

МИНИСТЕРСТВО ПРОСВЕЩЕНИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ФЕДЕРАЛЬНОЕ
ГОСУДАРСТВЕННОЕ БЮДЖЕТНОЕ
ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ
«ЛУГАНСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ ПЕДАГОГИЧЕСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ»
(ФГБОУ ВО «ЛГПУ»)

Факультет естественных наук

Кафедра химии и биохимии

УТВЕРЖДАЮ

Врио декана факультета
естественных наук

М.В. Воронов

«16» декабря 2013 г.



РАБОЧАЯ ПРОГРАММА УЧЕБНОЙ ДИСЦИПЛИНЫ

Фармацевтическая химия

По направлению подготовки 44.03.05 Педагогическое образование (с двумя профилями подготовки)

Профиль подготовки Химия. Биология

Квалификация выпускника бакалавр

Форма обучения очная, заочная

Курс 5

Луганск, 2013

Рабочая программа учебной дисциплины является частью основной профессиональной образовательной программы для подготовки бакалавров по направлению подготовки 44.03.05 Педагогическое образование (с двумя профилями подготовки) и профилю Химия. Биология очной и заочной форм обучения.

Рабочая программа учебной дисциплины разработана в соответствии с ФГОС ВО – бакалавриат по направлению подготовки 44.03.05 Педагогическое образование (с двумя профилями подготовки), утвержденным приказом Министерства образования и науки Российской Федерации от 22 февраля 2018 г. № 125 (с изменениями и дополнениями) и Профессиональным стандартом, утвержденным Приказом Министерства труда и социальной защиты Российской Федерации «Об утверждении профессионального стандарта» от 18 октября 2013 г. № 544н (с изменениями и дополнениями).

СОСТАВИТЕЛЬ:

доцент кафедры химии и биохимии ФГБОУ ВО «ЛГПУ», кандидат химических наук, доцент
Дяченко Иван Владимирович.

Утверждена на заседании кафедры химии и биохимии

Протокол от «01» декабря 20 23 г. № 6

Заведующий кафедрой химии и биохимии



В.Д. Дяченко

Одобрена на заседании учебно-методической комиссии факультета естественных наук

Протокол от «12» декабря 20 23 г. № 6

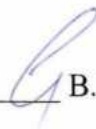
Председатель учебно-методической комиссии
факультета естественных наук



С.Н. Несторенко

СОГЛАСОВАНО:

Заведующий учебно-методическим отделом



В.В. Савенков

1. Цели и задачи учебной дисциплины

Цель изучения дисциплины – раскрыть методологию создания, оценки качества, стандартизации и безопасности лекарственных средств на основе общих закономерностей химико-биологических наук, их частных проявлений и истории применения лекарств в соответствии с прикладным характером фармацевтической химии.

Задачи: дать ориентацию в свойствах и анализе лекарственных средств в соответствии с современными требованиями к качеству, особенностями получения и перспективами создания безопасных лекарственных средств; представить целостную систему теоретических основ фармацевтической химии; показать взаимосвязь процессов при разработке новых и существующих методов контроля качества лекарственных средств на этапах разработки, производства и потребления; рассмотреть пути реализации общих принципов фармацевтической химии при создании новых лекарственных веществ и при оценке качества лекарственных средств.

2. Место дисциплины в структуре ОПОП

Учебная дисциплина «Фармацевтическая химия» входит в часть, формируемую участниками образовательных отношений (Б1.В.09), дисциплин подготовки студентов.

Необходимыми условиями для освоения учебной дисциплины являются знания общей химии, умения прослушивать и осмысливать лекционный материал, навыки решения задач в ходе выполнения индивидуальных заданий по основным разделам курса.

Содержание дисциплины является логическим продолжением содержания дисциплин «Неорганическая химия», «Органическая химия», «Аналитическая химия», «Физическая и коллоидная химия», и служит основой для дальнейшего освоения дисциплин «Биоорганическая химия», «Химическая технология», «Химия высокомолекулярных соединений».

3. Перечень планируемых результатов обучения по дисциплине (модулю), соотнесенных с индикаторами достижения компетенций

Код по ФГОС ВО	Индикатор достижения	Результаты обучения по дисциплине
Профессиональные		
ПК-2. Способен выделять структурные элементы, входящие в систему познания предметной области (в соответствии с профилем и уровнем	ПК-2.3. Анализирует глобальные экологические проблемы; применять базовые понятия общей экологии, принципы оптимального	Знает: как установить взаимосвязь между фактами и теорией, причиной и следствием при анализе проблемных ситуаций и обосновании принимаемых

обучения), анализировать их в единстве содержания, формы и выполняемых функций	<p>природопользования и охраны природы, социально-экологические законы взаимоотношения человека и природы</p> <p>ПК-2.4. Устанавливает взаимосвязи между фактами и теорией, причиной и следствием при анализе проблемных ситуаций и обосновании принимаемых решений на основе базовых химических знаний</p> <p>ПК-2.5. Проводит системный анализ химических проблем экологии и вопросов состояния окружающей среды, рационального использования природных ресурсов</p>	<p>решений на основе базовых химических знаний.</p> <p>Умеет: проводить системный анализ химических проблем экологии и вопросов состояния окружающей среды, рационального использования природных ресурсов.</p> <p>Владеет навыками: анализа глобальных экологических проблем и применения базовых понятий общей экологии, принципы оптимального природопользования и охраны природы, социально-экологические законы взаимоотношения человека и природы.</p>
ПК-3. Способен соотносить основные этапы развития предметной области (в соответствии с профилем и уровнем обучения) с ее актуальными задачами, методами и концептуальными подходами, тенденциями и перспективами ее современного развития	<p>ПК-3.1. Сопоставляет основные исторические этапы становления органического мира</p> <p>ПК-3.2. Обосновывает роль методических и методологических подходов в формировании концептуальных принципов, тенденций, перспектив современного развития представлений об иерархическом принципе организации живой материи</p> <p>ПК-3.3. Выделяет основные этапы и закономерности развития химической науки и применяет их при анализе полученных результатов</p> <p>ПК-3.4. Определяет перспективы развития современной химической науки</p>	<p>Знает: как обосновать роль методических и методологических подходов в формировании концептуальных принципов, тенденций, перспектив современного развития представлений об иерархическом принципе организации живой материи.</p> <p>Умеет: сопоставлять основные исторические этапы становления органического мира и выделяет основные этапы и закономерности развития химической науки, а также применяет их при анализе полученных результатов.</p> <p>Владеет навыками: определения перспективы развития современной химической науки.</p>

