

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

УТВЕРЖДАЮ

Заведующий кафедрой
высокомолекулярных соединений и
коллоидной химии

А.С. Шестаков

30.04.2020 г.

РАБОЧАЯ ПРОГРАММА УЧЕБНОЙ ДИСЦИПЛИНЫ
Б1.В.09 Синтез и анализ новых физиологически активных веществ

1. Код и наименование направления подготовки/специальности: 04.03.01. "Химия"
2. Профиль подготовки/специализация: прикладная химия
3. Квалификация выпускника: бакалавр
4. Форма обучения: очная
5. Кафедра, отвечающая за реализацию дисциплины:
1005 кафедра высокомолекулярных соединений и коллоидной химии
6. Составители программы:
Вандышев Дмитрий Юрьевич, к.х.н., доцент
7. Рекомендована: НМС химического факультета, 19.03.2020, протокол № 3
8. Учебный год: 2023-2024 Семестр(ы)/Триместр(ы): 8

9. Цели и задачи учебной дисциплины

Целями освоения учебной дисциплины являются:

- дать студенту представление об основных классах физиологически активных веществ, методах их синтеза и анализа, взаимосвязи между их структурой и физиологической активностью;

- дать представление об основных способах нахождения у веществ физиологической активности;

- сформировать системные знания, умения, навыки по разработке и изготовлению физиологически активных веществ.

Задачи учебной дисциплины:

- изучение теоретических основ, приобретение профессиональных умений и навыков синтеза физиологически активных веществ;

- формирование у студентов представлений о взаимосвязи между структурой и физиологической активностью веществ;

- выработка у студентов способности выбирать адекватные и оптимальные методы установления строения и реакционной способности веществ.

10. Место учебной дисциплины в структуре ООП:

Курс входит в блок Б1, часть, формируемую участниками образовательных отношений. Студент для изучения курса должен освоить курсы органической, аналитической химии, биологии с основами экологии, теоретических основ и экспериментальной химии биологически активных соединений, спектральных методов установления структуры органических соединений. Студент должен иметь представления о механизмах органических реакций, иметь представление об основных классах неорганических и органических веществ и их реакционной способности. Дисциплина является параллельной для курсов Б1.О.16 Химическая технология.

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
ПКВ-1	Способен осуществлять контроль качества сырья, компонентов и выпускаемой продукции химического назначения, проводить паспортизацию товарной продукции	ПКВ-1.1	Выполняет стандартные операции на высокотехнологическом оборудовании для характеристики сырья, промежуточной и конечной продукции химического производства	Знать: - стандартные методы получения, идентификации и исследования свойств веществ и материалов, правила обработки и оформления результатов работы, нормы ТБ; - методы планирования эксперимента. Уметь: - источники научно-технической информации, журналы отечественной и международной научной периодики, основы поиска патентной информации;
		ПКВ-1.2	Составляет протоколы испытаний, паспорта химической продукции, отчеты о выполненной работе по заданной форме	Уметь: - организация и практическое проведение мероприятий по стандартизации веществ и материалов (сбор, анализ и обработка научно-технической информации, необходимой для решения задач, поставленных специалистом более высокой квалификации); Владеть: - навыками планирования и проведения химического эксперимента, оформления его результатов; - навыками сбора, анализа и обработки научно-технической информации, приемами метрологического обеспечения

				мероприятий по стандартизации веществ и материалов.
ПКВ-2	Способен выбирать технические средства и методы испытаний объектов неорганической химии для решения технологических задач, поставленных специалистом более высокой квалификации	ПКВ-2.1	Планирует отдельные стадии исследования при наличии общего плана НИОКР	Знать: - методы синтеза органических соединений, техники безопасности при проведении синтетических работ; - способы выделения и очистки органических веществ; - методы обработки и анализа первичного экспериментального материала по синтезу органических веществ; Уметь: - проводить простые химические опыты по предлагаемым методикам; - проводить многостадийный синтез; - обрабатывать результаты эксперимента; - планировать эксперимент на основе анализа литературных данных; - анализировать и обобщать результаты эксперимента, формулировать выводы. - планировать и осуществлять синтез неорганических и органических соединений; - планировать комплекс методов для выделения интересующего компонента из смеси органических соединений, определять чистоту органических соединений; - использовать на практике современные методы физико-химического анализа для установления состава и структуры органических соединений. Владеть: - техникой лабораторных работ, приемами синтеза органических соединений; - базовыми приемами работы со стандартным и специализированным лабораторным оборудованием для синтеза органических веществ; - техникой воспроизведения стандартных методик синтеза органических соединений; - базовыми навыками использования современной аппаратуры и обработки данных при проведении научных исследований.
		ПКВ-2.2	Готовит элементы документации, проекты планов и программ отдельных этапов НИОКР	
		ПКВ-2.3	Выбирает технические средства и методы испытаний (из набора имеющихся) для решения поставленных задач НИОКР	
		ПКВ-2.4	Готовит объекты исследования	

