масс-спектрометр.

19. Оценочные средства для проведения текущей и промежуточной аттестаций

Порядок оценки освоения обучающимися учебного материала определяется содержанием следующих разделов дисциплины:

№ п/п	Наименование раздела дисциплины (модуля)	Компетенция(и)	Индикатор(ы) достижения компетенции	Оценочные средства
1.	Строение клетки	ПК-1 ПК-3	ПК-1.1 ПК-1.2 ПК-3.1 ПК-3.2	Практические занятия Лабораторные занятия Тестовые задания Домашняя работа
2.	Взаимосвязь между физико-химическими свойствами и биологической активностью органических веществ	ПК-1 ПК-3	ПК-1.1 ПК-1.2 ПК-3.1 ПК-3.2	Практические занятия Лабораторные занятия Тестовые задания Домашняя работа
3.	Рецепторы, ферменты и нуклеиновые кислоты как мишени физиологически активных веществ	ПК-1 ПК-3	ПК-1.1 ПК-1.2 ПК-3.1 ПК-3.2	Практические занятия Лабораторные занятия Тестовые задания Домашняя работа
4.	Фармакокинетика, элементы фармакодинамики. Метаболизм.	ПК-1 ПК-3	ПК-1.1 ПК-1.2 ПК-3.1 ПК-3.2	Практические занятия Лабораторные занятия Тестовые задания Домашняя работа
5.	Методология поиска новых лекарственных средств, усовершенствование структуры лидера	ПК-1 ПК-3	ПК-1.1 ПК-1.2 ПК-3.1 ПК-3.2	Практические занятия Лабораторные занятия Тестовые задания Домашняя работа
6.	Комбинаторный синтез	ПК-1 ПК-3	ПК-1.1 ПК-1.2 ПК-3.1 ПК-3.2	Практические занятия Лабораторные занятия Тестовые задания Домашняя работа
7.	Количественные соотношения структура-активность. Дескрипторы, регрессионные модели, статистические методы классификации молекул по биологической активности	ПК-1 ПК-3	ПК-1.1 ПК-1.2 ПК-3.1 ПК-3.2	Практические занятия Лабораторные занятия Тестовые задания Домашняя работа
8	Перспективы развития медицинской химии	ПК-1 ПК-3	ПК-1.1 ПК-1.2 ПК-3.1 ПК-3.2	Защита реферата
Промежуточная аттестация форма контроля – экзамен				Перечень вопросов

20. Типовые оценочные средства и методические материалы, определяющие процедуры оценивания

20.1. Текущий контроль успеваемости

Контроль успеваемости по дисциплине осуществляется с помощью следующих оценочных средств:

1) тестовых заданий, содержащих один или несколько правильных ответов.

Пример тестовых заданий с указанием правильного ответа, по различным разделам дисциплины
<p>1. Полнота и скорость всасывания лекарственного вещества, которые характеризуются его количеством, поступившим в организм, после применения лекарственного препарата называется:</p> <ol style="list-style-type: none">1) седиментация;2) валидация;3) биоэквивалентность;4) биодоступность.
<p>2. Равенство биодоступности в допустимых пределах одних и тех же лекарственных препаратов, приготовленных разными производителями, называется:</p> <ol style="list-style-type: none">1) стабильность;2) валидация;3) биоэквивалентность;4) гидрофильность.
<p>3. Более удобными в применении являются лекарственные средства</p> <ol style="list-style-type: none">1) имеющие низкую токсичность2) имеющие большую широту терапевтического действия3) имеющие малую широту терапевтического действия4) воздействующие одновременно на многие органы и системы
<p>4. Фармакокинетика – это раздел фармакологии, изучающий</p> <ol style="list-style-type: none">1) особенности всасывания и выведения лекарственных веществ2) осложнения лекарственной терапии3) распределение веществ в организме4) механизм действия лекарственных веществ
<p>5. Тератогенное действие – это</p> <ol style="list-style-type: none">1) токсическое действие на нервную систему больного2) отрицательное действие на эмбрион и плод с нарушением органогенеза3) токсическое действие на систему кроветворения4) вид побочного действия
<p>6. Ацетилирование лекарственных средств – это</p> <ol style="list-style-type: none">1) взаимодействие с глюкуроновой кислотой2) окисление с участием цитохромов P4503) связывание с остатком уксусной кислоты4) разновидность реакции конъюгации
<p>7. Понятию «активный транспорт» соответствуют утверждения</p> <ol style="list-style-type: none">1) транспорт против градиента концентрации2) транспорт, требующий затраты энергии3) транспорт вещества по межклеточным контактам4) синоним понятия «облегченная диффузия»
<p>8. Через гематоэнцефалический барьер легко проникают соединения</p> <ol style="list-style-type: none">1) липофильные2) полярные3) неионизированные4) содержащие в молекуле четвертичный азот
<p>9. Путем пассивной диффузии лучше всасываются</p> <ol style="list-style-type: none">1) вещества, растворимые в липидах2) гидрофильные вещества3) вещества в неионизированном состоянии4) мелкие гидрофильные молекулы
<p>10. Синергизм может быть</p> <ol style="list-style-type: none">1) прямой2) суммированный3) односторонний4) разнонаправленный
<p>11. Пролонгирование эффектов лекарственных средств достигается при</p> <ol style="list-style-type: none">1) создании депо в жировой ткани2) энтерогепатической циркуляции3) нарушении всасывания в кишечнике4) усилении биотрансформации в печени
<p>12. Фармакодинамика</p>