4. Структура и содержание учебной дисциплины

4.1. Объем учебной дисциплины и виды учебной работы

Вид учебной работы	Объем часов / зачетных единиц	
	Очная форма	Очно-заочная форма / Заочная форма
Общая трудоемкость дисциплины	180 (5 зач. ед)	180 (5 зач. ед)

Обязательная аудиторная нагрузка (всего часов), в том числе:	60	20
Лекции	26	6
Семинарские занятия	-	-
Практические занятия	-	-
Лабораторные работы	34	14
Курсовая работа / курсовой проект	-	-
Другие формы организации учебного процесса (контрольные работы, индивидуальные занятия, консультации и др.)	-	-
Самостоятельная работа студента (всего часов)	120	160
Форма аттестации	Экзамен (9 семестр)	Экзамен (15 триместр)

4.2. Содержание разделов учебной дисциплины

Раздел 1. Предмет и методы фармацевтической химии. Неорганические и органические лекарственные средства

Тема 1. Предмет и основное содержание фармацевтической химии. Физико-химические методы исследования лекарственных препаратов. Оптические методы исследования веществ. Физические основы и методы исследования инфракрасного излучения. Характерные или групповые колебания. Валентные и деформационные колебания. Симметричные и антисимметричные колебания. Проявление групп в ИК-спектре: $-\text{C}\equiv\text{N}$, $>\text{C}=\text{O}$, $-\text{SH}$, $-\text{OH}$, $-\text{NH}_2$, $-\text{COOR}$. Влияние двойных связей и других факторов на положение полосы поглощения функциональных групп. Растворители в ИК-спектроскопии. Сущность УФ-спектроскопии. Правила, которые определяют условия запрета поглощения в спектре (4 правила). Поглощение алифатических насыщенных и ненасыщенных соединений. Проявление карбонильных соединений в УФ-спектрах. Группы с кратными связями: $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}=\text{N}-$, $>\text{S}=\text{O}$. Ароматические и гетероциклические соединения в УФ-спектрах. ЯМР-спектроскопия. Магнитные моменты ядер. Протонный магнитный резонанс. Химический сдвиг. Сильное и слабое поля. Спин-спиновое взаимодействие. Взаимодействие через пространство. Двумерная ЯМР-спектроскопия. Рефрактометрия. Методика и приборы рефрактометрического анализа. Поляриметрический метод анализа. Вращение плоскости поляризации света. Анализ антибиотиков с помощью поляриметрии. Фотометрия и фотоколориметрия. Хроматография. Основные типы хроматографии. Потенциометрия и полярография. Строение потенциометрических приборов. Растворимость. Растворители в фармацевтической химии. Химические методы исследования. Реакции на функциональные группы, анионы и катионы.

Тема 2. Общие методы введения функциональных групп и модификации молекул. Способы окисления органических соединений. Окисление кислородом воздуха. Окисление с помощью перекиси водорода. Окисление с помощью сильных окислителей (перманганат калия, серная кислота, азотная кислота, дихромат калия). Восстановление органических соединений. Сильные восстановители. Мягкое и не полное восстановление. Примеры широко используемых восстановителей. Галогенирование с помощью галогенов. Мягкое галогенирование. Галогенирующие реагенты. Механизмы галогенирования. Методы ввода нитрогрупп. Нитрование. Восстановление нитрогруппы. Введение аминогрупп и модификация уже существующих групп в аминогруппы. Получение производных гидразина. Сульфирование. Триоксид серы и гидросульфониевый катион как сульфирующие агенты. Селективность реакций сульфирования. Сульфохлорирование. Синтез сахараина. Синтез белого стрептоцида. Восстановление сульфогруппы. Введение гидроксильных групп. Получение алколюлятов и фенолятов. Качественные реакции на гидроксильную группу. Взаимодействие с водой. Важные реакции гидролиза. Алкилирование. Алкилирующие реагенты. Введение алкильного заместителя в ароматическое кольцо. Нарастивание алкильного заместителя. Введение ацильных групп. Условия N- и O-ацилирования. Ацилирующие реагенты. Условия снятия ацильной защиты. Методы введения альдегидных и карбонильных групп. Альдольная конденсация как метод модификации молекул. Реакции присоединения по Михаэлю. Взаимодействие альдегидов с аминами. Методы ввода карбоксильных групп. Получение амидов кислот. Перегруппировка амидов по Гофману. Получение солей карбоновых кислот. Конденсация Кляйзена. Методы удаления карбоксильных групп. Введение нитрильной группы. Основные пути модификации нитрильной группы. Универсальные реакции введения функциональных групп (реакция Зандмейера). Реакция с участием диазогруппы. Реакция Меервейна. Защита групп в многостадийном синтезе. Защитные группы. Введение и последующее удаление защитных групп. Направление протекания реакций. Селективность протекания реакций. Региоселективные и региоспецифичные продукты. Реакции циклизации. Получение циклических соединений. Синтез карбоциклов. Синтез малых циклов с помощью карбенов. Циклизация с помощью реакции Дильса-Альдера (примеры и механизм). Циклизация по Михаэлю (примеры и механизм). Реакции гетероциклизации. Реакции замыкания цикла. Методы синтеза гетероциклических соединений. Синтез оксиранов. Синтез фурфурола из альдопентозы. Конденсация α -галогенкетонов с β -кетокислотами. Синтез пирролов. Синтез пирролов из 1,4-дикарбонильных соединений и первичных аминов (синтез по Паалю-Кнорре). Синтез тиафенов из 1,4- и 1,3-

дикарбонильных соединений. Синтез тиазолов конденсацией α -галогенкетон с тиаамидами. Синтез других гетероциклов: пиразола (1,2-диазола), имидазола (1,3-диазола), индола. Синтез пиранов. Синтез пиридина по Ганчу. Синтез хинолина: синтез по Скраупу, синтез по Дебнеру-Миллеру, синтез Фридлендера. Синтез изохинолинового ядра (Бишлер-Напиральский, Пиктэ-Шпенглер, Померанц-Фрич). Синтез акридина и карбазола.

