

**МИНОБРНАУКИ РОССИИ**  
**Ярославский государственный университет им. П.Г. Демидова**

Институт фундаментальной и прикладной химии

УТВЕРЖДАЮ

Декан факультета биологии и экологии



О.А.Маракаев

« 24 » мая 2022 г.

**Рабочая программа дисциплины**  
**«Основы конструирования лекарственных и биологически активных веществ»**

Направление подготовки  
04.03.01 Химия

Направленность (профиль)  
«Медицинская и фармацевтическая химия»

Форма обучения  
очная

Программа одобрена  
на заседании института  
от 14 апреля 2022 г., протокол № 8

Программа одобрена НМК  
факультета биологии и экологии  
протокол № 8 от 18 апреля 2022 г.

Ярославль

### 1. Цели освоения дисциплины

Целью освоения дисциплины является формирование у студентов фундаментальных знаний в области взаимосвязи структуры химических веществ и их биологической активностью, умений и навыков экспериментальной работы по конструированию параметров структуры веществ и моделированию их взаимодействия с биомолекулами.

Курс вырабатывает у студентов современные представления о подходах к конструированию лекарственных и биологически активных веществ.

### 2. Место дисциплины в структуре образовательной программы

Дисциплина относится к части, формируемой участниками образовательных отношений Блока 1, дисциплины по выбору (Б1.В.ДВ.06.02).

Для освоения данной дисциплины студенты должны владеть математическим аппаратом, уметь находить корреляционные зависимости, применять приемы сравнения, анализа и синтеза, объяснения причинно-следственных связей, обобщения, иметь представление об основных классах химических соединений и их свойствах.

Полученные в курсе «Основы конструирования лекарственных и биологически активных веществ» знания необходимы для изучения специальных дисциплин, а также для выполнения квалификационных работ.

### 3. Планируемые результаты обучения по дисциплине, соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы

Процесс изучения дисциплины направлен на формирование следующих элементов компетенций в соответствии с ФГОС ВО, ООП ВО и приобретения следующих знаний, умений, навыков и (или) опыта деятельности:

Формируемая компетенция (код и формулировка)	Индикатор достижения компетенции (код и формулировка)	Перечень планируемых результатов обучения
<b>Профессиональные компетенции</b>		
<b>ПК-1</b> Способен проводить НИР и НИОКР, выбирать и использовать технические средства и методы испытаний для решения исследовательских задач химической направленности, поставленных специалистом более высокой квалификации.	<b>ПК-1.1</b> Планирует отдельные стадии исследования при наличии общего плана НИР.	<b>Знать:</b> – общую организацию исследований при разработке лекарственных и биологически активных соединений. <b>Уметь:</b> – прогнозировать, строить математические модели взаимодействия соединений с биомолекулами, формировать требуемые структуры. <b>Владеть навыками:</b> – прогнозирования, получения и определения основных параметров химических веществ.
	<b>ПК-1.2</b> Готовит элементы документации, проекты планов и программ отдельных этапов НИР.	<b>Уметь:</b> – готовить и актуализировать лабораторную документацию в рамках конструирования лекарственных средств. <b>Владеть навыками:</b> – ведения исследовательской документации.

	<p><b>ПК-1.3</b> Выбирает технические средства реализации и методы испытаний (из набора имеющихся) для решения поставленных задач.</p>	<p><b>Уметь:</b> – подбирать методы прогнозирования, формирования и анализа свойств биологически активных соединений в сопоставлении с их строением <b>Владеть навыками:</b> – проведения компьютерных, синтетических и аналитических экспериментов и интерпретации их результатов.</p>
	<p><b>ПК-1.4</b> Готовит объекты исследования.</p>	<p><b>Уметь:</b> – прогнозировать и анализировать свойства химических соединений в сопоставлении с их строением; – классифицировать химические вещества и типы взаимодействий; – оценивать возможность проявления соединениями тех или иных видов биологической активности. <b>Владеть навыками:</b> – химических веществ; – проведения получения и определения основных параметров компьютерных экспериментов и интерпретации их результатов.</p>
<p><b>ПК-2</b> Способен осуществлять разработку методов получения и контроля соединений с целевыми характеристиками под руководством специалиста более высокой квалификации.</p>	<p><b>ПК-2.1</b> Способен проектировать направленный синтез органических соединений с заданным набором свойств в рамках поставленной задачи.</p>	<p><b>Знать:</b> – основные мишени для лекарственных и биологически активных соединений; – способы формирования требуемой структуры. <b>Уметь:</b> – формулировать пути синтеза целевых структур. <b>Владеть навыками:</b> – получения и определения основных параметров химических веществ; – синтеза биологически активных соединений.</p>
	<p><b>ПК-2.5</b> Способен оценивать прогнозировать целевые свойства на основе фундаментальных основ их формирования.</p>	<p><b>Знать:</b> – взаимосвязь между строением химических соединений и их свойствами. <b>Уметь:</b> – прогнозировать и анализировать свойства химических соединений в сопоставлении с их строением; – классифицировать химические вещества и типы взаимодействий; – оценивать возможность проявления соединениями тех или иных видов биологической активности; – строить математические модели взаимодействия соединений с биомишенями. <b>Владеть навыками:</b> – оценки свойств биологически активных соединений.</p>