- 1) изучает биологические эффекты лекарственных средств
- 2) изучает механизмы действия лекарственных средств
- 3) изучает метаболизм лекарственных веществ
- 4) изучает распределение лекарственных веществ в организме

13. Отличительные особенности прокариотической клетки:

- 1) малый размер
- 2) наличие ядра
- 3) наличие субклеточных органелл
- 4) многослойная клеточная стенка
- 5) хромосомная ДНК в ядре

14. Прокариоты – это ...

- 1) крупные по размеру многоклеточные структуры, не содержащие органелл
- 2) небольшие клетки с цитоплазматической ДНК, характеризующиеся отсутствием органелл
- 3) небольшие клетки, окруженные ригидной клеточной стенкой, характеризующиеся отсутствием органелл и наличием ДНК в цитоплазме

15. Отличительные особенности эукариотической клетки:

- 1) большой размер
- 2) отсутствие ядра
- 3) ригидная клеточная стенка
- 4) отсутствие субклеточных органелл
- 5) хромосомная ДНК в цитоплазме

16. Эукариоты – это ...

- 1) крупные по размеру многоклеточные структуры, содержащие органеллы и хромосомную ДНК
- 2) небольшие клетки с хромосомной ДНК, характеризующиеся отсутствием органелл
- 3) небольшие клетки, окруженные ригидной клеточной стенкой, характеризующиеся отсутствием органелл и наличием хромосомной ДНК
- 4) небольшие клетки, окруженные мембраной из фосфолипидных и белковых слоев, имеющие ядро с хромосомной ДНК и окруженные мембранами оболочки

17. Химический метод иммобилизации ферментов:

- 1) образование ковалентных связей между носителем и ферментом
- 2) включение фермента в микрокапсулы
- 3) включение фермента в волокна полимера.

18. Что находится на поверхности лунки в "сэндвич" методе ИФА?

- 1) антитела
- 2) антигены
- 3) специальные молекулы-зонды.

19. Для иммуноглобулина класса Е справедливы следующие положения:

- 1) это мономер, который имеет 2 антигенсвязывающих центра;
- 2) содержание в сыворотке крови – примерно 0,00025 г/л;
- 3) это пентамер, который имеет 10 антигенсвязывающих центров;
- 4) обладает выраженной цитотоксичностью – тропностью к тучным клеткам и базофилам;
- 5) участвует в развитии гиперчувствительности немедленного типа – реакция I типа;
- 6) обнаружение требует применения высокочувствительных методов диагностики
- 7) справедливы все утверждения.

20. Антигенами являются:

- 1) вещества или тела, несущие признаки чужеродной генетической информации;
- 2) все вещества организма;
- 3) высокомолекулярные соединения.

21. Основными свойствами антител являются:

- 1) специфичность;
- 2) гетерогенность;
- 3) чужеродность.

22. Иммуноблоттинг представляет собой:

- 1) высокочувствительный метод диагностики инфекционных заболеваний;
- 2) метод, основанный на сочетании электрофореза и ИФА;
- 3) метод, основанный на сочетании двойной иммунодиффузии и РИФ;
- 4) метод, основанный на сочетании электрофореза и РИА;
- 5) диагностический метод при ВИЧ инфекции.

23. Выберите недостаток(и) принципа de novo design.

- 1) тенденция к предсказанию ложных активных молекул
- 2) потребность в мощных компьютерах
- 3) не учитываются правила АРМЭТ
- 4) сложность реального синтеза генерируемых структур

24. Формально дескрипторы делят на 2 типа индексов, это:

- 1) *индексы растворимости*
- 2) *индексы электронной структуры*
- 3) *индексы хиральности*
- 4) *энергетические индексы*

25. Процедура комбинаторного синтеза, благодаря которой за один раз можно получить до 200 различных производных с одинаковой структурной матрицей (была разработана для пептидов)

- 1) *процедура T-bags*
- 2) *процедура сочетания*
- 3) *пакетики Хоугтена*
- 4) *сплит-метод.*

26. Константы Гаммета характеризуют

- а) *вклад заместителя в биологическую активность молекулы,*
- б) *особенности электронных эффектов заместителей,*
- в) *объем заместителя,*
- г) *способность заместителя влиять на остальную молекулу через пространство.*

27. Под понятием «фармакофор» в 3D QSAR понимают

- а) *совокупность структурных фрагментов молекулы, не влияющих на ее избирательную биологическую активность,*
- б) *универсальный структурный фрагмент, введение которого обеспечивает наличие у полученного соединения высокой биологической активности,*
- в) *набор пространственных и электронных признаков, необходимых для обеспечения оптимальных супрамолекулярных взаимодействий со специфической биологической мишенью,*
- г) *структурные фрагменты молекулы, которые непосредственно не определяют ее биологическую активность, но оказывают влияние на ее величину.*