Тема 3. Неорганические фармацевтические препараты. Использование элементов-органогенов, макроэлементов, микроэлементов, ультрамикроэлементов в фармацевтической химии. Седьмая группа периодической системы: фтор, хлор, бром, йод. Использование и значение соединений галогенов: бескислородных кислот, солей бескислородных кислот (анализ 10 % йодида калия, анализ хлорида натрия), хлорную известь. Их лечебные формы. Шестая группа периодической системы – кислород (вода, перекись водорода – анализ 3 % раствора), сера (тиосульфат натрия – анализ 3 % раствора). Пятая группа периодической системы – соединения азота (оксид азота (I), нитрит натрия), соединения мышьяка (ангидрид мышьяка, арсенат натрия). Антидот мышьяка. Третья группа периодической системы – соединения бора (борная кислота – анализ борной кислоты, тетраборат натрия). Вторая группа периодической системы – соединения магния (сульфат магния – анализ 10 % раствора), соединения кальция (хлорид кальция – анализ 10 % раствора), соединения бария (сульфат бария), соединения цинка (сульфат цинка, оксид цинка), соединения ртути (дихлорид ртути (I), оксид ртути (II), амидохлорид ртути). Антидот ртути. Первая группа периодической системы – соединения меди и серебра (нитрат серебра – анализ 2 % раствора). Восьмая группа периодической системы – соединения железа (железо восстановленное).

Тема 4. Ациклические и карбоциклические фармацевтические препараты. Стероидные гормоны и их синтетические заменители. Галогенпроизводные углеводороды алифатического ряда: хлороформ, фторотан, йодоформ. Спирты. Этиловый спирт. Производные аминоспиртов: адреналина гидротартрат, мезатон, эфедрин гидрохлорид. Альдегиды. Раствор формальдегида. Формалин. Уротропин. Хлоральгидрат. Карбоновые кислоты и аминокислоты. Лактат кальция. Цитрат натрия. Гидроцитрат натрия. Глютаминовая кислота. Аминалон. Ароматические кислоты и их соли – бензойная кислота, бензоат натрия. Производные аминокислот: анестезин, новокаин, дикаин, *n*-аминосалицилат натрия, бепаск. Эфиры. Димедрол. Эфиры: нитроглицерин. Амиды угольной кислоты и их производные: мепротан, бромизовал. Фенолы: резорцин. Фенолокислоты и их производные: салициловая кислота, салицилаты натрия, фенилсалицилат, ацетилсалициловая кислота. Сульфаниламиды: стрептоцид, стрептоцид растворимый, сульфацил-натрия, норсульфазол,

норсульфазол-натрия, сульфадимезин, фталазол, сульфадиметоксин, сульфален. Терпеноиды. Моноциклические терпеноиды: ментол, валидол, терпингидрат. Бициклические терпеноиды: камфора, бромкамфора. Стероидные гормоны. Определение гормонов. Определение стероидных гормонов. Основа строения стероидных гормонов. Группы стероидных гормонов. Классификация половых гормонов. Мужские половые гормоны. Химические признаки андрогенов. Применение мужских гормонов в фармацевтической химии. Тестостерон пропионат – синтез, органолептические свойства, методы идентификации. Тестостерон энантат – строение, применение. Метилтестостерон – реакции идентификации. Антиандрогены. Финастерид, флютамид. Анаболические средства. Отличие анаболиков от андрогенов. Методы снижения андрогенной активности. Метиландростендиол, метандростенолон – реакции идентификации, органолептические свойства. Женские половые гормоны и их синтетические заменители. Химические признаки эстрогенов. Применение эстрогенов. Эстрон – синтез из холестерина, реакции идентификации. Этинилэстрадиол, эстрадиолдипропионат – строение, фармакологическое применение. Синтетические эстрогены нестероидного строения: синестрол (синтез, идентификация, действие), диэтилстильбэстрол и диместрол. Эстрогены как противоопухолевые средства – эстрацит, хлортрианизен (синтез, реакции идентификации). Антиэстрогены. Кломифенцитрат, тамоксифен. Гормоны беременности и их синтетические заменители. Прогестерон и синтетические заменители гестагенов. Препараты, предотвращающие беременность - ригевидон, нон-овлон, бисекурин, инфекундин, и другие пероральные контрацептивы. Преобразование и биосинтез гормонов в организме. Особенности метаболизма гормонов мужчин и женщин в организме. Гормональная терапия.

Тема 5. Производные фурана, бензофурана, пирана и бензопирана. История открытия гетероциклических лекарственных препаратов. Классификация гетероциклических препаратов. Основные классы наиболее распространенных препаратов. Классификация кислородсодержащих гетероциклических соединений, которые используются в фармацевтике. Кислородсодержащие гетероциклы в природе. Производные нитрофурфуrolа как лекарственные препараты. Использование и реакции идентификации фурацилина. Изменение окраски нитрофурфуrolов в щелочной среде. Фурадонин – реакции идентификации и применение. Особенности использования фурагина и фурагина растворимого. Синтез фуразолидона и реакции идентификации. Производные фурана и бензофурана. Фуросемид и бензобромарон – особенности действия и реакции идентификации. Производные бензофурана – антиаритмические средства (кордарон). Реакции

идентификации. Гиполипидемические средства: зокор, ловастатин. Понятие «пролекарства». Особенность действия этих препаратов. Производные 4-оксикумарина. Витамин К₃ – значение в организме, участие в метаболических процессах. Сходство структуры витамина К₃ и производных 4-оксикумарина. Неодикумарин – синтез, реакции идентификации, применение. Фепромарон – реакции идентификации, применение. Синтез синкумара. Производные фурукумарина как фотосенсибилизаторы. Синтез фурукумаринов. Псорален. Использование псоралена. Производные дигидробензопирана – хромановые витамины. Токоферолацетат – синтез, реакции идентификации и применение. Значение витаминов группы Е. Производные флавана (2-фенилхроман). Кверцетин и рутин – реакции идентификации и применение. Группа ангиопротекторов (троксевазин). Гепатопротекторы (катерген).