#### 4. Объем, структура и содержание дисциплины

Общая трудоемкость дисциплины составляет 4 зачетные единицы, 144 акад.ч.

№ п/п	Темы (разделы) дисциплины, их содержание	Семестр	Виды учебных занятий, включая самостоятельную работу студентов, и их трудоемкость (в академических часах)						Формы текущего контроля успеваемости  Форма промежуточной аттестации <i>(по семестрам)</i>  Формы ЭО и ДОТ <i>(при наличии)</i>
			Контактная работа						
			лекции	практические	лабораторные	консультации	аттестационные испытания	самостоятельная работа	
1	Введение. Рациональный драг-дизайн.	8	10		10	3		12	Практическое задание. Отчет о лабораторной работе
2	Химическое модифицирование структуры.	8	9		10	2		12	Практическое задание. Отчет о лабораторной работе
3	Комплексное планирование изыскания лекарственных средств.	8	9		9	2		10	Практическое задание. Отчет о лабораторной работе
4	Синтез лекарственных веществ.	8	11		10	2		11	Практическое задание. Отчет о лабораторной работе
						0,3		11,7	Зачет
	<b>ИТОГО</b>		<b>39</b>		<b>39</b>	<b>9</b>	<b>0,3</b>	<b>56,7</b>	

#### 4.1 Информация о реализации дисциплины в форме практической подготовки

##### Информация о разделах дисциплины и видах учебных занятий, реализуемых в форме практической подготовки

№ п/п	Темы (разделы) дисциплины, их содержание	Семестр	Виды учебных занятий, включая самостоятельную работу студентов, и их трудоемкость (в академических часах)						Место проведения занятий в форме практической подготовки
			Контактная работа						
			лекции	практические	лабораторные	консультации	аттестационные испытания	самостоятельная работа	
1	Введение. Рациональный драг-дизайн.	8			10				Факультет биологии и экологии ЯрГУ
2	Химическое модифицирование структуры.	8			10				Факультет биологии и экологии ЯрГУ
3	Комплексное планирование изыскания лекарственных средств.	8			9				Факультет биологии и экологии ЯрГУ
4	Синтез лекарственных веществ.	8			10				Факультет биологии и экологии ЯрГУ
	<b>ИТОГО</b>				<b>39</b>				

#### Содержание разделов дисциплины

1. Введение. Рациональный драг-дизайн.
  - 1.1. Введение. Соединение-лидер.
  - 1.2. Стратегии создания новых синтетических ЛВ. Скрининг веществ. Кластерный анализ БАВ.
  - 1.3. Моделирование механизма взаимодействия вещества с биорецептором. Молекулярное конструирование.
2. Химическое модифицирование структуры.
  - 2.1. Понятие фармакофора. Введение фармакофорной группы.
  - 2.2. Стратегия пролекарств. Концепция антиметаболитов.
  - 2.3. Методология комбинаторной химии.
  - 2.4. Комбинаторные библиотеки, *building block*, *scaffold*.
3. Комплексное планирование изыскания лекарственных средств
  - 3.1. Связь структура - биоактивность.
  - 3.2. Конструирование лекарственного препарата. Схема разработки нового лекарственного вещества.
  - 3.3. Классификация лекарственных веществ.
  - 3.4. Основные болезни человека и ведущие группы лекарственных веществ на современном фармацевтическом рынке.
4. Синтез лекарственных веществ.