28. На первой фазе метаболизма на цитохроме СYP450 может происходить

- а) *дезаминирование,*
- б) *гидроксилирование ароматического цикла,*
- в) *дезалкилирование,*
- г) *восстановление нитрогруппы до аминогруппы.*

29. Основные 4 «мишени» лекарственных средств:

- 1) *структурные белки*
- 2) *специфические рецепторы*
- 3) *транспортные системы*
- 4) *ферменты*
- 5) *ионные каналы*
- 6) *гармоны*

30. Выберите отличия направленной библиотеки от свободной:

- 1) *общее химическое ядро – начальный scaffold*
- 2) *ограниченное количество структурно подобных билдинг блоков*
- 3) *множество целей*
- 4) *высокое разнообразие билдинг блоков*
- 5) *создание структуры-лидера*
- 6) *оптимизация структуры-лидера*
- 7) *содержит более 5000 соединений*
- 8) *содержит менее 5000 соединений*

2) заданий, предусматривающих короткий ответ.

Пример заданий с указанием правильного ответа, по различным разделам дисциплины

1. Дайте расшифровку аббревиатуре ADME. Какой параметр не учтен в предложенном сокращении.

Ответ: **абсорбция, распределение, метаболизм, экскреция. Не учтена токсичность (АРМЭТ)**

2. Сформулируйте правило Липинского.

Ответ: **правила Липински предупреждают о возможных проблемах с применением соединений – будущих лекарств, у которых соблюдаются хотя бы два условия: 1) Молекулярная масса > 500; 2) Число акцепторов водородной связи > 10; 3) Число доноров водородной связи > 5; 4) Расчетное значение $\log P > 5$; 5) Число нетерминальных (вращающихся) связей > 10. Соблюдение условий правил Липински позволяет говорить о том, что рассматриваемое вещество является “подобным лекарству” (“drug-like”).**

3. В компьютерном дизайне БАВ с учетом концепции взаимосвязи структура-свойство можно выделить 4 главные стадии:

Ответ: **формирование обучающей выборки соединений с заданным свойством или их набором; описание молекулярной структуры соединений вборки; установление взаимосвязи структура-активность; формирование устойчивой прогностической модели)**

4. – базовая молекула (кор, ядро, остов), модифицированная некоторыми структурными фрагментами, присутствие которых может определять наличие или высокий уровень заданного вида биоактивности.

Ответ: **скаффолд**

5. – это молекулярный фрагмент, ковалентно связанный с твердой подложкой. Он содержит реакционноспособные функциональные группы, с которыми взаимодействует первый реагент и который в результате становится связанным со смолой.

Ответ: **линкер**

6. Многие комбинаторные библиотеки создают путём последовательной дериватизации исходного билдинг-блока, который еще называется „.....“

Ответ: **темплейт**

7. Скрининг возможного взаимодействия молекулы лекарственного препарата с таргетным белком, оценивая силу и природу связывания, можно провести при помощи

Ответ: **молекулярного докинга**

8. - метод поиска биологически активных веществ путём массового синтеза серий аналогичных соединений с различными заместителями и их массового скрининга.

Ответ: **комбинаторная химия**

9. – параметр, характеризующий структуру органического соединения, причём так, что подмечаются какие-то определенные особенности этой структуры. В принципе дескриптором может являться любое число, которое можно рассчитать из структурной формулы химического соединения – молекулярный вес, число атомов определенного типа (гибридизации), связей или групп, молекулярный объём, частичные заряды на атомах и т. д.

Ответ: **дескриптор**

10. Под термином «полимерные наночастицы» понимают два морфологически различных вида частиц:

Ответ: **наносферы и нанокапсулы**

3) защиты индивидуальных проектов - рефератов

В качестве индивидуального проекта студентам предлагается следующее задание:

- *Выбор заболевания и ключевой мишени, ответственной за ее развитие.*
- *Анализ литературных данных и выявление соединений, используемых сейчас для лечения выбранной болезни, а также перспективных соединений прошедших доклинические или находящиеся на стадии клинических испытаний.*
- *Выбрать структуры, синтезируемые в процессе подготовки магистерской диссертации, наиболее близкие к найденным в литературных источниках.*
- *Провести анализ *in silico* данного соединения (или серии соединений) при помощи различных программных комплексов (например PASS) и оценить возможность проявления биоактивности/токсичности к требуемой мишени.*
- *Предложить варианты структурной модификации соединения, позволяющих достигнуть максимальной активности.*

4) устных опросов и решения ситуационных задач.

В ходе устного опроса на практических и лабораторных занятиях задаются вопросы по изученным разделам. Процедура проходит в формате беседы.

Так же опрос может содержать практикоориентированные (ситуационные) задачи.