Тема 6. Производные тиазола и тиазолидина. Антибиотики-пенициллины. Антибиотики-цефалоспорины. Лекарственные препараты с тиазольными и тиазолидиновыми циклами. Средства, влияющие на центральную нервную систему. Противогистаминные препараты. Противодиабетические средства. Механизм действия противодиабетических препаратов. Открытие и использование первых антибиотиков. Современная классификация антибиотиков. Общая формула антибиотиков-пенициллинов. Номенклатура пенициллинов. Биосинтез молекул антибиотиков. Действие антибиотиков на микроорганизмы. Классификация воздействий антибиотиков в отношении пенициллин-связывающих белков. Аффинитет (сродство) антибиотиков. Общие фармакопейные реакции на пенициллины (цветные реакции с муравьиным альдегидом и серной кислотой). Идентификация пенициллинов с помощью тонкослойной хроматографии. Пенициллины I поколения. Представители и действие пенициллинов. Количественное определение пенициллина с помощью йодометрии. Бензилпенициллин натрия и бензилпенициллин калия – реакции идентификации и применение. Особенности использования бензилпенициллин новокаина. Бициллин-1 – реакции идентификации и количественное определение. Бициллин-5. Феноксиметилпенициллин – особенности использования и реакции идентификации. Пенициллины II поколения. Разница между I и II поколениями антибиотиков в строении и действии. Методы получения антибиотиков II поколения. Оксациллин натрия – определение препарата и применение. Диклоксациллин натрия. Устойчивость пенициллина II поколения к действию желудочной кислоты, пенициллиназы. Карбенициллин динатрия, карфециллин – применение. Ампициллин и ампициллина тригидрат, ампициллин натрия – действие, реакции идентификации и отличие использования препаратов. Бакампициллин, пиперациллин натрия, мезлоциллин натрия – действие и использование препаратов. Амоксициллин –

реакции идентификации. Пенициллины III поколения. Химические основания, которые приводят к инаktivации β -лактамаз. Ингибиторы I и II классов. Амоксиклав – использование и действие на различные классы микроорганизмов. Сультамициллин – действие препарата, использование препарата в современной практике. Сравнительная характеристика пенициллинов I, II и III поколений. Открытие и использование первых цефалоспоринов. Современные направления синтеза и модификации антибиотиков. Общая формула антибиотиков-цефалоспоринов. Номенклатура цефалоспоринов. Синтез цефалоспоринов. Особенности действия антибиотиков-цефалоспоринов на микроорганизмы. Синтез цефалоспоринов из пенициллинов. Цефалоспорины I поколения. Количественное определение цефалоспоринов. Определение качества цефалоспоринов на поточном производстве. Цефалоридин – реакции идентификации, действие и применение препарата. Цефазолин – реакции идентификации и количественное определение. Особенности использования и реакции идентификации цефалотина натрия. Цефалексин – действие и применение антибиотика. Фармакологическое назначения цефадроксила. Другие препараты (цефрадин, цефапирин натрия) – действие и назначение. Цефалоспорины II поколения. Разница между I и II поколениями цефалоспоринов в строении и действии. Цефаклор – определение препарата и назначение. Цефамандол – ограничение к употреблению и назначение. Цефуроксим, цефуроксима аксетил – применение. Цефалоспорины III поколения. Цефтриаксон натрия – реакции идентификации, применение. Цефтизоксим, цефотаксим, цефиксим, цефтазидим, цефпирамид, цефоперазон, сульперазон – действие, назначение, дозы препаратов, общее и отличное в строении препаратов. Цефалоспорины IV поколения. Цефметазол, цефокситин, цефпиром – особенности действия и применение. Сравнительная характеристика цефалоспоринов I, II, III и IV поколений. Перспективы синтеза новых антибиотических препаратов на основе цефема.

Тема 7. Производные фенотиазина. Строение молекулы фенотиазина. Лекарственные препараты производные фенотиазина. Основные фармакологические группы препаратов на основе фенотиазина. Классификация препаратов-фенотиазинов. Соединения, не содержащие атомов фтора в молекулах. Фенотиазины с диалкиламиноалкильными заместителями в положении 10. Нейролептические средства. Хлорпромазина гидрохлорид – синтез, физические свойства, реакции идентификации, назначение и особенности действия препарата. Промазин гидрохлорид – реакции идентификации, сравнение с хлорпромазина гидрохлоридом. Левомепромазин – реакции идентификации, особенности действия и назначения препарата. Алимемазин – реакции идентификации, назначение. Противогистаминные