- 4.1. Синтез лекарственных веществ алифатического ряда.
- 4.2. Производные  $\alpha$ -аминокислот. Метионин. Витамин U. Глутаминовая кислота. D-серин. Производные  $\beta$ -аминокислот.
- 4.3. Противозачаточные и противовоспалительные вещества на основе циклопентафенантрена. Синтез витамина D.
- 4.4. Аминоалкилбензолы в качестве психостимуляторов, антибиотиков и гормонов
- 4.5. Производные орто-гидроксibenзойной кислоты. Аспирин.

## **5. Образовательные технологии, в том числе технологии электронного обучения и дистанционные образовательные технологии, используемые при осуществлении образовательного процесса по дисциплине**

В процессе обучения используются следующие образовательные технологии:

**Вводная лекция** – дает первое целостное представление о дисциплине и ориентирует студента в системе изучения данной дисциплины. Студенты знакомятся с назначением и задачами курса, его ролью и местом в системе учебных дисциплин и в системе подготовки в целом. Дается краткий обзор курса, история развития науки и практики, достижения в этой сфере, имена известных ученых, излагаются перспективные направления исследований. На этой лекции высказываются методические и организационные особенности работы в рамках данной дисциплины, а также дается анализ рекомендуемой учебно-методической литературы.

**Академическая лекция** (или лекция общего курса) – последовательное изложение материала, осуществляемое преимущественно в виде монолога преподавателя. Требования к академической лекции: современный научный уровень и насыщенная информативность, убедительная аргументация, доступная и понятная речь, четкая структура и логика, наличие ярких примеров, научных доказательств, обоснований, фактов.

**Лабораторное занятие** – выполнение лабораторной работы обеспечивает закрепление полученных теоретических знаний, обеспечивает освоение навыков самостоятельной лабораторной работы. Формулировка выводов по полученным результатам учит умению анализировать и обобщать полученные экспериментальные данные, развивает логическое мышление.

**Консультации** – групповые занятия, являющиеся одной из форм контроля самостоятельной работы студентов.

В процессе обучения используются следующие технологии электронного обучения и дистанционные образовательные технологии:

**Электронный учебный курс «Основы конструирования лекарственных и биологически активных веществ» в LMS Электронный университет Moodle ЯрГУ**, в котором:

- представлены задания для самостоятельной работы обучающихся по темам дисциплины;
- представлены тексты лекций по отдельным темам дисциплины;
- представлен список учебной литературы, рекомендуемой для освоения дисциплины;
- посредством форума осуществляется синхронное и (или) асинхронное взаимодействие

## **6. Перечень лицензионного и (или) свободно распространяемого программного обеспечения, используемого при осуществлении образовательного процесса по дисциплине**

При осуществлении образовательного процесса используются:

- операционные системы семейства Microsoft Windows;
- программы Microsoft Office;
- программа Adobe Acrobat Reader;
- браузеры Mozilla Firefox, Google Chrome.

## **7. Перечень современных профессиональных баз данных и информационных справочных систем, используемых при осуществлении образовательного процесса по дисциплине (при необходимости)**

При осуществлении образовательного процесса по дисциплине используются:

1. Автоматизированная библиотечно-информационная система «БУКИ-NEXT»  
[http://www.lib.uniyar.ac.ru/opac/bk\\_cat\\_find.php](http://www.lib.uniyar.ac.ru/opac/bk_cat_find.php)
2. Электронно-библиотечная система «Юрайт» <https://www.urait.ru/>
3. Электронно-библиотечная система «Консультант Студента»  
<https://www.studentlibrary.ru/>

## **8. Перечень основной и дополнительной учебной литературы, ресурсов информационно-телекоммуникационной сети «Интернет» (при необходимости), рекомендуемых для освоения дисциплины**