12. Объем дисциплины в зачетных единицах/час. — 3/108.

Форма промежуточной аттестации зачет с оценкой

13. Трудоемкость по видам учебной работы

Вид учебной работы		Трудоемкость		
		Всего	По семестрам	
			8 семестр	№ семестра
Аудиторные занятия		72	72	
в том числе:	лекции	36	36	
	практические	36	36	
	лабораторные	-	-	
Самостоятельная работа		36	36	
в том числе: курсовая работа (проект)		-	-	
Форма промежуточной аттестации (экзамен – 36 час.)		-	-	
Итого:		108	108	

13.1. Содержание дисциплины

№ п/п	Наименование раздела дисциплины	Содержание раздела дисциплины	Реализация раздела дисциплины с помощью онлайн-курса, ЭУМК*
1. Лекции			
1.1	Введение в химию физиологически активных веществ. Основные понятия, объекты и сырьевая база.	Классификация и области применения физиологически активных веществ. Природные источники ФАВ. Классификация природных соединений по действию, структурным и таксонометрическим признакам. Биополимеры.	ЭУМК «Синтез и анализ новых физиологическ и активных веществ» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=25833
1.2	Конструирование ФАВ	Современные требования к лекарственным препаратам. Стратегия создания и выбор мишени. Программные комплексы для оптимизаций процессов поиска.	ЭУМК «Синтез и анализ новых физиологическ и активных веществ» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=25833
1.3	Синтез и анализ ФАВ	Синтез и анализ ЛВ алифатического, алициклического, ароматического и гетероциклического рядов. Технологическое сопровождение процессов.	ЭУМК «Синтез и анализ новых физиологическ и активных веществ» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=25833
1.4	Особенности организации химико-технологического процесса синтеза ФАВ	Критерии эффективности организации химико-технологического процесса. Математическое моделирование. Основные направления совершенствования процесса синтеза ФАВ. Выбор схем синтеза ФАВ.	ЭУМК «Синтез и анализ новых физиологическ и активных веществ» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=25833
1.5	Биотехнологии, как способ получения ФАВ	Физиологически активные вещества, получаемые биотехнологическими методами. Разновидности биотехнологии. Преимущество биотехнологий. Биообъекты. Типовая схема биотехнологического производства. Основные стадии процесса, цели и задачи каждой стадии. Особенности типовой схемы производства целевых продуктов при получении отдельных видов ФАВ.	ЭУМК «Синтез и анализ новых физиологическ и активных веществ» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=25833
2. Практические занятия			
2.1	Введение в химию физиологически активных веществ. Основные понятия, объекты и сырьевая база.	Классификация и области применения физиологически активных веществ. Природные источники ФАВ. Классификация природных соединений по действию, структурным и таксонометрическим признакам. Биополимеры.	
2.2	Конструирование ФАВ	Понятие мишени для ФАВ. Типы мишеней. Методы комбинаторной химии. Принципы работы с программными комплексами для поиска новых ФАВ, оценки их активности.	
2.3	Синтез и анализ ФАВ	Физико-химические методы анализа органических и неорганических ФАВ. Фармакопейный анализ.	
2.4	Особенности организации химико-технологического процесса синтеза ФАВ	Критерии эффективности организации химико-технологического процесса. Математическое моделирование. Основные направления	

		совершенствования процесса синтеза ФАВ. Выбор схем синтеза ФАВ.	
2.5	Биотехнологии, как способ получения ФАВ	Физиологически активные вещества, получаемые биотехнологическими методами. Разновидности биотехнологии. Преимущество биотехнологий. Биообъекты. Типовая схема биотехнологического производства. Основные стадии процесса, цели и задачи каждой стадии. Особенности типовой схемы производства целевых продуктов при получении отдельных видов ФАВ.	