препараты. Прометазина гидрохлорид – синтез, реакции идентификации, применение препарата. Средства для лечения паркинсонизма. Динезин – взаимодействие с бромной водой, фармакологическое действие препарата. Техника работы с динезином. Производные фенотиазина с пиперазиновыми циклами в боковых цепях. Нейролептики: прохлорперазина малеат – реакции идентификации, назначение; тиопроперазин; перфеназина гидрохлорид – реакции идентификации, действие и применение препарата; метофеназат – действие препарата. Противорвотные средства. Тиэтилперазин – особенности действия. Фенотиазины с пиперидиновыми циклами в боковых цепях в положении 10. Перициазин – особенности действия и назначения. Тиоридазин – реакции идентификации, действие препарата. Фенотиазины с атомами фтора в молекулах. Трифлуоперазина гидрохлорид, флуфеназина гидрохлорид, флуфеназина деканоат – реакции идентификации, применение. Фенотиазины с ацильными заместителями в положении 10. Антидепрессанты – фторацизин. Сердечно-сосудистые средства – этмозин, нонахлазин – реакции идентификации и действие препаратов. Производные бензотиазина, этиленимина, пирролидина, индола и изоиндола. Производные 1,2-бензотиазина. Пироксикам – действие, применение. Производные 1,2,4-бензотиадиазина. Диуретики: гипотиазид – синтез, особенности действия и применения препарата; циклометиазид – синтез, применение. Гетероциклические соединения с атомами азота в молекулах. Этиленимины как противоопухолевые средства. Сущность действия препаратов, содержащих этиленимины. Тиофосфамид – синтез, реакции идентификации, применение. Гексафосфамид – реакции идентификации, применение. Бензотэф – синтез, реакции идентификации, применение. Фторбензотэф – применение. Имифос – синтез, реакции идентификации, применение. Дипин – синтез, реакции идентификации. Фосфемид, фотрин – применение. Производные пирролидина. Концепция ноотропных средств. Ноотропил – синтез, реакции идентификации и применение препарата. Дезинтоксикационные средства: поливинилпирролидон – анализ препарата, механизм действия гемодеза; поливинилпирролидон как плазмозаменитель. Энтеродез – применение. Цианокобаламин и его аналоги. Средства, регулирующие метаболические процессы. Витамин В₁₂ – синтез (получение витамина В₁₂ в фармацевтической промышленности, получение витамина В₁₂ Вудвордом), физические свойства, нахождение в природе и биосинтез, реакции идентификации, действие на организм человека. Применение витамина В₁₂ в современной медицинской практике. Оксикобаламин. Применение и особенности действия препарата. Кобамамид – физические свойства и превращения в организме. Кобамамид как анаболик. Молекула индола и изоиндола в природе. Фармацевтические группы

производных индола. Применение адроксона как гемостатического средства. Индометацин как противовоспалительное средство – реакции идентификации, применение. Сходство индометацина с серотином и триптофаном. Физостигмина салицилат как ингибитор холинэстеразы: нахождение в природе, реакции идентификации, медицинское применение и особенности действия. Вещества, действующие на ЦНС. Ондансетрон, тропisetрон, индапамид – механизм действия и применение препарата. Резерпин – нахождение в природе. Метод экстракции, как способ выделения резерпина из природного сырья. Синтез по Вудворду и реакции идентификации резерпина. Влияние резерпина на ЦНС, особенность действия препарата. Ограничения к применению препарата. Пиразидол и инказан как представители антидепрессантов – механизм действия и применение. Кавинтон – механизм действия, применение препарата, ограничения к употреблению препарата. Диазолин и димебон как представители антигистаминных препаратов – механизм действия и применение. Производные изоиндола. Хлорталидон – применение. Производные лизергинатной кислоты – нахождение в природе, открытие и применение. Антиадренергические средства – дигидроэрготамин, эрготамина гидротартрат, эргометрина малеат, метилэргометрин – реакции идентификации, применение. LSD-25 – галлюцинаторные свойства; применение и последствия долгого употребления LSD-25. Вещества структурно подобные LSD-25. Дофаминергические средства. Бромокриптин – действие, применение, реакции идентификации. Лизурид и метисергид как антисеротониновые средства. Сермион – применение.

Тема 8. Производные имидазола, бензимидазола, сидномина, пиразолидина и пиразолона. Фармакологические группы производных имидазола и имидазолина. Миотические средства – пилокарпина гидрохлорид – нахождение в природе, реакции идентификации, применение. Этимизол как психомоторный стимулятор – синтез, реакции идентификации, применение. Антигипертензивные средства – клонидина гидрохлорид (клофелин) – реакции идентификации, применение. Средства для лечения протозойных инфекций – метронидазол, тинидазол – реакции идентификации, применение. Клотримазол как средство для лечения грибковых заболеваний – качественное и количественное определение, действие и применение. Миконазол – реакции идентификации, применение. Иммуностимуляторы (левамизол) – реакции идентификации, действие и применение. Средства для наркоза (этомидат) – особенности действия и применения. Миорелаксанты – представители фармацевтической группы в ряду производных имидазола и применения препаратов этой группы. Синтез производных бензимидазола. Производные бензимидазола как сердечно-сосудистые (дибазол), антигистаминные

(астемизол, оксатомид), противоязвенные (омепразол), противорвотные (домперидон), антигельминтные (мебендазол) средства – действие, применение, реакции идентификации. Мезоионные соединения в органической химии. Особенности строения мезоионных соединений и сиднонимина. Синтез производных сиднонимина. Антидепрессанты и психостимуляторы. Сиднофен – синтез, реакции идентификации, действие и применение препарата. Сиднокарб – реакции идентификации, особенности действия и применения. Производные сиднофена как сердечно-сосудистые средства – сиднофарм – особенности действия, применение. Средства, тормозящие образование мочевых конкрементов – кебузон, сульфипиразон. Ненаркотические анальгетики. Анальгин – синтез, физические свойства, реакции идентификации, количественное определение анальгина. Применение и ограничения к применению препарата. Методы введения в организм. Комплексные препараты, содержащие анальгин. Антипирин – синтез, применение. Производные пиразолидина как противовоспалительные средства. Бутадион – синтез, физические свойства, реакции идентификации, действие и применение. Синтез пиразолона из кетозфиров и гидразинов. Синтез пиразолидинового цикла из производных диэтилового эфира малоновой кислоты и замещенных фенилгидразинов. Синтез пиразолинов из халконов по схеме [3+2], где второй составляющей выступает гидразин или его производное. Фармацевтическая группа анальгетиков – представители, механизм действия, применение.

