

Документ подписан простой электронной подписью
Информация о владельце:
ФИО: Есауленко Игорь Эдуардович
Должность: Ректор
Дата подписания: 12.09.2023 15:58:31
Уникальный программный ключ:
691eebef92031be66ef61648f97525a2e2da8356

ФГБОУ ВО ВГМУ им. Н.Н. Бурденко
Минздрава России

УТВЕРЖДАЮ
Декан фармацевтического факультета
профессор *Бережнова Т.А.*
«25» мая 2021 г

Рабочая программа

по дисциплине «Методы экспериментального изучения молекулярных основ действия лекарственных средств»

для специальности 33.05.01 «Фармация» (уровень специалитета)

форма обучения очная

факультет фармацевтический

кафедра фармацевтической химии и фармацевтической технологии

курс 2

семестр 4

лекции 4 (часов)

Зачет 3 (часа, 4 семестр)

Практические занятия 36 (часов)

Самостоятельная работа 29 (часов)

Всего часов (ЗЕ) 72 (2)

Программа составлена в соответствии с требованиями ФГОС ВО по специальности 33.05.01 Фармация (уровень специалитета) (утвержден приказом Министерства образования и науки Российской Федерации приказ от 27 марта 2018 г. № 219).

Рабочая программа обсуждена на заседании кафедры фармацевтической химии и фармацевтической технологии «25» мая 2021 г., протокол № 9.

Заведующий кафедрой, д.х.н. Рудакова Л.В.

Рецензент (ы):

д.х.н., профессор кафедры клинической лабораторной диагностики, Пономарева Н.И.

д.ф.н., профессор кафедры организации фармацевтического дела, клинической фармации и фармакогнозии, Афанасьева Т.Г.

Программа одобрена на заседании ЦМК по координации преподавания специальности «Фармация» от 25 мая 2021 года, протокол № 7.

1. ЦЕЛИ И ЗАДАЧИ ИЗУЧЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ

Цель: ознакомление студентов с рядом разделов фармакологии, биохимии, молекулярной и клеточной биологии для создания целостного представления об основных механизмах действия лекарственных препаратов.

Задачами дисциплины являются:

- расширить познания студентов в области молекулярных основ нормальной и патологической биологии;
- ознакомить студентов с влиянием природных и синтетических физиологически активных веществ на процессы в клетке;
- современных принципах разработки лекарственных средств и тенденциях фармакологии.

2. МЕСТО ДИСЦИПЛИНЫ В СТРУКТУРЕ ООП СПЕЦИАЛИСТА

Дисциплина «Методы экспериментального изучения молекулярных основ действия лекарственных средств» изучается в IV семестре.

Входные навыки, знания и умения, необходимые для изучения дисциплины сформированы в курсе химии и биологии, биохимии, фармацевтической химии.

В рамках курса даются базовые представления об общих принципах метаболизма лекарственных средств; механизмах функционирования и фармакологии периферической и центральной нервной системы; механизмах функционирования и фармакологии кровеносной системы и крови; организации эндокринной сигнализации в организме и эндокринной фармакологии; основных принципах химиотерапии; организации иммунной системы, механизмах воспалительного ответа и связанных с ними фармакологических подходах; основах фармакологической токсикологии.

3. КОМПЕТЕНЦИИ ОБУЧАЮЩЕГОСЯ, ФОРМИРУЕМЫЕ В РЕЗУЛЬТАТЕ ОСВОЕНИЯ УЧЕБНОЙ ДИСЦИПЛИНЫ

Результаты образования	Краткое содержание и характеристика (обязательного) порогового уровня сформированности компетенций	Номер компетенции
1	2	3
Знать: <ul style="list-style-type: none">– основные классы макромолекул — мишеней фармакологических агентов;– формулы наиболее распространенных лекарственных средств (напр., аспирин, пенициллин) и тех средств, функционирование которых непосредственно объясняется их химическим строением (напр., новокаин, декаметоний, органофосфаты и др.)– основные типы агонистов и антагонистов фармакологических мишеней;– механизмы действия основных лекарственных средств, используемых в терапии заболеваний, вызванных	Способен принимать участие в проведении исследований в области оценки эффективности и безопасности лекарственных средств ИД ПКР-8-3 Проводит изучение биодоступности веществ на различных моделях in vitro и in vivo ИД ПКР-8-4 Оформляет результаты исследований, проводит статистическую обработку результатов.	ПКР-8