13.2. Темы (разделы) дисциплины и виды занятий

№ п/п	Наименование темы (раздела) дисциплины	Виды занятий (количество часов)				
		Лекции	Практические	Лабораторные	Самостоятельная работа	Всего
1	Введение в химию физиологически активных веществ. Основные понятия, объекты и сырьевая база.	4	4	-	4	12
2	Конструирование ФАВ	6	10	-	10	26
3	Синтез и анализ ФАВ	10	10	-	10	30
4	Особенности организации химико-технологического процесса синтеза ФАВ	10	8	-	8	26
5	Биотехнологии, как способ получения ФАВ	6	4	-	4	14
	Итого:	36	36	-	36	108

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 (ПКВ-1, ПКВ-2).

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	Иозеп А.А. Химическая технология лекарственных веществ. Основные процессы химического синтеза биологически активных веществ / А.А. Иозеп, Б.В. Пассет, О.Б. Щенникова, В.Я. Самаренко / - М.: Лань, 2016, - 356 с.
2	Машковский М.Д. Лекарственные средства: пособие для врачей/ М.Д.Машковский. – М: Новая волна, 2005. -1206 с.
3	Государственная фармакопея российской федерации. – 14-е изд. / «Издательство «Научный центр экспертизы средств медицинского применения», 2018. – 704 с.
4	Коротченкова Н.В. Химическая технология витаминов / Н.В. Коротченкова, А.А. Иозеп. — Санкт-Петербурге : Проспект Науки, 2012. — 222
5	Молекулярное моделирование: теория и практика [Электронный ресурс] / Хельтве Х.-Д., Зиппль В., Роньян Д., Фолькерс Г.; пер. с англ. - 5-е изд. - М. : Лаборатория знаний, 2020.

б) дополнительная литература:

№ п/п	Источник
6	Погребняк А .В . Молекулярное моделирование и дизайн биологически активных веществ / А .В . Погребняк. – Ростов-н /Д : Издательство СКН ЦВШ , 2003. – 230 с.
7	Солдатенков, А. Т. Основы органической химии лекарственных веществ / А.Т. Солдатенков, Н.М. Колядина, И.В. Шендрик. ? 2-е изд., испр. и доп. М. : Мир, 2003. 191с
8	Основы дизайна и химии лекарств и их наноформ / А.Т. Солдатенков. - Ханой : Знания, 2014. - 281 с.
9	Сливкин А.И. Фармакопейный анализ / А.И.Сливкин. – Воронеж : ВГУ, 1997. – 305 с.
10	Очерк химии природных соединений / А.А.Семёнов. – Новосибирск : Наука, 2000. – 664 с.
11	Евстигнеева Р.П. Тонкий органический синтез / Р.П.Евстигнеева. - М.:Химия, 1991. – 184 с.
12	Беликов В.Г. Фармацевтическая химия : учебник по фарм. химии для студ. фарм. вузов и фак. / В.Г. Беликов. – Пенза : Пензенский гос. ун-т, 2003. - 713 с.
13	Граник В.Г. Основы медицинской химии/ В.Г.Граник. – М. : Вузовская книга, 2001. – 384 с.
14	Промышленная технология лекарств : учеб. для вузов / В.И. Чуешов [и др.]. – Харьков : НФАУ, 2002. – Т.1. – 560 с.
15	Пассет Б. В. Основные процессы химического синтеза биологически активных веществ / Б.В. Пассет. — М. : ГЭОТАР-МЕД, 2002. — 370 с.

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

№ п/п	Ресурс
16	https://www.lib.vsu.ru — Зональная научная библиотека ВГУ.
17	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).
18	http://window.edu.ru/ - информационная система «Единое окно доступа к образовательным ресурсам».
19	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.
20	http://www.chem.msu.ru/rus/ - Chemnet - официальное электронное издание Химического факультета МГУ в Internet
21	ЭУМК «Синтез и анализ новых физиологически активных веществ» https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=25833