Раздел 2. Шести- и семичленные гетероциклические лекарственные препараты

Тема 9. Производные пиридина. Общая характеристика препаратов, содержащих пиридин – фармакологические группы, представители. Общие качественные реакции на пиридиновое кольцо. Витамины и их аналоги. Применение витаминов группы В. Пиридоксина гидрохлорид (витамин В₆) – биосинтез, синтез, реакции идентификации. Пиридоксальфосфат – реакции идентификации. Средства, действующие на ЦНС – ноотропные средства. Пиридитол – действие и применение препарата. Ангиопротекторы – общая характеристика фармакологической группы. Пармидин – реакции идентификации, применение. Пиридин-3-карбоновая кислота и ее производные. Средства, регулирующие метаболические процессы. Никотиновая кислота (витамин РР) – нахождение в природе, получение, реакции идентификации, действие и применение. Никотинамид – реакции идентификации, действие по сравнению с витамином РР. Средства для лечения анемий. Коамид – реакции идентификации, действие и применение. Ферамид. Стимуляторы ЦНС. Диэтиламид никотиновой кислоты – применение водных растворов, реакции идентификации. Ноотропные средства. Пикамилон – применение. Никодин как

представитель желчегонных средств – реакции идентификации, применение. Дональгин как противовоспалительное средство – синтез и применение. Противотуберкулезные препараты. Изониазид – синтез, реакции идентификации, применение, побочные явления при лечении. Фтивазид – синтез, реакции идентификации, применение. Нейролептические препараты – общая характеристика и механизм действия. Производные ди(*n*-фторфенил)бутилпиперидина и пиперидинбутирофенона как нейролептики. Пенфлуридол, пимозид, флуспирилен – синтез и применение препаратов. Галоперидол – синтез, реакции идентификации. Трифлуперидол, дроперидол – синтез и применение препаратов. Производные 1,4-дигидропиридина как антагонисты ионов кальция, их общее применение. Нифедипин как антиангинальное средство – синтез, реакции идентификации и количественное определение. Применение препарата и явления, которые наблюдаются при длительном применении препарата. Применение и особенности действия других антиангинальных препаратов (амлодипин, никардипин, нисолдипин, исрадипин, фторидон, нитрендипин). Средства, улучшающие кровообращение в мозге (нимодипин). Производные пиридина различной структуры – противокашлевые средства (битиодин, либексин), реактиваторы холинэстеразы (дипироксим), ингибиторы холинэстеразы (пиридостигмина бромид, дистигмина бромид), аналептические средства (бемегрид, синтез и применение), средства, которые действуют преимущественно на ЦНС (промедол, синтез и применение; просидол; фентанил; пиритрамид), средства для лечения диареи (имодиум), антигистаминные средства (кетотифен, ципрогептадин, лоратадин), антисеротониновые средства (пизотифен), ингибиторы диаминоксидазы (бетагистин), слабительные средства (бисакодил, гутталакс), негликозидные синтетические кардиотонические средства (амринон, милринон), средства местной анестезии (маркаин). Значение производных пиридина для медицины.

Тема 10. Производные тропана и хинуклидина. Тропановая система – сходство и отличие тропана от классических гетероциклов. Фармакологические группы препаратов тропанового ряда. Атропина сульфат. Добыча атропина. Нахождение атропина в природе. Синтез атропина по Робинсону. Оптическая активность атропина. Реакции идентификации атропина: реакция Витали-Морена на α -оксиметилфенилуксусную кислоту, гидроксамовая реакция на эфирную группировку, реакция с алкалоидными реактивами (реактив Драгендорфа, пикриновая кислота и другие), реакция с реактивом Марки, реакция с хлоридом бария. Другие препараты тропановой природы: гиосциамина камфорат, скополамина камфорат, гоматропина гидробромид, атровент. Средство для лечения паркинсонизма – тропацин.

Антиадренергическое средство – тропafen. Кокаина гидрохлорид как местный анестетик. Сходство структуры кокаина и новокаина – общие фармакофорные группировки. Лидокаина гидрохлорид и тримекаин. Хинуклидин. Фармакологические производные хинуклидина как холиномиметические средства (ацеклидин – синтез по Рубцову, реакции идентификации, применение). Транквилизаторы хинуклидинового ряда (оксидин – реакции идентификации, применение, синтез по Рубцову). Фенкарол, бикарфен как антигистаминные средства. Миорелаксанты (квалидил) и ганглиоблокаторы (темехин, имехин) хинуклидинового ряда.

Тема 11. Производные хинолина, изохинолина, пиримидина и хиназолина. Производные хинолина в природе. Добыча производных хинолина. Производные хинолина как противомаларийные средства (хинина сульфат, хинина гидрохлорид, хлорохин, мефлохин). Реакции идентификации хинин сульфата. Производные хинолина как сердечно-сосудистые препараты (хинидина сульфат – применение). Производные 8-оксихинолина как противомикробные, противопаразитарные и антипротозойные средства (хлорхинальдол, нитроксолин, интетрикс). Особенности строения препаратов производных 6-фторхинолона-4. Действие препаратов. Синтез и применение группы 6-фторхинолона-4. Пефлоксацин, норфлоксацина гидрохлорид, ципрофлоксацин, офлоксацин. Производные хинолона-4 без атомов фтора в молекулах. Синтез розоксацина. Спазмолитические средства производные изохинолина. Папаверина гидрохлорид – синтез, реакции идентификации и применение. Синтез и применение препарата но-шпа. Нахождение и роль пиримидиновых оснований в природе. Противовирусные средства – антагонисты тимина и цитозина (азидотимидин, ламивудин, идоксуридин). Реакции идентификации идоксуридина. Синтез фторурацила. Применение противовирусных средств. Средства, влияющие на тканевый обмен (калия оротат) – синтез и применение. Витамины – производные пиримидина. Тиамин гидрохлорид (В₁) – нахождение в природе, синтез, реакции идентификации и применение. Кокарбоксилаза и фосфотиамин – применение препаратов. Рибофлавин (В₂) – распространение в природе, синтез и применение препарата. Препараты на основе рибофлавина – рибофлавин-монопнуклеотид, флавицин по сравнению с рибофлавином. Средства для лечения проказы и иммунодефицитных состояний (диуцифон). Противомикробные средства (пипемидиевая кислота). Антигельминтные средства (пирантел). Противоопухолевые антибиотики (реумицин). Производные хиназолина как антисеротониновые средства (кетансерин). Производные хиназолина как снотворные средства (метаквалон). Производные барбитуровой кислоты как снотворные средства – история открытия, основные представители (веронал,

гексенал, тиопентал натрий) и применение. Общая схема получения барбитуратов путем циклоконденсации замещенных эфиров малоновой кислоты с мочевиной (или гуанидином) в присутствии этоксида натрия.