<p>патологией различных систем организма;</p> <ul style="list-style-type: none"> – основные понятия фармакокинетики и фармакодинамики; – механизмы развития лекарственной устойчивости; <p>Уметь:</p> <ul style="list-style-type: none"> – рассчитывать долю занятых рецепторов, терапевтический индекс, дозы лекарственных средств и т. п.; – объяснить механизмы возникновения основных патологических процессов; – объяснить механизмы действия изученных в ходе курса лекарственных средств. <p>Владеть:</p> <ul style="list-style-type: none"> – основными принципами индивидуализированного подхода к фармакологическому лечению заболеваний. 		
---	--	--

4. СТРУКТУРА И СОДЕРЖАНИЕ УЧЕБНОЙ ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)

4.1. Общая трудоемкость дисциплины составляет 2 зачётных единиц, 72 часа.

	Раздел учебной дисциплины	Семестр	Неделя семестра	Виды учебной работы, включая самостоятельную работу обучающегося и трудоемкость (в часах)			Формы текущего контроля успеваемости (по неделям семестра) Форма промежуточной аттестации (по семестрам)
				Лекции	Практические занятия	Самост. работа	
1	Молекулярные основы действия лекарственных средств	4	1-9	2	18	14	ВК, ТК
2	Современные принципы разработки лекарственных средств и тенденции фармакологии	4	10-18	2	18	15	ВК, ТК, ПК

4.2 Тематический план лекций

№	Тема	Цели и задачи	Содержание темы	Часы
1.	Связывание фармакологического агента с мишенью в организме как основа действия лекарственных средств. Структура малых лигандов и белковых мишеней-рецепторов, основные определяющие их физико-химические факторы. Основные определения фармакокинетики. Влияние метаболизма на фармакологические агенты. Основные органы, в которых проходит биотрансформация фармакологических агентов.	Рассмотреть молекулярные основы действия лекарственных средств	Связывание фармакологического агента с мишенью в организме как основа действия лекарственных средств Основные определения фармакокинетики Влияние метаболизма на фармакологические агенты. Основные органы, в которых проходит биотрансформация фармакологических агентов	2
2.	Поиск новых лекарственных средств; активные и лидирующие вещества; агент-направленная и мишень-направленная стратегии поиска. Агент-направленная стратегия. Мишень-направленная стратегия. Доклиническая разработка лекарственных средств.	Рассмотреть пути поиска новых лекарственных средств	Поиск новых лекарственных средств Оптимизация лидирующих соединений Доклиническая разработка лекарственных средств. Биологическая характеристика	2

4.3 Тематический план практических занятий

№	Тема	Цели и задачи	Содержание темы	Обучающийся должен знать	Обучающийся должен уметь	Часы
1.	Связывание фармакологического агента с мишенью в организме как основа действия	Основные определения фармакокинетики	основные типы агонистов и антагонистов фармакологи	механизмы действия основных лекарственных средств,	Основные определения фармакокинетики	4

	лекарственных средств.		ческих мишеней	используемых в терапии заболеваний, вызванных патологией различных систем организма		
2.	Структура малых лигандов и белковых мишеней-рецепторов, основные определяющие их физико-химические факторы.	Основные определения фармакокинетики	механизмы действия основных лекарственных средств, используемых в терапии заболеваний, вызванных патологией различных систем организма	механизмы действия основных лекарственных средств, используемых в терапии заболеваний, вызванных патологией различных систем организма	Молекулярные основы действия лекарственных средств	4
3.	Основные определения фармакокинетики: абсорбция, распределение, метаболизм и выведение лекарственных средств. Физиологические барьеры.	Основные определения фармакокинетики	основные понятия фармакокинетики и фармакодинамики	механизмы действия основных лекарственных средств, используемых в терапии заболеваний, вызванных патологией различных систем организма	Молекулярные основы действия лекарственных средств	4
4.	Влияние метаболизма на фармакологические агенты: инактивация, активация, трансформация в токсические метаболиты, трансформация в экскретируемую форму. Основные органы, в которых проходит биотрансформация фармакологических	Основные определения фармакокинетики	Основные понятия фармакокинетики и фармакодинамики	механизмы действия основных лекарственных средств, используемых в терапии заболеваний, вызванных патологией различных систем	Молекулярные основы действия лекарственных средств	4