16. Перечень учебно-методического обеспечения для самостоятельной работы

№ п/п	Источник
1	Фармацевтическая химия [Электронный ресурс] : учебно-методическое пособие для вузов : Воронеж. гос. ун-т ; сост.: А.С. Шестаков, О.В. Слепцова, И.В. Останкова .— Электрон. текстовые дан. — Воронеж : Издательский дом ВГУ, 2016 .
2	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.
3	Методы поиска новых лекарственных средств : учебное пособие / сост. Д.В. Крыльский, А.С. Шестаков. – Воронеж, 2006. – 43 с.
4	Иозеп А.А. Химическая технология лекарственных веществ. Основные процессы химического синтеза биологически активных веществ / А.А. Иозеп, Б.В. Пассет , О.Б. Щенникова, В.Я. Самаренко / - М.: Лань, 2016, - 356 с.
5	Биотехнология [Электронный ресурс] : учебное пособие / И. А. Толмачева ; Пермский государственный национальный исследовательский университет. – Электронные данные. – Пермь, 2022. – 4,26 Мб ; 177 с. – Режим доступа: http://www.psu.ru/files/docs/science/books/uchebnie-posobiya/Tolmacheva-Biotekhnologiya.pdf .

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 практические 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» (ЭУМК «Синтез и анализ новых физиологически активных веществ» <https://edu.vsu.ru/course/view.php?id=25833>), 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.

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.	Введение в химию физиологически активных веществ. Основные понятия, объекты и сырьевая база.	ПКВ-1 ПКВ-2	ПКВ-1.1, ПКВ-1.2 ПКВ-2.1, ПКВ-2.2 ПКВ-2.3, ПКВ-2.4	Практические занятия Тестовые задания Домашняя работа

№ п/п	Наименование раздела дисциплины (модуля)	Компетенция(и)	Индикатор(ы) достижения компетенции	Оценочные средства
2.	Конструирование ФАВ	ПКВ-1 ПКВ-2	ПКВ-1.1, ПКВ-1.2 ПКВ-2.1, ПКВ-2.2 ПКВ-2.3, ПКВ-2.4	Практические занятия Тестовые задания Домашняя работа
3.	Синтез и анализ ФАВ	ПКВ-1 ПКВ-2	ПКВ-1.1, ПКВ-1.2 ПКВ-2.1, ПКВ-2.2 ПКВ-2.3, ПКВ-2.4	Практические занятия Тестовые задания Домашняя работа
4.	Особенности организации химико-технологического процесса синтеза ФАВ	ПКВ-1 ПКВ-2	ПКВ-1.1, ПКВ-1.2 ПКВ-2.1, ПКВ-2.2 ПКВ-2.3, ПКВ-2.4	Практические занятия Тестовые задания Домашняя работа
5.	Биотехнологии, как способ получения ФАВ	ПКВ-1 ПКВ-2	ПКВ-1.1, ПКВ-1.2 ПКВ-2.1, ПКВ-2.2 ПКВ-2.3, ПКВ-2.4	Практические занятия Тестовые задания Домашняя работа
Промежуточная аттестация форма контроля – зачет с оценкой				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. Мониторинг (применительно к лекарству):</p> <ol style="list-style-type: none"> 1) введение в организм; 2) выделение; 3) выявление в тканях; 4) слежение за концентрацией. <p>2. Скрининг (лекарств):</p> <ol style="list-style-type: none"> 1) совершенствование путем химической трансформации; 2) совершенствование путем биотрансформации; 3) поиск и отбор («просеивание») природных структур; 4) полный химический синтез. <p>3. Таргет:</p> <ol style="list-style-type: none"> 1) сайт на поверхности клетки; 2) промежуточная мишень внутри клетки; 3) конечная внутриклеточная мишень; 4) функциональная группа макромолекулы. <p>4. Биотехнология – это...</p> <ol style="list-style-type: none"> 1) изучение биологической активности лекарственного растительного сырья 2) использование культур клеток, бактерий, животных, растений, обеспечивающих синтез специфических веществ 3) разработка новых лекарственных форм препаратов с помощью живых систем 4) изучение зависимости «структура-эффект» в действии лекарственных средств 5) синтез новых лекарственных препаратов и изучение их свойств <p>5. Последовательность стадий биотехнологического процесса:</p> <ol style="list-style-type: none"> 1) обработка целевого продукта, обработка сырья, ферментация и биотрансформация 2) биотрансформация, ферментация, обработка сырья и целевого продукта 3) исходная обработка сырья, ферментация, биотрансформация, конечная обработка целевого продукта <p>6. В биотехнологии понятие «биообъект» соответствует следующее определение:</p> <ol style="list-style-type: none"> 1) организм, на котором испытывают новые БАВ 2) организмы, вызывающие микробную контаминацию технологического оборудования 3) фермент, используемый для генно-инженерных процессов 4) организм, продуцирующий БАВ 5) фермент, используемый в лечебных целях <p>7. Преимущества биотехнологического производства органических продуктов перед химическими методами синтеза:</p>