Пример ситуационных задач

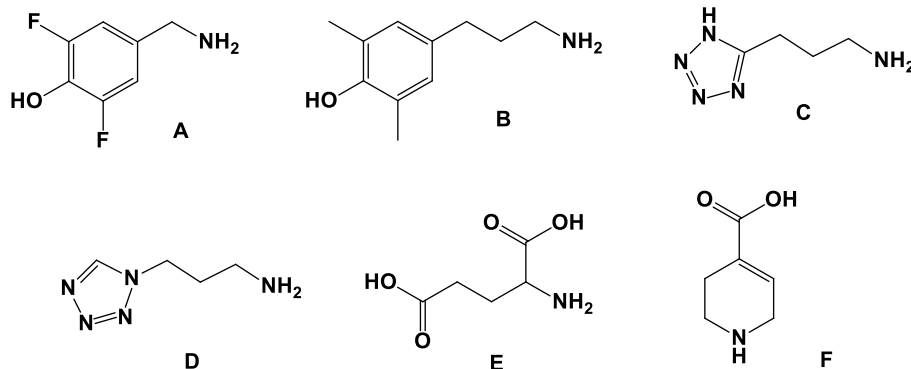
1. Основным эндогенным тормозным медиатором в центральной нервной системе животных и человека (веществом с «успокаивающим» действием) является гамма-аминомасляная кислота (ГАМК). Она присутствует практически во всех нервных клетках. В настоящее время проводится интенсивный поиск веществ, способных заменить ГАМК. Одним из подходов в таких исследованиях является поиск биоизостерных аналогов ГАМК.

1.1.1. Приведите структурную формулу гамма-аминомасляной кислоты.

1.1.2. Ниже приведены шесть структур, три из них представляют собой биоизостеры по отношению к ГАМК. Укажите, какие именно и обоснуйте свой выбор. Какие свойства выбранных Вами молекул определяют их биоизостерность по отношению к ГАМК?

1.1.3. Почему оставшиеся три структуры не являются биоизостерами по отношению к гамма-аминомасляной кислоте?

1.1.4. Как влияют заместители в бензольных кольцах структур А и В на кислотно-основные свойства молекул?



Ответ:

Биоизостерными по отношению к гамма-аминомасляной кислоте являются структуры А, С и F

Структура А представляет собой биоизостерный аналог ГАМК, поскольку амино-группа и фенольный гидроксил находятся на расстоянии, подобном расстоянию между амино-группой и карбоксилем в ГАМК. Кроме того, 2,6-дифторфенол обладает свойствами сильной кислоты, подобной карбоновым кислотам.

Структура С - биоизостер ГАМК. Такой тетразол - довольно сильная кислота.

Структура F - изогувацин - биоизостер ГАМК. Является сильным агонистом ГАМКрецепторов. Расстояние между функциональными группами и их кислотно-основные свойства в ГАМК и изогувацине практически одинаковые. Изогувацин представляет собой так называемый 'конформационно закрепленный' аналог ГАМК

Остальные – не биоизостеры.

Структура В. Различаются расстояния между функциональными группами. Кроме того, 2,6-диметилфенол значительно уступает по кислотности карбоновым кислотам.

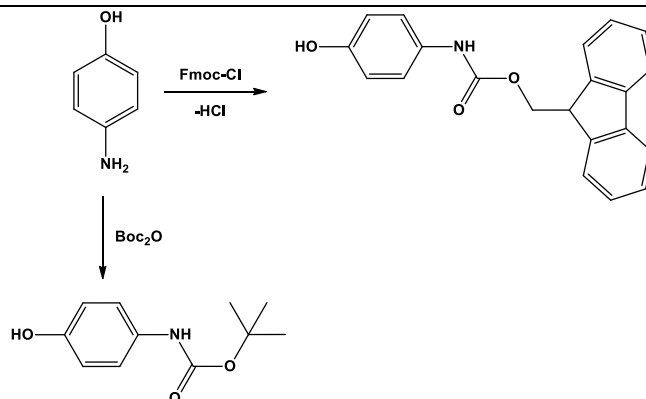
Структура D. Такой тетразол совершенно лишен кислотных свойств.

Структура E - глутаминовая кислота. Очень сильно различаются основности аминогрупп в этих аминокислотах. Более того, глутаминовая кислота играет в организме роль, противоположную ГАМК. ГАМК - основной эндогенный центральный тормозной медиатор. Глутаминовая кислота является возбуждающим нейромедиатором. 4. Атомы фтора обладают отрицательным индуктивным эффектом, а метильные группы положительным, следовательно в соединении В кислотность фенольной группы будет понижена (более слабая кислота), по сравнению с фенолом, а в соединении А повышена (более сильная кислота).

2. Предложите и подробно объясните способ твердофазного синтеза парацетамола. Укажите процесс прикрепления реагента/ов к поверхности выбранного полимера в качестве подложки. В качестве исходного реагента, который будет прикреплен к полимеру, может быть выбран на ваше усмотрение. Помните, что в конце – целевой продукт должен быть эффективно снят с подложки.

Ответ:

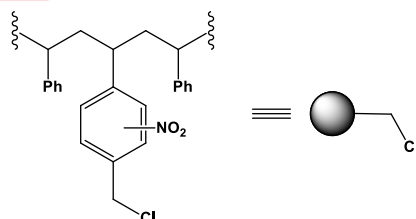
В качестве исходного реагента использовали 4-аминофенол.



Вос-защита устойчива при pH = 4-12, к действию многих нуклеофильных реагентов, например, NaBH_4 , DIBAL-H, LiAlH_4 при $t < 0^\circ\text{C}$.