### **а) основная литература**

1. Шабаров, Ю.С. Органическая химия : учебник для вузов / Ю.С. Шабаров. – 5-е изд., стереотип. – СПб.: Лань, 2011. – 847 с.  
[http://www.lib.uniyar.ac.ru/opac/bk\\_cat\\_card.php?rec\\_id=1118979&cat\\_cd=YARSU](http://www.lib.uniyar.ac.ru/opac/bk_cat_card.php?rec_id=1118979&cat_cd=YARSU)
2. Биологическая химия: учеб. пособие для вузов. / под ред. Н.И. Ковалевской; УМО по специальностям пед. образования – 3-е изд., испр. – М.: Академия, 2009. – 255 с.  
[http://www.lib.uniyar.ac.ru/opac/bk\\_cat\\_card.php?rec\\_id=1029290&cat\\_cd=YARSU](http://www.lib.uniyar.ac.ru/opac/bk_cat_card.php?rec_id=1029290&cat_cd=YARSU)
3. Коноплева, Е.В. Фармакология: учебник и практикум для вузов / Е.В. Коноплева. – Москва : Издательство Юрайт, 2018. – 446 с. – (Высшее образование). – ISBN 978-5-534-01500-3. – Текст: электронный // ЭБС Юрайт [сайт]. – URL: <https://urait.ru/bcode/413257>

### **б) дополнительная литература**

1. Урванцева Г.А. Методы анализа живых систем: уч. пособие./ Г.А.Урванцева, Е.Л.Грачева.Яросл. гос. ун-т им.П.Г.Демидова. – Ярославль, ЯрГУ, 2013. – 103 с.  
<http://www.lib.uniyar.ac.ru/edocs/iuni/20130309.pdf>
2. Раменская, Г.В. Фармацевтическая химия : учебник / под ред. Г. В. Раменской. – 3-е изд. (эл). – Москва : Лаборатория знаний, 2019. – 470 с. – ISBN 978-5-00101-647-2. – Текст : электронный // ЭБС "Консультант студента" : [сайт]. – URL : <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785001016472.html>

## **9. Материально-техническая база, необходимая для осуществления образовательного процесса по дисциплине**

Материально-техническая база, необходимая для осуществления образовательного процесса по дисциплине включает в свой состав специальные помещения:

- учебные аудитории для проведения занятий лекционного типа;
- учебные аудитории для проведения лабораторных работ;
- учебные аудитории для проведения групповых и индивидуальных консультаций;
- учебные аудитории для проведения текущего контроля и промежуточной аттестации;
- помещения для самостоятельной работы;
- помещения для хранения и профилактического обслуживания технических средств обучения.

Специальные помещения укомплектованы средствами обучения, служащими для представления учебной информации большой аудитории.


Помещения для самостоятельной работы обучающихся оснащены компьютерной техникой с возможностью подключения к сети «Интернет» и обеспечением доступа в электронную информационно-образовательную среду организации.

Число посадочных мест в лекционной аудитории больше либо равно списочному составу потока, а в аудитории для практических занятий (семинаров), лабораторных – списочному составу группы обучающихся.

В ходе образовательного процесса будут использовано следующее оборудование: магнитные мешалки ПЭ-6100, перемешивающие устройства ПЭ8310, встряхиватель ПЭ-6300, реактор В205-503, ротационный испаритель RV 06-ML 1-В, измерительная система L-микро РСМ, вытяжные шкафы-6 шт., холодильник STINOL, сушильный шкаф для посуды HS 32А, иономер И-500, сушильный шкаф для веществ SPT-200, шкафы вытяжные, прибор для определения температуры плавления PG HS 30А/С, ультратермостат УТУ-2/77; набор химической посуды, набор химических реактивов.

Автор:

Профессор института  
фундаментальной и прикладной химии, д.х.н.

  
\_\_\_\_\_ В.Ю. Орлов



**Приложение №1 к рабочей программе дисциплины  
«Основы конструирования лекарственных и биологически активных веществ»**

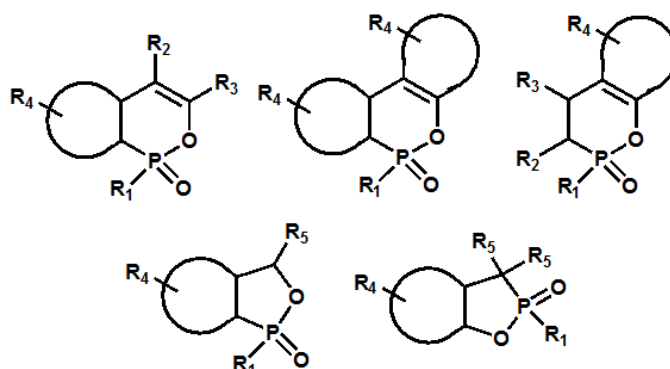
**Фонд оценочных средств  
для проведения текущего контроля успеваемости  
и промежуточной аттестации студентов  
по дисциплине**