1) синтез целевого продукта в виде сложной смеси

2) неспецифичность

3) незначительный выход целевого продукта

4) возможность получения чистых изомеров

5) использование больших количеств воды е) отсутствие специфичности

8. Период полувыведения лекарства – это:

1) время достижения максимальной концентрации лекарства в плазме

2) время, в течение которого лекарство достигает системного кровотока

3) время, в течение которого лекарство распределяется в организме

4) время, за которое концентрация лекарства в плазме снижается на 50%

5) время, за которое половина введенной дозы достигает органа-мишени

9. Широта терапевтического действия – это:

1) терапевтическая доза лекарства

2) отношение концентрации лекарства в органе или ткани к концентрации его в плазме крови

3) диапазон между минимальной терапевтической и минимальной токсической концентрациями лекарства в плазме

4) процент не связанного с белком лекарства

5) диапазон между минимальной и максимальной терапевтическими концентрациями лекарства.

10. Полипептиды с физиологической активностью – это продукты, выделяемые из:

1) растительного сырья,

2) минералов,

3) животного происхождения,

4) продукты жизнедеятельности микроорганизмов.

11. При поиске антиметаболитов – основная задача – это:

1) синтез точных структур метаболитов,

2) синтез близких структурных аналогов естественных метаболитов,

3) синтез соединений, содержащих одинаковые структурные фрагменты,

4) ионогенные поверхностно активные соединения.

12. Задачей химической модификации соединений с известной биологической активностью является:

1) устранение отрицательного действия,

2) упрощение схем синтеза,

3) синтез более активных и менее токсичных аналогов,

4) увеличение полярности.

13. Для создания гидрогелей полисахариды должны иметь структуру:

1) циклическую,

2) линейную,

3) иметь характер полиэлектролитов,

4) не иметь ионогенных функциональных групп.

14. Новым подходом к созданию лекарственных средств является изучение рецептора, с которым будет взаимодействовать лекарственное средство. Что помогает получить нужные данные:

1) ЯМР и рентгеноструктурный анализ,

2) элементный анализ,

3) хроматография,

4) экстракция.

15. Биосовместимые – это материалы:

1) волокнисто – сетчатой структуры для реконструкции органов и тканей,

2) матриксы для иммобилизации стволовых клеток,

3) материалы для микрокапсулирования,

4) материалы, способные существовать совместно с живым организмом, выполняя свои функции и не нанося ему вред.

16. 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.*

17. Основной функцией "scaffold" является

- 1) *создание структурной основы для размещения функционально важных заместителей в соединении,*
- 2) *обеспечение наличия базовой биологической активности у получаемого соединения,*
- 3) *обеспечение необходимых фармакокинетических характеристик у получаемого соединения,*
- 4) *обеспечение устойчивости препарата к действию метаболических систем организма.*

18. К мультикомпонентным реакциям относят

- 1) *реакцию Михаэля,*
- 2) *реакцию Вильямсона,*
- 3) **3) *реакцию Уги,***
- 4) *реакцию Реформатского.*

19. Стратегии ретрасинтеза базируются на:

- 1) *трансформах*
- 2) *структуре*
- 3) *топологии*
- 4) *стереохимии*
- 5) *функциональных групп*
- 6) **6) *все указанные принципы.***

20. Идиализированный фрагмент возникающий в результате трансформации расчленение, называют:

- 1) *ретрон*
- 2) **2) *синтон***
- 3) *интермедиат*

21. Анализ SAR позволяет определить:

- 1) *химическую группу, ответственную за возникновение целевого биологического эффекта*
- 2) *физико-химические показатели*
- 3) *скорость выведения*
- 4) **4) *токсичность***

22. Для испытаний in vitro чаще всего используют:

- 1) *отдельные клетки*
- 2) **2) *клеточные (конечные или непрерывные) линии***
- 3) *ткани*
- 4) *органы.*