Тема 12. Производные пурина, пиперазина и птеридина. Пурин и его производные. Природный источник пуринов. Общая схема синтеза производных пурина. Производные пурина – стимуляторы центральной нервной системы (кофеин). Открытие и производство кофеина. Полусинтетический и синтетический методы производства кофеина. Реакции идентификации и применения кофеина. Другие стимуляторы ЦНС (кофеина моногидрат, кофеин-бензоат натрия). Спазмолитические средства на пуриновой основе – теобромин, теофиллин. Добыча и синтез препаратов. Реакции идентификации и применения. Средства, используемые при болезни Рейно (ксантинола никотинат). Средства, влияющие на тканевый обмен. Аденозинтрифосфатная кислота и рибоксин – показания к применению. Меркаптопурин и фопурин – как средства для лечения лейкоза. Применение иммунодепрессантов пуринового ряда (азатиоприн). Противовирусные средства – ацикловир, ганцикловир, фамцикловир – механизм противовирусного действия препаратов. Производные пиперазина как средства для улучшения кровообращения – циннаризин, флунаризин. Антигистаминные препараты – цетиризин, оксатомид. Снотворные препараты – зопиклон. Сердечно-сосудистые – предуктал. Синтез циннаризина. Производные птеридина как витамины и антиметаболиты. Фолиевая кислота и кальция фолинат – получение и реакции идентификации. Метаболизм фолиевой кислоты и фармацевтическое назначения. Препарат контерган. Метотрексат как антагонист фолиевой кислоты. Дибензоазепины и бензодиазепины как лекарственные средства. Применение антидепрессантов (имипрамин, дезипрамин, кломипрамин) дибензоазепинового ряда. Реакции идентификации и методы синтеза. Карбамазепин как противосудорожный препарат – синтез и применение. Синтез бензодиазепинов по реакции Барбье-Гриньяра (синтез из *o*-аминобензонитрилов). Синтез тиеноконденсированных бензодиазепинов. Синтез бензодиазепинов из ω -аминоэтилированного анилина с последующим окислением (привести механизм циклообразования). Синтез 1,4-бензодиазепинов с помощью реакций рециклизации. Транквилизаторы группы 1,4-бензодиазепа (хлордiazепоксид, diaзепам, мезапам, оксазепам). Реакции идентификации diaзепам и оксазепам. Феназепам – история открытия, реакции идентификации и применение. Синтез лоразепам. Снотворные препараты: нитразепам – реакции идентификации, флуниотрозепа, триазолам. Противосудорожные средства (клоназепам), средства для наркоза (мидазолам), нейролептические средства (азалептин). Другие бензодиазепины (1,5-

бензодиазепины).

Тема 13. Проблемы создания современных лекарственных средств и лекарственных препаратов из природного сырья. Общие тенденции развития фармацевтической химии и значительные достижения в синтезе лекарственных препаратов. Влияние стереоизомерии на свойства лекарственных средств. Проблемы синтеза оптически чистых препаратов. Сульфаниламиды как химиотерапевтические средства. Теория механизма антимикробного действия. Средства для местной анестезии (кокаин, новокаин, норкокаин, бензоилэкгонин, лидокаин, тримекаин). Противотуберкулезные средства (натрия *n*-аминосалицилат, бепаск, изониазид). Противовоспалительные средства (мефенамовая кислота, диклофенак-натрий, индометацин, ацетилсалициловая кислота, салициламид, диоксибензойная кислота). Снотворные средства. Производные барбитуровой кислоты (барбитал, фенобарбитал, гексенал, эстимал, этаминал-натрий, тиопентал-натрий). Маточные средства. Производные лизергиновой кислоты (эрготамина гидротартрат, дигидроэрготамин, эргометрина малеат, LSD-25). Антиметаболиты – производные пиримидина и пурина. AZT. Стероидные гормоны, их синтетические аналоги и заменители. Производные фенотиазина как лекарственные средства. Природные вещества в фармацевтике. Антибиотики (тетрациклиновые, полиеновые, макролидные, аминогликозидные, нуклеозидные, ансамициновые, полипептидные, аценогликозидные антибиотики, антибиотики стероидного строения, кислород- и азотсодержащие гетероциклические антибиотики), энзимы, витамины, алкалоиды, нуклеиновые кислоты, аминокислоты и белки, углеводы. Преимущества и недостатки природных соединений. Препараты, состоящие исключительно из природных соединений в современной медицинской практике. Концепция народной медицины.

4.3. Лекции

№ п/п	Наименование темы	Объем часов	
		Очная форма	Очно-заочная форма / заочная форма
9 семестр / 15 триместр			
1.	Предмет и основное содержание фармацевтической химии. Физико-химические методы исследования лекарственных препаратов.	2	2
2.	Общие методы введения функциональных групп и модификации молекул. Реакции циклизации.	2	-
3.	Неорганические фармацевтические препараты.	2	2
4.	Ациклические и карбоциклические	2	-

	фармацевтические препараты.		
5.	Производные фурана, бензофурана, пирана и бензопирана.	2	-
6.	Производные тиазола и тиазолидина. Антибиотики-пенициллины. Антибиотики-цефалоспорины.	2	2
7.	Производные фенотиазина. Производные бензотиазина, этиленимина, пирролидина, индола и изоиндола.	2	-
8.	Производные имидазола, бензимидазола, сиднонимина, пиразолидина и пиразолона.	2	-
9.	Производные пиридина.	2	-
10.	Производные тропана и хинуклидина.	2	-
11.	Производные хинолина, изохинолина, пиримидина и хиназолина.	2	-
12.	Производные пурина, пиперазина и птеридина. Дибензоазепины и бензодиазепины как лекарственные средства.	2	-
13.	Проблемы создания современных лекарственных средств и лекарственных препаратов из природного сырья.	2	-
Итого:		26	6

4.4. Практические занятия не предусмотрены учебным планом.