	агентов.			организма		
5.	Поиск новых лекарственных средств; активные и лидирующие вещества; агент-направленная и мишень-направленная стратегии поиска. Агент-направленная стратегия: природные и синтетические антагонисты; естественные агонисты и их аналоги; примеры лекарств, разработанные с помощью этой стратегии (пенициллин, паклитаксел, инсулин и т.п.).	Пути поиска новых лекарственных средств	Пути поиска новых лекарственных средств	Доклиническая разработка лекарственных средств. Биологическая характеристика	Молекулярные основы действия лекарственных средств	4
6.	Мишень-направленная стратегия: высокопроизводительный скрининг, комбинаторная химия (параллельный синтез, тэггинг), рациональный дизайн (на примере ритонавира). Пептиды, пептидомиметики и макромолекулы как особый класс фармакологических агентов. Оптимизация лидирующих соединений.	Пути поиска новых лекарственных средств	Пути поиска новых лекарственных средств	Доклиническая разработка лекарственных средств. Биологическая характеристика	Молекулярные основы действия лекарственных средств	4
7.	Оральный механизм доставки: формулы пролонгированного действия; применение эксципиентов, липосом и микросфер. Пульмонарная доставка. Трансдермальная доставка: ионофорез, сонофорез.	Пути поиска новых лекарственных средств	Проведении исследований в области оценки эффективности и безопасности лекарственных средств	механизмы Доклиническая разработка лекарственных средств. Биологическая характеристика	Современные принципы разработки и лекарственных средств	4
8.	Доставка с помощью полимеров. Общие принципы: различные	Пути поиска новых лекарственных средств	Проведении исследований в	Доклиническая разработка	Современные принципы	4

	виды диффузии, химическая деградация, активация растворителем. Регулируемая доставка и регулируемая специфичность к органам-мишеням. Использование липосом в качестве векторов доставки.	х средств	области оценки эффективности и безопасности лекарственных средств	лекарственных средств. Биологическая характеристика	разработок и лекарственных средств	
9.	Доклиническая разработка лекарственных средств. Биологическая характеристика: биохимические и клеточные анализы, анализы на животных.	Пути поиска новых лекарственных средств	Проведении исследований в области оценки эффективности и безопасности лекарственных средств	Доклиническая разработка лекарственных средств. Биологическая характеристика	Современные принципы разработки и лекарственных средств	2
10.	Химическая характеристика: структура, растворимость, коэффициент распределения, стабильность, чистота. Химический синтез: ретросинтетический анализ, линейный и конвергентный синтез; масштабирование и производство. Разработка лекарственной формы.	Пути поиска новых лекарственных средств	Проведении исследований в области оценки эффективности и безопасности лекарственных средств	Доклиническая разработка лекарственных средств. Биологическая характеристика	Современные принципы разработки и лекарственных средств	2

4.4. Тематика самостоятельной работы обучающихся

Тема	Внеаудиторная самостоятельная работа			
	Форма	Цель и задачи	Метод. обеспечение	Часы
Молекулярные основы действия лекарственных средств	Изучение литературных источников информации, в том числе используя компьютерные ресурсы	Подготовка к ПЗ, подготовка к ВК, подготовка к ТК, подготовка к ПК	1. Аляутдин Р. Н. Фармакология, 4-е изд. – М.: ГЭОТАР-Медиа, 2013. 2. Катцунг Б. Г. Базисная и клиническая фармакология. В 2-х т. – СПб.: Диалект; М.: Бином, 2008. 3. Боргер М., Штрауб М. Э. Клиническая фармакология	14