23. Твердофазный синтез – это

- 1) *методология синтеза органических соединений без применения растворителя,*
- 2) *методология получения органических соединений, химически закрепленных на твердофазную основу,*
- 3) **3) *методология, позволяющая получать только пептиды, сахараиды, нуклеотиды и другие нерегулярные олигомеры,***
- 4) *методология синтеза органических соединений с применением гетерофазных катализаторов.*

24. Под понятием «scavenger» понимают

- 1) *химическое соединение, закрепленное на полимерной подложке и предназначенное для удаления из реакционной смеси побочных продуктов реакций,*
- 2) *химическое соединение, закрепленное на полимерной подложке и предназначенное для введения в реакционную смесь реагентов для проведения химических реакций,*
- 3) *химическое соединение, закрепленное на полимерной подложке и предназначенное для связывания модифицируемого соединения с полимерным носителем,*
- 4) **4) *химическое соединение, предназначенное для отщепления модифицируемого соединения от полимерного носителя.***

25. 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) **4) *сложность реального синтеза генерируемых структур***

2) заданий, предусматривающих короткий ответ.

Пример заданий с указанием правильного ответа, по различным разделам дисциплины

1. На основе ... получают амиды (такие как тиофосфамид, допин, имифос) используемые для лечения онкологических заболеваний.

Ответ: азиридин

2. Что означает аббревиатура МНН (INN)?

Ответ: Международное непатентованное наименование

3. ... – лекарственный препарат, имеющий такой же качественный и количественный состав действующих веществ (активных фармацевтических субстанций) и ту же лекарственную форму, что и референтный лекарственный препарат, и биоэквивалентность которого референтному лекарственному препарату подтверждается соответствующими исследованиями биодоступности

Ответ: дженерик

4. Искусственный ингибитор конвертирующего фермента – был синтезирован на основе N-сукцинил-L-пролина в 1975 г., считается одним из первых «спроектированных» лекарственных препаратов – это ...

Ответ: каптоприл

5. Разработка ЛС включает следующие стадии:

Ответ: создание биоизостерических соединений, создание пролекарств, создание мягких лекарств, создание двойных лекарств.

6. Азатиоприн является пролекарством ..., обладающего цитостатическими и иммунодепрессивными свойствами. В организме азатиоприн медленно превращается в ..., что приводит к пролонгированию действия последнего.

Ответ: 6-меркаптопурин

7. Побочный эффект при длительном приеме пироксикама – ... и способ его снижения - ...

Ответ: изъязвление слизистой желудка, получение ацилированных производных.

3) устных опросов.

Описание технологии проведения

Текущая аттестация по дисциплине «Синтез и анализ новых физиологически активных соединений» включает в себя теоретические задания, позволяющие оценить уровень усвоения обучающимися знаний, и практические задания, выявляющие степень сформированности умений и владений.

Усвоенные знания, умения и владения проверяются в ходе устного опроса и тестирования.

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.

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 химии биологически активных соединений;
- 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 биологически активных соединений;
- знание проблематики новых разделов химии и смежных естественнонаучных дисциплин и способов их развития при решении конкретных задач химии биологически активных соединений;
- умение определять необходимость привлечения дополнительных знаний из новых разделов химии и естественнонаучных дисциплин для решения профессиональных задач в области химии биологически активных соединений;
- 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 предмета, 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 зачете с оценкой, по билетам (КИМ).

КИМ содержит два вопроса и формируется по следующему принципу: первый вопрос посвящен вопросам медицинской химии и биотехнологии, второй – синтезу и анализу физиологически активных соединений.