**1. Типовые контрольные задания и иные материалы,  
используемые в процессе текущего контроля успеваемости**

**Практическое задание**

Примерные вопросы:

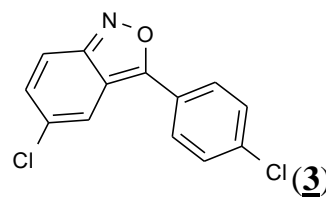
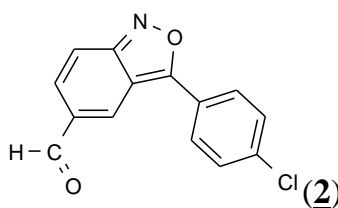
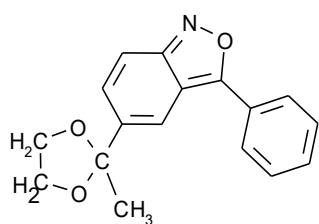
Осуществить *дизайн* физиологически активных веществ (составить библиотеку соединений, отвечающих следующим требованиям)

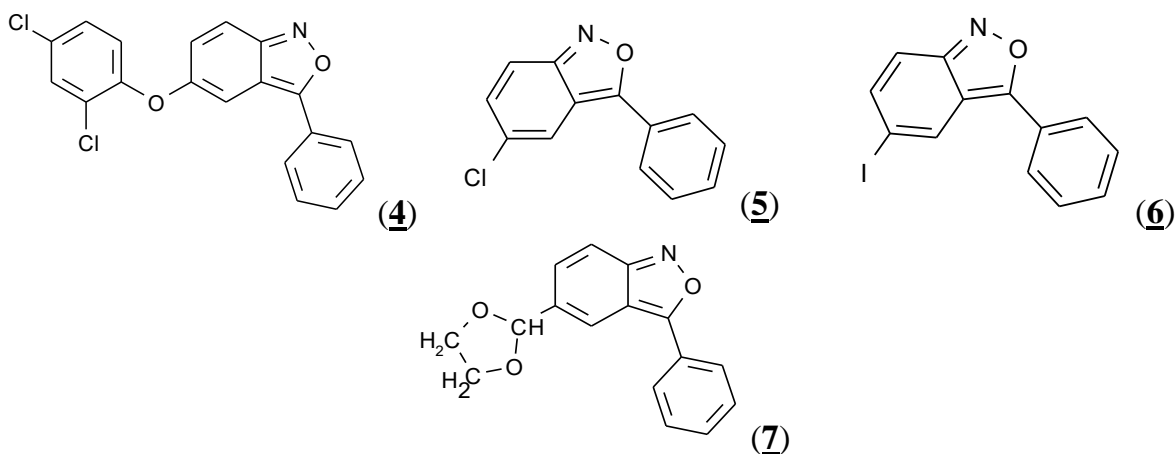


Где:

Заместители R	R1=alkyl, OH, O-Alkyl or H R2=Aryl, hetaryl, H or alkyl R3 = Aryl, hetaryl, H or alkyl R4 = Any substituent, including H R5 = Alkyl, Aryl Number of rings < or equal to 4
Молекулярный вес	250 - 450
LogP	-1 to 4.5

С помощью корреляционного анализа *вывести уравнения*, прогнозирующие токсичность (мутагенное и цитотоксическое действие) производных 2,1-бензизоксазола на основе экспериментальных данных для соединений:





Мутагенное и цитотоксическое действие

В-ВО	конц., %	выж-ть.,	% выж-ти., N	мут-ген.	мута-ции, %, M	$\sigma$ выж-ти.	$\sigma$ мут-ти.	$\bar{m}$ выж-ти.	$\bar{m}$ мут-ти.
1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
<u>1</u>	0.5	469.7	92.0	9.0	1.9	5.51	1.00	$\pm 3.89$	$\pm 0.71$
	0.25	461.0	90.3	6.3	1.4	2.00	0.58	$\pm 1.41$	$\pm 0.41$
	0.125	501.3	98.2	7.3	1.5	2.08	0.58	$\pm 1.47$	$\pm 0.41$
	0.05	465.0	91.1	5.3	1.1	5.20	0.58	$\pm 3.67$	$\pm 0.41$
<u>2</u>	0.5	453.3	88.8	8.3	1.8	5.51	0.58	$\pm 3.89$	$\pm 0.41$
	0.25	486.0	95.2	10.7	2.2	5.57	1.16	$\pm 3.94$	$\pm 0.82$
	0.125	490.7	96.1	7.7	1.6	1.53	0.58	$\pm 1.08$	$\pm 0.41$
	0.05	478.0	93.6	8.3	1.7	2.65	0.58	$\pm 1.87$	$\pm 0.41$
<u>3</u>	0.5	187.3	36.7	14.3	7.7	5.51	2.09	$\pm 3.89$	$\pm 1.47$
	0.25	233.3	45.7	13.0	5.6	4.51	1.00	$\pm 3.19$	$\pm 0.71$
	0.125	309.3	60.6	10.7	3.4	5.86	0.58	$\pm 4.14$	$\pm 0.41$
	0.05	408.3	80.0	9.3	2.3	6.11	0.58	$\pm 4.32$	$\pm 0.41$
<u>4</u>	0.5	347.7	68.1	5.7	1.6	5.51	0.58	$\pm 3.89$	$\pm 0.41$
	0.25	400.7	78.5	3.7	0.9	2.52	0.58	$\pm 1.78$	$\pm 0.41$
	0.125	473.3	92.7	5.0	1.1	6.51	1.00	$\pm 4.60$	$\pm 0.71$
	0.05	504.0	98.7	7.0	1.4	3.61	1.00	$\pm 2.55$	$\pm 0.71$
<u>5</u>	0.5	422.0	82.6	16.3	3.9	3.61	1.53	$\pm 2.55$	$\pm 1.08$
	0.25	445.7	87.3	14.7	3.3	2.52	1.53	$\pm 1.78$	$\pm 1.08$
	0.125	464.7	91.0	9.0	1.9	2.52	1.00	$\pm 1.78$	$\pm 0.71$
	0.05	489.7	95.9	7.0	1.4	2.52	1.00	$\pm 1.78$	$\pm 0.71$
<u>6</u>	0.5	147.3	28.8	6.3	4.3	6.11	0.58	$\pm 4.32$	$\pm 0.41$
	0.25	173.7	34.0	7.3	4.2	4.51	0.58	$\pm 3.19$	$\pm 0.41$
	0.125	203.0	39.7	10.3	5.1	3.00	0.58	$\pm 2.12$	$\pm 0.41$
	0.05	321.3	62.9	6.7	2.1	5.86	0.58	$\pm 4.14$	$\pm 0.41$
<u>7</u>	0.5	464.0	90.9	8.3	1.8	5.57	0.58	$\pm 3.94$	$\pm 0.41$
	0.25	461.3	90.3	9.3	2.0	5.51	0.58	$\pm 3.89$	$\pm 0.41$
	0.125	471.0	92.2	10.3	2.2	2.00	0.58	$\pm 1.41$	$\pm 0.41$
	0.05	471.7	92.4	11.3	2.4	2.52	0.58	$\pm 1.78$	$\pm 0.41$
контроль		510.7	100.0	3.3	0.7	1.02	0.58	$\pm 0.72$	$\pm 0.41$

Используя полученные уравнения *сконструировать по два соединения* (2,1-бензизоксазолы) с *большой и меньшей* токсичностью чем данные 2,1-бензизоксазолы.

Для сконструированных соединений *осуществить прогноз* биоактивности с помощью программы PASS.

Для прогнозирования спектра биологической активности веществ организован сайт <http://www.ibmh.msk.su/PASS>.