			по Гудману и Гилману (под ред. Гилмана А. Г.). В 4-х т. – М.: Практика, 2006. 4. Харкевич Д. А. Фармакология, 11-е изд., испр. и доп. – М.: ГЭОТАР-Медиа, 2013.	
Современные принципы разработки лекарственных средств и тенденции фармакологии	Изучение литературных источников информации, в том числе используя компьютерные ресурсы	Подготовка к ПЗ, подготовка к ВК, подготовка ТК, подготовка к ПК	1. Аляутдин Р. Н. Фармакология, 4-е изд. – М.: ГЭОТАР-Медиа, 2013. 2. Катцунг Б. Г. Базисная и клиническая фармакология. В 2-х т. – СПб.: Диалект; М.: Бинном, 2008. 3. Боргер М., Штрауб М. Э. Клиническая фармакология по Гудману и Гилману (под ред. Гилмана А. Г.). В 4-х т. – М.: Практика, 2006. 4. Харкевич Д. А. Фармакология, 11-е изд., испр. и доп. – М.: ГЭОТАР-Медиа, 2013.	15

4.5 Матрица соотнесения тем/ разделов учебной дисциплины и формируемых в них ОК и ПК

Темы/разделы дисциплины	Количество часов	Компетенции
Методы физического и физико-химического анализа	34	ПКР-8 ИД ПКР-8-3 ИД ПКР-8-4
Лекарственные формы лекарственных средств и методы их анализа	35	
ИТОГО	69+3(контроль)	

5. ОБРАЗОВАТЕЛЬНЫЕ ТЕХНОЛОГИИ

Обучение складывается из аудиторных занятий, включающих лекционный курс, практические занятия и самостоятельной работы. Основное учебное время выделяется на практическую работу по усвоению теоретических знаний, приобретению практических навыков и умений.

При изучении учебной дисциплины необходимо использовать весь ресурс основной и дополнительной учебной литературы, лекционного материала, наглядных пособий и демонстрационных материалов, лабораторного оборудования и освоить

практические навыки и умения, приобретаемые в ходе выполнения практических работ и решения ситуационных задач.

Практические занятия проводятся в виде практических занятий, решения тестовых заданий, обучающих и ситуационных задач.

В соответствии с требованиями ФГОС-3 ВПО в учебном процессе широко используются активные и интерактивные формы проведения занятий (*развивающее и проблемное обучение в форме ролевых игр, объяснительно-иллюстративное обучение с визуализацией аудиторных занятий, программированное обучение, модульное обучение, информатизационное обучение, мультимедийное обучение*). Используемые образовательные технологии при изучении данной дисциплины составляют не менее 5,0% интерактивных занятий от объема аудиторных занятий.

Самостоятельная работа студентов подразумевает подготовку к практическим занятиям, к текущим, промежуточным и итоговым контролям и включает индивидуальную аудиторную и домашнюю работу с наглядными материалами, учебной основной и дополнительной литературой, ресурсами сети Интернет, решение ситуационных задач и т.д.

Работа с учебной литературой рассматривается как вид учебной работы по дисциплине «Методы экспериментального изучения молекулярных основ действия лекарственных средств» и выполняется в пределах часов, отводимых на ее изучение.

Каждый обучающийся должен быть обеспечен доступом к библиотечным фондам университета и кафедры.

По разделам учебной дисциплины разработаны методические рекомендации для студентов и методические указания для преподавателей, которые находятся в электронной базе кафедры.

В конце изучения учебной дисциплины проводится промежуточный контроль знаний с использованием тестового контроля, проверкой практических умений и решением ситуационных задач.

6. ОЦЕНОЧНЫЕ СРЕДСТВА ДЛЯ ТЕКУЩЕГО КОНТРОЛЯ УСПЕВАЕМОСТИ, ПРОМЕЖУТОЧНОЙ АТТЕСТАЦИИ ПО ИТОГАМ ОСВОЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ И УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ САМОСТОЯТЕЛЬНОЙ РАБОТЫ ОБУЧАЮЩИХСЯ

1. Примеры тестов к промежуточной аттестации

1. Укажите энтеральный путь введения лекарств.

- а) внутримышечный;
- б) подкожный;
- в) ингаляционный;
- г) внутрь;
- д) субарахноидальный.

2. Что характерно для введения лекарственных веществ через рот?

- а) быстрое развитие эффекта;
- б) возможность использования в бессознательном состоянии;
- в) возможность применения лекарств, разрушающихся в ЖКТ;
- г) скорость поступления лекарств в общий кровоток непостоянна;
- д) необходимость стерилизации вводимых лекарств.