Вос-защита разрушается при pH < 1, при действии RLi и RMgX, при окислении по Джонсу, при действии LiAlH_4 (медленно при $t > 0^\circ\text{C}$), а также легко разрушается при действии CF_3COOH и HCOOH

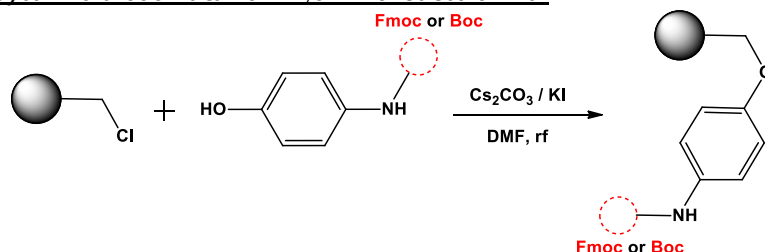
Fmoc используется в качестве временной защиты аминогруппы при соединении аминокислот для формирования пептидной цепочки. Она стабильна в кислой среде, но отщепляется основаниями, например, пиперидином, морфолином и другими. В процессе твердофазного пептидного синтеза Fmoc-защиту удаляют щелочным реагентом. Устойчива к кислым средам.



смола Меррифильда (самый распространенный и доступный тип полимерного носителя)

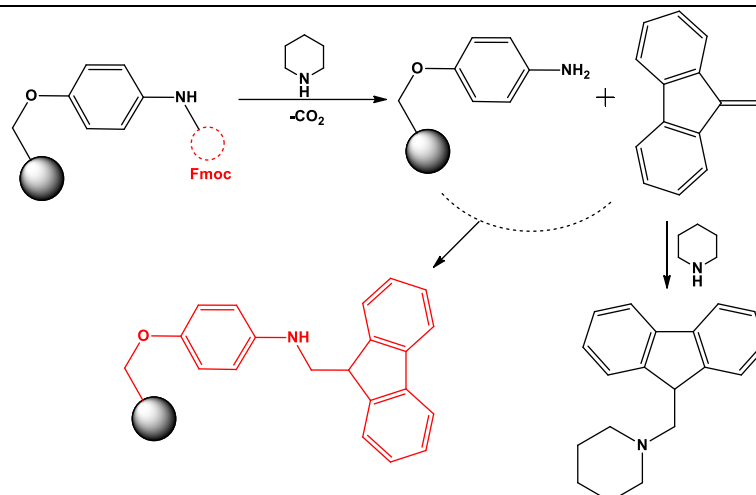
Введение защитной группы, скорее всего, усиливает смещение электронной плотности в сторону амидной компоненты. Что закономерно повышает подвижность атомов водорода фенольного гидроксила и способствует более легкому протеканию реакций нуклеофильного замещения (для иммобилизации). Однако, принимая во внимание устойчивость защитных групп, мы считаем что реакцию все же стоит проводить в щелочной среде, через образования фенолята. Для этого часто используют карбонаты, а не чистую щелочь, в частности – карбонат цезия или калия.

Реакцию проводят при добавлении суспензии карбоната в диметилфталате (чаще всего) и каталитических количеств йодида калия. Избыток реагентов по отношению к количеству носителя выбирается в каждом случае индивидуально и составляет 1,5—4 эквивалента.

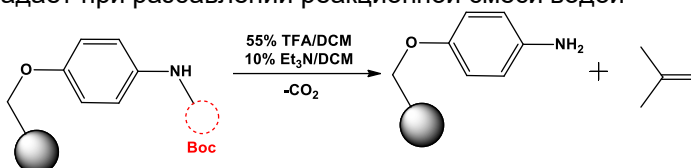


Далее, предполагаем, стадию снятия защиты с аминогруппы.

В зависимости от типа защиты, возможны следующие механизмы:

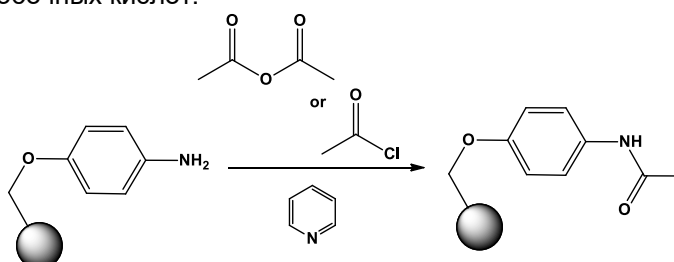


Фмос-защиту иммобилизованного аминофенола с носителя Меррифильда можно удалить 20%-ным раствором пиперидина в DMF. Промежуточно образующийся дибензофульвен быстро реагирует с присутствующим в избытке пиперидином с образованием 1-(9'-флуоренилметил)пиперидина, который нерастворим в воде и выпадает при разбавлении реакционной смеси водой