### Критерии оценивания результатов текущего контроля успеваемости

Форма текущего контроля успеваемости	Правила выставления оценки
Практическое задание	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <i>Отлично</i> выставляется, если обучающийся выполнил работу (общий процент выполнения заданий не менее 90%), демонстрирует знания теоретического и практического материала по теме работы, даёт правильный алгоритм решения.</li> <li>- <i>Хорошо</i> выставляется, если обучающийся выполнил работу с небольшими недочетами (общий процент выполнения заданий не менее 70%), демонстрирует знания теоретического и практического материала по теме работы, допуская незначительные неточности при их применении и выборе алгоритма решения.</li> <li>- <i>Удовлетворительно</i> выставляется, если обучающийся в целом выполнил работу (общий процент выполнения заданий не менее 50%), допуская существенные недочеты, в том числе при выборе алгоритма решения.</li> <li>- <i>Неудовлетворительно</i> выставляется, если обучающийся не справился с выполнением задания (общий процент выполнения заданий менее 50%), не смог выбрать алгоритм его решения, продемонстрировав существенные пробелы в знаниях основного учебного материала.</li> </ul>
Лабораторная работа	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <i>Отлично</i> выставляется, если обучающийся имеет глубокие знания учебного материала по теме лабораторной работы, показывает усвоение взаимосвязи основных понятий используемых в работе, смог ответить на все уточняющие и дополнительные вопросы, демонстрирует знания теоретического и практического материала по теме лабораторной работы, определяет взаимосвязи между показателями задачи, даёт правильный алгоритм решения, определяет междисциплинарные связи по условию задания.</li> <li>- <i>Хорошо</i> выставляется, если обучающийся показал знание учебного материала, усвоил основную литературу, смог ответить почти полно на все заданные дополнительные и уточняющие вопросы. Обучающийся демонстрирует знания теоретического и практического материала по теме лабораторной работы, допуская незначительные неточности при решении задач, имея неполное понимание междисциплинарных связей при правильном выборе алгоритма решения задания.</li> <li>- <i>Удовлетворительно</i> выставляется, если обучающийся в целом освоил материал лабораторной работы, ответил не на все уточняющие и дополнительные вопросы, обучающийся затрудняется с правильной оценкой предложенной задачи, даёт</li> </ul>

	<p>неполный ответ, требующий наводящих вопросов преподавателя, выбор алгоритма решения задачи возможен при наводящих вопросах преподавателя.</p> <p>- <i>Неудовлетворительно</i> выставляется обучающемуся, если он имеет существенные пробелы в знаниях основного учебного материала лабораторной работы, который полностью не раскрыл</p>
--	---

Фонды оценочных средств по дисциплине предусматривают проверку индикаторов достижения компетенций.

## 2. Список вопросов и (или) заданий для проведения промежуточной аттестации

### Список вопросов к зачету

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, scaffold*.
3. 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.
4. Синтез лекарственных веществ алифатического ряда. Синтез общих анестетиков. Синтез антираковых препаратов.
5. Алканола, аминоалканола и их эфиры. Получение этанола. Синтез диэтилового эфира. Синтез мепротана. Сложные эфиры азотистой и азотной кислот. Производные холина.
6. Альдегиды и кислоты. Получение хлораля. Уротропин. Гамма-гидроксibuтират натрия. Витамины F и B<sub>15</sub>.
7. Производные α-аминокислот. Метионин. Витамин U. Глутаминовая кислота. D-серин. Производные β-аминокислот. Витамин B<sub>3</sub> (пантотеновая кислота). Производные γ-аминомасляной кислоты. Нейротропные средства. Витамин B<sub>7</sub>.
8. Олигомеры α-аминокислот. Грамицидин S. Эндогенные пептиды. Пептидные гормоны. Инсулин. Ангиотензины II и I. Фермент ренин. Вторичные мессенджеры.
9. Лекарственные вещества алициклического ряда. Ментол. Витамин A.
10. Противозачаточные и противовоспалительные вещества на основе циклопентафенантрена. Синтез витамина D.
11. Камфора. Производные адамантана в качестве противовирусных средств.
12. Аминоалкилбензолы в качестве психостимуляторов, антибиотиков и гормонов.
13. Антигистаминные препараты группы диарилметана.
14. Антисептики и адреноблокаторы фенольного ряда.
15. Аминофенолы в качестве обезболивающих и противотуберкулезных средств.
16. Производные орто-гидроксibenзойной кислоты. Аспирин.
17. Средства на основе пара-аминобензойной кислоты.
18. Производные пара-аминобензолсульфокислоты.
19. Оксопроизводные нафталина.
20. Лекарственные вещества группы азиридина и оксирана.
21. Антибиотики, содержащие четырехчленное азетидиновое ядро.
22. Пенициллины. Цефалоспорины.

## Правила выставления оценки на зачете

Устный ответ на зачете оценивается по 2-х балльной системе.