3. Укажите основной механизм всасывания лекарственных веществ в желудочно-кишечном тракте.

- а) облегченная диффузия;
- б) пассивная диффузия;
- в) активный транспорт;
- г) пиноцитоз;
- д) фильтрация.

4. Лекарственные средства, являющиеся слабыми основаниями, лучше назначать:

- а) натощак;
- б) после еды;
- в) связь с приемом пищи отсутствует;

- г) натошак, запивая слабощелочными растворами;
 - д) после еды, запивая слабокислыми растворами.
5. Укажите, из какой лекарственной формы при приеме внутрь лекарственное вещество всасывается и поступает в кровь быстрее?
- а) раствор;
 - б) суспензия;
 - в) таблетки;
 - г) капсулы;
 - д) драже.
6. Что характерно для введения лекарств в виде инъекций?
- а) более быстрое развитие эффекта, чем при приеме внутрь;
 - б) возможность применения лекарств, разрушающихся в ЖКТ;
 - в) возможность использования у больных, находящихся в бессознательном состоянии;
 - г) необходимость стерилизации вводимых лекарств;
 - д) все перечисленное выше в п. а), б), в), г) — верно.
7. Наиболее быстро фармакологический эффект развивается при введении лекарств:
- а) подкожно;
 - б) внутримышечно;
 - в) внутривенно;
 - г) внутрь;
 - д) сублингвально.
8. С целью местного воздействия на кожу и слизистые оболочки наносят следующие лекарственные формы:
- а) порошки;
 - б) пасты;
 - в) мази;
 - г) эмульсии;
 - д) все перечисленное выше.
9. При каком способе введения биодоступность препарата 100%?
- а) ректальный;
 - б) пероральный;
 - в) сублингвальный;
 - г) внутривенный;
 - д) транскутанный.
10. Укажите основной путь выведения лекарств из организма:
- а) почками с мочой;
 - б) печенью с желчью;
 - в) легкими с выдыхаемым воздухом;
 - г) потовыми железами с потом;
 - д) молочными железами с молоком.

2. Примерные вопросы к зачету

1). Понятие о лекарствах. Принципы подхода к поиску новых лекарственных веществ. Скрининг и его методы. Изучение взаимосвязи биологической активности лекарственных веществ с их химическим строением.

2) Физико-химические свойства лекарств, их электронная структура. Конформационный анализ. Применение компьютерной техники для создания новых лекарственных средств; программы компьютерного моделирования лекарств.

3) Пути и способы введения лекарств. Энтеральные и парентеральные пути введения: их характеристика, преимущества и недостатки.

4) Всасывание лекарств. Основные механизмы всасывания. Факторы, влияющие на всасывание веществ.

5) Гистогематические барьеры и их характеристика.

6) Транспорт лекарственных веществ.

7) Распределение лекарств в организме.

8) Депонирование лекарственных веществ.

9) Пути элиминации лекарств из организма.

10) Математическое моделирование фармакокинетических процессов.

11) Метаболизм лекарственных веществ.

12) Виды и характер действия лекарственных веществ.

13) Доклиническая разработка лекарственных средств.

14) Биологическая характеристика: биохимические и клеточные анализы, анализы на животных.

3. Примеры ситуационных задач

Задача 1. Вы провизор Центра охраны здоровья матери и ребенка. Вам необходимо выступить на конференции «Школа молодой матери» с сообщением о возможном отрицательном влиянии лекарственных препаратов на разные стадии развития плода.

Расскажите о том, как лекарственное вещество может проникнуть из организма матери в организм плода.

Объясните женщинам значение следующих терминов:

1. Эмбриотоксичность

2. Тератогенность

3. Фетотоксичность

4. Мутагенность

5. Почему ограничен прием многих лекарственных средств в период лактации?

Приведите примеры препаратов, способных оказать отрицательное влияние на плод, при их применении при беременности. Расскажите о мерах по предупреждению этих эффектов.

Задача 2. Сформируйте ассортиментный портфель средств лечения нарушений мозгового кровообращения.

Обоснуйте перечень включенных в список ЛС.

Дайте классификацию ЛС этой группы.