4.5. Лабораторные работы

№ п/п	Наименование темы	Объем часов	
		Очная форма	Очно-заочная форма / заочная форма
9 семестр / 15 триместр			
1.	Физико-химические методы исследования лекарственных препаратов.	2	-
2.	Общие методы введения функциональных групп и модификации молекул. Реакции циклизации.	4	2
3.	Неорганические фармацевтические препараты.	4	2
4.	Ациклические и карбоциклические фармацевтические препараты.	2	-
5.	Производные фурана, бензофурана, пирана и бензопирана.	4	2
6.	Производные тиазола и тиазолидина. Антибиотики-пенициллины. Антибиотики-цефалоспорины.	2	2
7.	Производные фенотиазина. Производные бензотиазина, этиленимина, пирролидина, индола и изоиндола.	2	2
8.	Производные имидазола, бензимидазола, сиднонимина, пиразолидина и пиразолона.	2	-
9.	Производные пиридина.	2	2
10.	Производные тропана и хинуклидина.	2	-

11.	Производные хинолина, изохинолина, пириимидина и хиназолина.	2	-
12.	Производные пурина, пиперазина и птеридина. Дибензоазепины и бензодиазепины как лекарственные средства.	4	2
13.	Проблемы создания современных лекарственных средств и лекарственных препаратов из природного сырья.	2	-
Итого:		34	14

4.6. Самостоятельная работа студентов

№ п/п	Наименование раздела / темы	Вид самостоятельной работы	Объем часов	
			Очная форма	Очно-заочная форма / заочная форма
9 семестр / 15 триместр				
1.	Физико-химические методы исследования лекарственных препаратов.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	8	12
2.	Общие методы введения функциональных групп и модификации молекул. Реакции циклизации.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	8	12
3.	Неорганические фармацевтические препараты.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	10	14
4.	Ациклические и карбоциклические фармацевтические препараты.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	10	12
5.	Производные фурана, бензофурана, пирана и бензопирана.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	8	12

6.	Производные тиазола и тиазолидина. Антибиотики-пенициллины. Антибиотики-цефалоспорины.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	10	14
7.	Производные фенотиазина. Производные бензотиазина, этиленимина, пирролидина, индола и изоиндола.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	10	12
8.	Производные имидазола, бензимидазола, сиднонимина, пиразолидина и пиразолона.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	10	12
9.	Производные пиридина.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	10	12
10.	Производные тропана и хинуклидина.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	8	12
11.	Производные хинолина, изохинолина, пиримидина и хиназолина.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	10	12
12.	Производные пурина, пиперазина и птеридина. Дибензоазепины и бензодиазепины как лекарственные средства.	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к лабораторным работам, оформление лабораторных журналов	10	12
13.	Проблемы создания современных лекарственных средств	написание конспекта, ответы на вопросы, подготовка к	8	12

	и лекарственных препаратов из природного сырья.	лабораторным работам, оформление лабораторных журналов		
Итого:			120	160

4.7. Курсовые работы / проекты не предусмотрены учебным планом.

5. Методическое обеспечение, образовательные технологии

Преподавание дисциплины ведется с применением следующих видов образовательных технологий:

Информационные технологии: использование электронных учебников, химических программ при подготовке к лекциям и лабораторным работам.

Работа в команде: совместная работа студентов в группе при подготовке к лабораторным работам, выполнение групповых домашних заданий (Раздел 1. Предмет и методы фармацевтической химии. Неорганические и органические лекарственные средства; Раздел 2. Шести- и семичленные гетероциклические лекарственные препараты).

6. Формы контроля освоения учебной дисциплины

Текущая аттестация студентов производится в дискретные временные интервалы лектором и преподавателем, ведущим лабораторные работы по дисциплине в различных формах: выполнение письменных домашних заданий и контрольных работ.

Промежуточный контроль по результатам освоения дисциплины проходит в форме письменного экзамена.

Система оценивания учебных достижений студентов, оценочные средства представлены в фонде оценочных средств к рабочей программе учебной дисциплины (приложении).

7. Учебно-методическое и программно-информационное обеспечение дисциплины

А) основная литература:

1. Арзамасцев А.П. и др Фармацевтическая химия. – М.: Изд. Дом «ГЭОТАР-МЕД», 2008.
2. Беликов В.Г. Фармацевтическая химия в 2-х ч. Учебн. Пособие / В.Г. Беликов. – 4 изд. перераб. и доп. – М.: МЕДпресс-информ., 2007.
3. Сливкин А.А., Садчикова Н.П. Функциональный анализ органических лекарственных веществ. Учебное пособие. – Воронеж, 2007.

4. Руководство к лабораторным занятиям по фармацевтической химии. Под ред. А.П. Арзамасцева. – М.: Медицина, 1987.

5. Солдатенков А.Т., Колядина Н.М. Шендрик И.В. Основы органической химии лекарственных веществ. – М.: Химия, 2001.

Б) дополнительная литература:

1. Кулешова М.И., Гусева Л.Н., Сивицкая О.К. Анализ лекарственных форм, изготавливаемых в аптеках. – М.: Медицина, 1989.

2. Погодина Л.А. Анализ многокомпонентных лекарственных форм: Учебное пособие для факультета усовершенствования провизоров. Мн.: Выш. шк., 1985.

3. Арзамасцев А.П., Сенов П.Л. Стандартные образцы лекарственных веществ. – М.: Медицина, 1978.

4. Егоров Н.С. Основы учения об антибиотиках. – М.: Высшая Школа, 1986.

5. Машковский М.Д. Лекарственные средства. Т. 1, Т. 2. (12-е издание). – М.: Медицина, 1998.

6. Международная фармакопея. Спецификации для контроля качества фармацевтических препаратов. Т. 3. (3-е издание). – Женева: Медицина, 1990.

7. Джоуль Дж., Миллс К. Химия гетероциклических соединений. – М.: Мир, 2004.

В) Интернет-ресурсы:

1. www.elibrary.ru

2. www.elementy.ru

3. www.chem.msu.ru

4. www.chemport.ru

8. Материально-техническое обеспечение дисциплины

Лекционные занятия: комплект электронных презентаций, аудитория, оснащенная презентационной техникой (мультимедийная доска, проектор, экран, ноутбук).

Лабораторные работы: лаборатория биоорганической химии, оснащенная доской, таблицами, химическими реактивами, лабораторной посудой, необходимым оборудованием.

9. Лист дополнений и изменений

[illegible]