№	Примерный перечень вопросов
1	Рациональный драг-дизайн. Соединение-лидер. Стратегии создания новых синтетических ЛВ. Скрининг веществ. Кластерный анализ БАВ. Моделирование механизма взаимодействия вещества с биорецептором. Молекулярное конструирование.
2	Химическое модифицирование структуры. Понятие фармакофора. Введение фармакофорной группы. Стратегия пролекарств. Концепция антиметаболитов. Методология комбинаторной химии. Комбинаторные библиотеки, building block, s
3	QSAR, дескрипторы, методология предсказания активности
4	Комплексное планирование изыскания лекарственных средств. Связь «структура — биоактивность». Конструирование лекарственного препарата. Схема разработки нового лекарственного вещества. Классификация лекарственных веществ. Основные болезни человека и ведущие группы лекарственных веществ на современном фармацевтическом рынке.
5	Природные источники физиологически активных соединений
6	Синтез и анализ ЛВ алифатического ряда. Особенности технологических процессов. Синтез общих анестетиков. Синтез антираковых препаратов.
7	Алканолы, аминоалканолы и их эфиры. Получение этанола. Синтез диэтилового эфира. Синтез мепротана. Сложные эфиры азотистой и азотной кислот. Производны
8	Альдегиды и кислоты. Получение хлорала. Уротропин. Гамма-гидроксibuтират натрия. Витамины F и B ₁₅ .
9	Производные α -аминокислот. Метионин. Витамин U. Глутаминовая кислота. D-серин. Производные β -аминокислот. Витамин B ₃ (пантотеновая кислота). Производные γ -аминомасляной кислоты. Нейротропные средства. Витамин B ₇ .
10	Олигомеры α -аминокислот. Грамицидин S. Эндогенные пептиды. Пептидные гормоны. Инсулин. Ангиотензины II и I. Фермент ренин. Вторичные мессенджеры.
11	Синтез и анализ ЛВ алициклического ряда. Особенности технологических процессов.
12	Ментол. Витамин A. Противозачаточные и противовоспалительные вещества на основе циклопентафенантрена. Синтез витамина D. Камфора. Производные адамантана в качестве антивирусных средств
13	Синтез и анализ ЛВ ароматического ряда. Особенности технологических процессов.
14	Синтез и анализ ЛВ гетероциклического ряда. Особенности технологических процессов.
15	Аминоалкилбензолы в качестве психостимуляторов, антибиотиков и гормонов. Антигистаминные препараты группы диарилметана. Антисептики и адреноблокаторы фенольного ряда. Аминофенолы в качестве обезболивающих и противотуберкулезных средств.
16	Производные орто-гидроксibenзойной кислоты. Аспирин. Средства на основе пара-аминобензойной кислоты. Производные пара-аминобензолсульфоkислоты. Оксопроизводные нафталина.
17	Лекарственные вещества группы азиридина и оксирана. Антибиотики, содержащие четырехчленное азетидиновое ядро. Пенициллины. Цефалоспорины.
18	Лекарственные вещества на основе пятичленных гетероциклов. Витамин C. Антибактериальные нитрофураны. Синтез биологически активных производных пиррола. Производные индола. Макроциклические соединения с тетрапиррольной
19	Синтез лекарственных веществ, содержащих шестичленные гетероциклы. Витамин E. Витамины группы B и противотуберкулезные средства. Производные тетрагидропиридинов. Анальгетики и транквилизаторы пиперидинового ряда. Производные хинолина и изохинолины. Производные пиримидинов. Производные пиперазина и пиридазина.
20	Антидепрессанты дибензазепинового ряда. Транквилизаторы группы 1,4-бензодиазепина. Производные азабициклооктанов. Лекарственные препараты на основе хинуклидина. Производные азабициклононанов
21	Мишени для физиологически активных соединений
22	Критерии эффективности организации химико-технологического процесса.
23	Математическое моделирование химико-технологических процессов получения ФАВ.
24	Основные направления совершенствования процесса синтеза ФАВ. Выбор схем синтеза ФАВ.
25	Биотехнология: разновидности, преимущества и недостатки.
26	Типовая схема биотехнологического производства. Основные стадии процесса, цели и задачи

каждой стадии.

Пример билета (КИМ)::

УТВЕРЖДАЮ

Заведующий кафедрой _____

_____.20__

Направление подготовки / специальность 04.04.01. Химия
Дисциплина Синтез и анализ новых физиологически активных веществ
Курс 4
Форма обучения очная
Вид аттестации промежуточная
Вид контроля зачет с оценкой

Контрольно-измерительный материал № 1

1. QSAR, дескрипторы, методология предсказания активности
2. Антидепрессанты дибензазепинового ряда. Транквилизаторы группы 1,4-бензодиазепина. Производные азабициклооктанов. Лекарственные препараты на основе хинуклидина. Производные азабициклононанов

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 «Химия биологически активных соединений».

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 химии биологически активных соединений;

- 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 биологически активных соединений;
- знание проблематики новых разделов химии и смежных естественнонаучных дисциплин и способов их развития при решении конкретных задач химии биологически активных соединений;
- умение определять необходимость привлечения дополнительных знаний из новых разделов химии и естественнонаучных дисциплин для решения профессиональных задач в области химии биологически активных соединений;
- 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 предмета, 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.