Назовите их основные фармакотерапевтические свойства.

Выделите ЛС с доказанной эффективностью.

Выделите препараты базовой терапии и средства дополнительной терапии.

Назовите основные взаимодействия, осложнения и противопоказания к назначению препаратов.

Укажите режим приема и дозирования.

Задача 3. Сформируйте ассортиментный портфель средств лечения тревожно-депрессивных состояний.

Обоснуйте перечень включенных в список ЛС.

Дайте классификацию ЛС этой группы.

Назовите их основные фармакотерапевтические свойства.

Выделите препараты первого ряда и препараты резерва.

Назовите основные взаимодействия, осложнения и противопоказания к назначению препаратов.

Укажите режим приема и дозирования.

Задача 4. Сформируйте ассортиментный портфель средств лечения кислотозависимых патологий.

Обоснуйте перечень включенных в список ЛС.

Дайте классификацию ЛС этой группы.

Назовите их основные фармакотерапевтические свойства.

Выделите ЛС с доказанной эффективностью.

Выделите препараты базовой терапии и средства дополнительной терапии.

Назовите основные взаимодействия, осложнения и противопоказания к назначению препаратов.

Укажите режим приема и дозирования.

Задача 5. Сформируйте ассортиментный портфель средств лечения заболеваний печени и желчевыводящих путей.

Обоснуйте перечень включенных в список ЛС.

Дайте классификацию (структурируйте) ЛС этих групп.

Назовите их основные фармакотерапевтические свойства.

Назовите основные взаимодействия, осложнения и противопоказания к назначению препаратов.

Укажите режим приема и дозирования.

Задача 6. Сформируйте ассортиментный портфель средств лечения диареи и запоров.

Обоснуйте перечень включенных в список ЛС.

Дайте классификацию (структурируйте) ЛС этих групп.

Назовите их основные фармакотерапевтические свойства.

Назовите основные взаимодействия, осложнения и противопоказания к назначению препаратов.

Укажите режим приема и дозирования.

7. УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ И ИНФОРМАЦИОННОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ УЧЕБНОЙ ДИСЦИПЛИНЫ

1. Аляутдин, Р. Н. Фармакология : учебник / под ред. Р. Н. Аляутдина. - 5-е изд. , перераб. и доп. - Москва : ГЭОТАР-Медиа, 2016. - 1104 с. - ISBN 978-5-9704-3733-9. - Текст : электронный // ЭБС "Консультант студента" : [сайт]. - URL : <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970437339.html> (дата обращения: 25.03.2023).

2. Катцунг Б. Г. Базисная и клиническая фармакология. В 2-х т. – СПб.: Диалект; М.: Бином, 2008.

3. Боргер М., Штрауб М. Э. Клиническая фармакология по Гудману и Гилману (под ред. Гилмана А. Г.). В 4-х т. – М.: Практика, 2006.

4. Харкевич, Д. А. Фармакология : учебник / Д. А. Харкевич. - 11-е изд. , испр. и доп. - Москва : ГЭОТАР-Медиа, 2015. - 760 с. - ISBN 978-5-9704-3412-3. - Текст : электронный // ЭБС "Консультант студента" : [сайт]. - URL : <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970434123.html> (дата обращения: 25.03.2023).

Программное обеспечение и Интернет- ресурсы:

1. Операционные системы:

- Windows 7
- Windows XP Home Edition

2. Офисные продукты:

- Microsoft Office 2007
- Microsoft Office 2010

3. Прикладные программы:

- КонсультантПлюс

Все указанные программы лицензионны, о чем свидетельствуют соответствующие сертификаты.

8. МАТЕРИАЛЬНО-ТЕХНИЧЕСКОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)

Компьютерная техника. Компьютерный класс на 13 рабочих мест используется для проведения текущего, рубежного тестирования, знакомства с нормативными актами.

Учебные лаборатории укомплектованы лабораторной мебелью, весо-измерительными приборами, электрохимическим оборудованием, лабораторной техникой и посудой, приборами для химических, физических и физико-химических методов анализа лекарственных средств, наглядными пособиями, таблицами, плакатами).

Лекционный зал (укомплектован экраном, мультимедийной доской, проектором и т.д.).