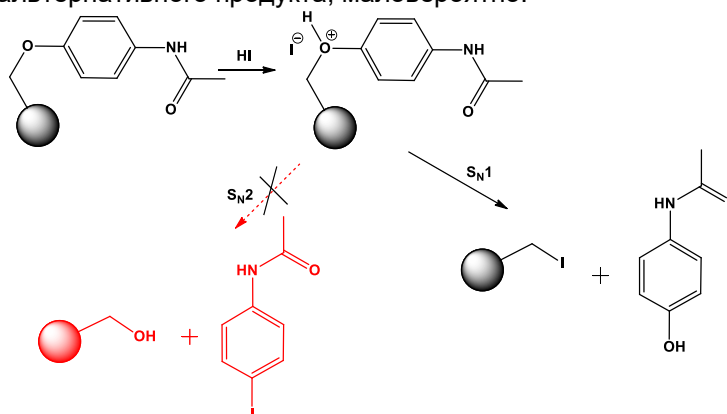


Смолу с иммобилизованным аминофенолом обрабатывают 55%-го раствором трифторуксусной кислоты (TFA) в дихлорметане (DCM). Выделяется газ. Смолу промывают раствором триэтиламина для удаления остатков угольной кислоты.

Далее проводят классическую реакцию ацилирования вводя в процесс либо хлорангидрид уксусной кислоты, либо уксусный ангидрид. Реакцию для удобства, лучше проводить в среде пиридина, для удаления образующихся побочных кислот.



Итоговым процессом является снятие готовой молекулы с полимерного носителя. Для этого оптимальным способом является расщепление простой эфирной связи под действием водного раствора йодоводородной кислоты или фтороводорода. Данный процесс протекает по механизму S_N1. Побочное протекание реакции по S_N2, с образованием альтернативного продукта, маловероятно.



Описание технологии проведения

Текущая аттестация по дисциплине «Основы медицинской химии» включает в себя теоретические задания, позволяющие оценить уровень усвоения обучающимися знаний, и практические задания, выявляющие степень сформированности умений и владений.

Усвоенные знания проверяются в ходе устного опроса и тестирования, умения и владения проверяются при решении практикоориентированных задач, предлагаемых во время устного опроса.

Тестирования проводятся по соответствующим КИМам в посменном виде. Каждый КИМ содержит от 15 до 20 вопросов с выбором одного или нескольких правильных ответов, а также 5 вопросов, предполагающих краткий ответ. Время проведения тестирования, в зависимости от раздела, определяется преподавателем.

Для обобщенной оценки усвоенных знаний, а также способности применять практические навыки и умения, в конце семестра, проводится защита индивидуальных проектов - рефератов. Защита индивидуальных проектов заключается в:

- устном выступлении магистранта;
- подготовке сопроводительного визуального материала;
- ответах магистранта на предложенные вопросы.

Требования к выполнению заданий (или шкалы и критерии оценивания)

Текущая аттестация проводится в соответствии с Положением о текущей аттестации обучающихся по программам высшего образования Воронежского государственного университета.

Оценка результатов обучения на текущей аттестации происходит по следующим показателям:

- знание учебного материала и владение навыками работы с учебной/научной литературой, понятийным аппаратом медицинской химии;
- знание основных теоретических положений органической, биоорганической и химии природных соединений;
- знание теоретических и методологических основ традиционных и новых разделов химии при решении конкретных задач, связанных с разработкой и использованием лекарственных средств;
- знание проблематики новых разделов химии и смежных естественнонаучных дисциплин и способов их развития при решении конкретных задач медицинской химии;
- умение определять необходимость привлечения дополнительных знаний из новых разделов химии и естественнонаучных дисциплин для решения профессиональных задач в области медицинской химии;
- умение связывать теорию с практикой на основе экспериментальных результатов, полученных при выполнении научной работы;
- умение применять полученные теоретические знания для самостоятельного освоения специальных разделов химии и естественнонаучных дисциплин, необходимых в профессиональной деятельности;
- владение навыками использования теоретических основ традиционных и новых разделов химии и естественнонаучных дисциплин при решении конкретных химических задач;
- умение иллюстрировать ответ примерами.

Для оценивания результатов обучения на экзамене используется 4-балльная шкала: «отлично», «хорошо», «удовлетворительно», «неудовлетворительно».

Критерии оценивания компетенций	Уровень сформированности компетенций	Шкала оценок
Полное соответствие ответа обучающегося всем перечисленным критериям. Обучающийся в полной мере владеет понятийным аппаратом медицинской химии, способен иллюстрировать ответ примерами. Он правильно и полно описывает химические свойства веществ и взаимосвязь физиологической активности со структурой, отвечает на дополнительные вопросы	Повышенный уровень	Отлично

Ответ на контрольно-измерительный материал не соответствует одному (двум) из перечисленных показателей, но обучающийся дает правильные ответы на дополнительные вопросы. Недостаточно продемонстрировано знание основных классов органических соединений, их строения, способов получения, физических и химических свойств.	Базовый уровень	Хорошо
Ответ на контрольно-измерительный материал не соответствует любым двум (трем) из перечисленных показателей, обучающийся дает неполные ответы на дополнительные вопросы. Демонстрирует частичные знания по пройденному материалу.	Пороговый уровень	Удовлетворительно
Ответ на контрольно-измерительный материал не соответствует перечисленным показателям. Обучающийся демонстрирует отрывочные, фрагментарные знания, допускает грубые ошибки и не отвечает на дополнительные вопросы.	–	Неудовлетворительно

Оценочные средства для инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья выбираются с учетом их индивидуальных психофизических особенностей.