Отметка «зачтено» ставится, если:

- знания отличаются глубиной и содержательностью, дается полный исчерпывающий ответ, как на основные вопросы к зачету, так и на дополнительные;
- студент свободно владеет научной терминологией;
- ответ студента структурирован, содержит анализ существующих теорий, научных школ, направлений и их авторов по вопросу билета;
- логично и доказательно раскрывает проблему, предложенную для решения;
- ответ характеризуется глубиной, полнотой и не содержит фактических ошибок;
- ответ иллюстрируется примерами, в том числе из собственной практики;
- студент демонстрирует умение аргументировано вести диалог и научную дискуссию.

Отметка «незачтено» ставится, если:

- обнаружено незнание или непонимание студентом сущностной части дисциплины;
- содержание вопросов билета не раскрыто, допускаются существенные фактические ошибки, которые студент не может исправить самостоятельно;
- на большую часть дополнительных вопросов по содержанию экзамена студент затрудняется дать ответ или не дает верных ответов.

## **Приложение №2 к рабочей программе дисциплины «Основы конструирования лекарственных и биологически активных веществ»**

### **Методические указания для студентов по освоению дисциплины**

Основной формой изложения учебного материала по дисциплине «Основы конструирования лекарственных и биологически активных веществ» являются лекции. По большинству тем предусмотрены лабораторные занятия, на которых происходит закрепление лекционного материала путем применения его к конкретным задачам. На лабораторных занятиях предусмотрена отработка навыков конструирования биологически активных соединений, их синтеза, определения параметров химических соединений и интерпретации полученных результатов.

Для успешного освоения дисциплины очень важно построение достаточно большого количества моделей, как в аудитории, так и самостоятельно в качестве домашних заданий. Примеры решения подобных задач разбираются на лекциях и лабораторных занятиях, при необходимости по наиболее трудным темам проводятся дополнительные консультации. Основная цель подобных заданий – помочь усвоить фундаментальные понятия и основы взаимосвязи между химическим строением и биологической активностью химических соединений. Для решения всех предлагаемых заданий необходимо знать и понимать лекционный материал. Поэтому в процессе изучения дисциплины рекомендуется регулярное повторение пройденного лекционного материала. Материал, законспектированный на лекциях, необходимо дома еще раз прорабатывать и при необходимости дополнять информацией, полученной на консультациях, лабораторных занятиях или из учебной литературы.

Большое внимание должно быть уделено выполнению домашней работы. В качестве заданий для самостоятельной работы дома студентам предлагаются задания, аналогичные разобранным на лекциях и лабораторных занятиях или немного более сложные, которые являются результатом объединения нескольких базовых задач.

Для проверки и контроля усвоения теоретического материала, приобретенных практических навыков работы в лаборатории, в течение обучения проводятся мероприятия текущей аттестации в виде опросов и отчетов о лабораторных работах. Также проводятся консультации (при необходимости) по разбору заданий для самостоятельной работы, которые вызвали затруднения.

В конце изучения дисциплины студенты сдают зачет. Зачет по итогам семестра выставляется по результатам текущей успеваемости и краткого собеседования.

Освоить вопросы, излагаемые в процессе изучения дисциплины «Основы конструирования лекарственных и биологически активных веществ», самостоятельно студенту крайне сложно. Это связано со сложностью изучаемого материала и большим объемом курса. Поэтому посещение всех аудиторных занятий является совершенно необходимым. Без упорных и регулярных занятий в течение семестра сдать зачет по итогам изучения дисциплины студенту практически невозможно.

### **Учебно-методическое обеспечение самостоятельной работы студентов по дисциплине**

Для самостоятельной работы студентов рекомендуется использовать литературу, указанную в разделе 8 данной программы.

Также для подбора учебной литературы рекомендуется использовать ряд интернет-ресурсов:

1. [http://www.lib.uniyar.ac.ru/opac/bk\\_cat\\_find.php](http://www.lib.uniyar.ac.ru/opac/bk_cat_find.php) Электронная библиотека учебных материалов ЯрГУ: более 3000 полных текстов учебных и учебно-методических материалов по основным изучаемым дисциплинам, изданных в университете.

2. <https://urait.ru/> Электронно-библиотечная система «Юрайт»: мультидисциплинарный ресурс (учебная, научная и художественная литература, периодика)
3. <http://window.edu.ru/catalog> Информационная система "Единое окно доступа к образовательным ресурсам": свободный доступ к интегральному каталогу образовательных интернет-ресурсов и к электронной библиотеке учебно-методических материалов для общего и профессионального образования.