– при необходимости инвалидам и лицам с ограниченными возможностями здоровья предоставляется дополнительное время для подготовки ответа во время текущего контроля;

– при проведении процедуры оценивания результатов обучения инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья предусматривается использование технических средств, необходимых им в связи с их индивидуальными особенностями;

– при необходимости для обучающихся с ограниченными возможностями здоровья и инвалидов процедура оценивания результатов обучения по дисциплине может проводиться в несколько этапов.

Процедура оценивания результатов обучения инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья по дисциплине (модулю) предусматривает предоставление информации в формах, адаптированных к ограничениям их здоровья и восприятия информации:

Для лиц с нарушениями зрения:

- в печатной форме увеличенным шрифтом,
- в форме электронного документа.

Для лиц с нарушениями слуха:

- в печатной форме,
- в форме электронного документа.

Для лиц с нарушениями опорно-двигательного аппарата:

- в печатной форме,
- в форме электронного документа.

Данный перечень, может быть, конкретизирован в зависимости от контингента обучающихся.

20.2. Промежуточная аттестация

Промежуточная аттестация по дисциплине осуществляется с помощью следующих оценочных средств: в формате собеседования на экзамене, по билетам (КИМ).

КИМ содержит два вопроса и формируется по следующему принципу: первый вопрос посвящен основным понятиям молекулярной и клеточной биологии, биохимии и фармакологии, второй – содержит вопрос по комбинаторной химии, компьютерному моделированию и биоиспытаниям потенциальных лекарственных веществ.

№	Примерный перечень вопросов
1.	Основной предмет медицинской химии. Причины смертности. Современная фарминдустрия в РФ. Классификация лекарственных средств. Общая схема разработки нового ЛП.
2.	Основы цитологии.
3.	Биомембраны. Внутриклеточный транспорт.
4.	Белки и нуклеиновые кислоты: особенности строения и объекты для ЛП.
5.	Основы энзимологии.
6.	Рецепторы, как мишени для ФАВ. Виды мишеней для ФАВ. Основные принципы их работы.
7.	Зависимость доза-эффект для ЛП. Действие сверхмалых доз БАВ.
8.	Кинетика взаимодействия ЛП-Рецептор.
9.	Основные теории рецепции.

10.	Системы передачи рецепторного сигнала и вторичные посредники.
11.	Антитела и антигенраспознающие рецепторы.
12.	Фармакодинамика.
13.	Фармакокинетика. Основные понятия. Виды транспорта ЛВ. Транспортные системы крови.
14.	Способы введения ЛП и их распределение. Гистогематические барьеры.
15.	Депонирование ЛП.
16.	Биотрансформация
17.	Выведение ЛВ из организма
18.	Математическое моделирование фармакокинетических процессов: основные понятия, фармакокинетические кривые, однокамерные и двухкамерные модели, клиренс, экскреция, перфузионные модели.
19.	Связь ф/х свойств и биологической активности. Правило Липинского. Показатели АРМЭТ. Представление о количественных характеристиках биологической активности.
20.	Выбор стратегий исследований при создании новых ЛС. Соединение-лидер и оценка его качества. Методы усовершенствования структуры-лидера. Биодоступность.
21.	Комбинаторный синтез: одностадийные, двухстадийные, тандемные, параллельные и многостадийные синтезы. Метод чайных пакетиков. Твердофазный синтез. Ретросинтез.
22.	Линкеры. Дискрипторы. Якорные группы.
23.	Регрессионные модели биоактивности органических молекул.
24.	Пролекарства и антиметаболиты.
25.	Структурные мотивы в эмперическом дизайне ЛВ.
26.	Изостеры и биоизостеры.
27.	Качественная зависимость строение – биоактивность (ЗАС, SAR).
28.	Основы компьютерного дизайна лекарственных препаратов кластерным статистическим анализом
29.	Первичный анализ in silico и используемые программные комплексы. Особенности их работы. Компьютерный анализ КЗАС (QSAR). Виртуальные библиотеки.
30.	Виртуальный скрининг. Принцип докинга лекарственного препарата к белковой биомишени. Дизайн фармакофоров.
31.	Полимерные материалы в аспектах медицинской химии. Пролонгаторы ЛП. Нанотехнологии в дизайне устройств для защиты и доставки нанолечарств

Пример билета (КИМ)::

УТВЕРЖДАЮ

Заведующий кафедрой _____

_____. _____. 20__

Направление подготовки / специальность 04.04.01. Химия

Дисциплина Основы медицинской химии

Курс 1

Форма обучения очная

Вид аттестации промежуточная

Вид контроля экзамен

Контрольно-измерительный материал № 1

1. Рецепторы, как мишени для физиологически активных веществ. Виды рецепторов.

2. Виртуальный скрининг. Принцип молекулярного докинга лекарственного препарата к белковой биомишени.

Преподаватель _____

Описание технологии проведения

Промежуточная аттестация студентов является основной формой контроля аудиторной работы студентов и проводится с целью установления уровня и качества подготовки студентов ФГОС 3++ и определяет:

- полноту и прочность теоретических знаний;
- сформированность умений применять теоретические знания при решении практических и профессиональных задач;
- сформированность профессиональных компетенций.

Подготовка к промежуточной аттестации является формой самостоятельной работы студентов. При этом обучающийся должен использовать рекомендованный рабочей программой перечень основной и дополнительной литературы, материалы лекций, информационные и электронно-образовательные ресурсы. Для подготовки к промежуточной аттестации студент также может использовать перечень вопросов, вынесенных на экзамен, позволяющий оценить уровень сформированности профессиональных компетенций по дисциплине «Основы медицинской химии».

Промежуточная аттестация проводится в устной (или письменной) форме. Преподаватель, проводящий промежуточную аттестацию, имеет право задавать студентам дополнительные вопросы по всему разделу программы учебной дисциплины. Время проведения экзамена устанавливается нормами времени. Результат сдачи промежуточной аттестации заносится преподавателем в зачетно-экзаменационную ведомость и зачетную книжку.

Требования к выполнению заданий, шкалы и критерии оценивания

Промежуточная аттестация проводится в соответствии с Положением о промежуточной аттестации обучающихся по программам высшего образования.

Оценка результатов обучения на промежуточной аттестации происходит по следующим показателям:

- знание учебного материала и владение навыками работы с учебной/научной литературой, понятийным аппаратом медицинской химии;
- знание основных теоретических положений органической, биорганической и химии природных соединений;
- знание теоретических и методологических основ традиционных и новых разделов химии при решении конкретных задач, связанных с разработкой и использованием лекарственных средств;
- знание проблематики новых разделов химии и смежных естественнонаучных дисциплин и способов их развития при решении конкретных задач медицинской химии;
- умение определять необходимость привлечения дополнительных знаний из новых разделов химии и естественнонаучных дисциплин для решения профессиональных задач в области медицинской химии;
- умение связывать теорию с практикой на основе экспериментальных результатов, полученных при выполнении научной работы;
- умение применять полученные теоретические знания для самостоятельного освоения специальных разделов химии и естественнонаучных дисциплин, необходимых в профессиональной деятельности;
- владение навыками использования теоретических основ традиционных и новых разделов химии и естественнонаучных дисциплин при решении конкретных химических задач;
- умение иллюстрировать ответ примерами.

По результатам всех выполненных заданий текущего контроля студентам может быть выставлен экзамен автоматом:

средняя оценка 3-3,75 – «удовлетворительно»,
3,75-4,5 – «хорошо»,
4,5-5 – «отлично».

Для оценивания результатов обучения на экзамене используется 4-балльная шкала: «отлично», «хорошо», «удовлетворительно», «неудовлетворительно».

Критерии оценивания компетенций	Уровень сформированности компетенций	Шкала оценок
Полное соответствие ответа обучающегося всем перечисленным критериям. Обучающийся в полной мере владеет понятийным аппаратом медицинской химии, способен иллюстрировать ответ примерами. Он правильно и полно описывает химические свойства веществ и взаимосвязь физиологической активности со структурой, отвечает на дополнительные вопросы	Повышенный уровень	Отлично
Ответ на контрольно-измерительный материал не соответствует одному (двум) из перечисленных показателей, но обучающийся дает правильные ответы на дополнительные вопросы. Недостаточно продемонстрировано знание основных классов органических соединений, их строения, способов получения, физических и химических свойств.	Базовый уровень	Хорошо
Ответ на контрольно-измерительный материал не соответствует любым двум (трем) из перечисленных показателей, обучающийся дает неполные ответы на дополнительные вопросы. Демонстрирует частичные знания по пройденному материалу.	Пороговый уровень	Удовлетворительно
Ответ на контрольно-измерительный материал не соответствует перечисленным показателям. Обучающийся демонстрирует отрывочные, фрагментарные знания, допускает грубые ошибки и не отвечает на дополнительные вопросы.	–	Неудовлетворительно

Оценочные средства для инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья выбираются с учетом их индивидуальных психофизических особенностей.

– при необходимости инвалидам и лицам с ограниченными возможностями здоровья предоставляется дополнительное время для подготовки ответа на экзамене;

– при проведении процедуры оценивания результатов обучения инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья предусматривается использование технических средств, необходимых им в связи с их индивидуальными особенностями;

– при необходимости для обучающихся с ограниченными возможностями здоровья и инвалидов процедура оценивания результатов обучения по дисциплине может проводиться в несколько этапов.

Процедура оценивания результатов обучения инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья по дисциплине (модулю) предусматривает предоставление информации в формах, адаптированных к ограничениям их здоровья и восприятия информации:

Для лиц с нарушениями зрения:

- в печатной форме увеличенным шрифтом,
- в форме электронного документа.

Для лиц с нарушениями слуха:

- в печатной форме,
- в форме электронного документа.

Для лиц с нарушениями опорно-двигательного аппарата:

- в печатной форме,
- в форме электронного документа.

Данный перечень, может быть, конкретизирован в зависимости от контингента обучающихся.