

Контрольный экземпляр

- Лист. 1144

Министерство образования Республики Беларусь
Учебно-методическое объединение по естественнонаучному образованию

УТВЕРЖДАЮ

Первый заместитель Министра образования
Республики Беларусь

В.А.Богуш



Регистрационный № ТД-С.500/тип.

ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ

Типовая учебная программа по учебной дисциплине
для специальностей:

1-31 05 01 Химия (по направлениям)

Направление специальности

1-31 05 01-03 Химия (фармацевтическая деятельность)

1-31 05 02 Химия лекарственных соединений

СОГЛАСОВАНО

Председатель
Учебно-методического объединения
по естественнонаучному образова-
нию

А. Л. Толстик
2014 г.



СОГЛАСОВАНО

Начальник Управления высшего обра-
зования Министерства образования
Республики Беларусь

С. И. Романюк
«04» 02 2015 г.

Проректор по научно-
методической работе Государствен-
ного учреждения образования «Рес-
публиканский институт высшей шко-
лы»

И. В. Титович
«24» 12 2014 г.

Эксперт-нормоконтролер

«24» 12 2014 г.

Минск 2014

Информация об изменениях размещается на сайтах:

<http://www.nihe.bsu.by>

<http://www.edubelarus.info>

СОСТАВИТЕЛИ:

Н. В. Логинова, профессор кафедры неорганической химии Белорусского государственного университета, доктор химических наук, профессор;

Г. И. Полозов, доцент кафедры радиационной химии и химико-фармацевтических технологий Белорусского государственного университета, кандидат химических наук, доцент;

А. А. Сладкова, старший преподаватель кафедры радиационной химии и химико-фармацевтических технологий Белорусского государственного университета, кандидат химических наук.

РЕЦЕНЗЕНТЫ:

Кафедра фармакологии учреждения образования «Белорусский государственный медицинский университет»;

М. А. Кисель, заведующий лабораторией химии липидов Института биоорганической химии Национальной академии наук Беларуси, доктор химических наук, профессор.

РЕКОМЕНДОВАНА К УТВЕРЖДЕНИЮ В КАЧЕСТВЕ ТИПОВОЙ:

Кафедрой радиационной химии и химико-фармацевтических технологий Белорусского государственного университета
(протокол № 13 от 14 апреля 2014 г.)

Кафедрой неорганической химии Белорусского государственного университета
(протокол № 10 от 17 апреля 2014 г.)

Научно-методическим советом Белорусского государственного университета
(протокол № 5 от 15 мая 2014 г.)

Научно-методическим советом по химии Учебно-методического объединения по естественнонаучному образованию
(протокол № 3 от 21 апреля 2014 г.).

Ответственный за выпуск: Логинова Н. В.

ПОЯСНИТЕЛЬНАЯ ЗАПИСКА

Учебная дисциплина «Фармацевтическая химия» является одной из основных в комплексе химических и медико-биологических дисциплин, призванных обеспечить подготовку специалистов-химиков в области изыскания и исследования лекарственных средств.

В соответствии с прикладным характером этой области фармации **основной целью учебной дисциплины** является раскрытие методологии поиска, разработки, получения, оценки качества и стандартизации лекарственных средств на основе общих закономерностей химико-биологических наук и истории применения лекарств. Содержание учебной дисциплины «Фармацевтическая химия» служит теоретической основой для последующего изучения технологии лекарственных средств.

Задачи преподавания учебной дисциплины включают: формирование представлений о предмете и основных этапах становления фармацевтической химии; ознакомление с ее основными понятиями и терминологической системой; рассмотрение классификаций, методов синтеза и анализа, а также свойств лекарственных веществ; формирование представлений об основах теоретических концепций фармацевтической химии; объяснение взаимосвязи между структурой и механизмом действия лекарственных веществ.

Типовая учебная программа по учебной дисциплине «Фармацевтическая химия» составлена в соответствии с современным состоянием фармацевтической науки.

В теоретических и практических разделах типовой учебной программы учитываются требования образовательных стандартов по специальностям: **1-31 05 01 «Химия (по направлениям)»** и **1-31 05 02 «Химия лекарственных соединений»**, а также квалификационная характеристика специалистов – химика-фармацевта и химика-биофармахимика.

Для того чтобы подчеркнуть значимость общих теоретических положений при рассмотрении прикладных задач фармацевтической науки и практики, типовая учебная программа составлена из трех разделов: **«Общая фармацевтическая химия»**, **«Специальная фармацевтическая химия. Неорганические лекарственные средства»** и **«Специальная фармацевтическая химия. Органические лекарственные средства»**. Реализация их взаимосвязи при изучении предмета данной учебной дисциплины формирует умение решать профессиональные задачи.

В первом разделе на основе истории создания лекарственных средств дается представление о предмете, проблемах и перспективах, а также направлениях развития фармацевтической химии. В ней рассматриваются основные положения и правила контроля качества лекарственных средств в процессе их разработки и производства; излагаются общие принципы оценки качества лекарственных форм и требования к условиям их хранения;

характеризуются физические и химические процессы, происходящие при хранении лекарственных средств, и указываются пути повышения их стабильности; обращается внимание на особенности использования современных методов разделения, очистки и установления структуры лекарственных веществ.

В специальной части типовой учебной программы (второй и третий разделы) приведены группы и отдельные лекарственные средства, основная часть которых включена в Перечень жизненно необходимых и важнейших лекарственных средств. Классификация лекарственных веществ построена по химическому принципу с учетом их фармакологического действия. В связи с этим в этой части типовой учебной программы традиционно выделяются два раздела, характеризующие неорганические и органические лекарственные средства.

Во втором разделе, посвященном неорганическим лекарственным средствам, рассматриваются основы синтеза неорганических лекарственных и вспомогательных веществ; их свойства и применение; а также дается введение в фармакопейные методы исследования основных групп лекарственных и диагностических средств, содержащих неорганические вещества. Наряду с обязательным материалом, посвященным классификации, свойствам, особенностям синтеза и испытаний неорганических лекарственных средств, этот раздел содержит общую характеристику некоторых неорганических аспектов фармации, что позволяет рассмотреть наиболее важные проблемы, требующие теоретического и экспериментального решения современной фармацевтической наукой с участием химиков-неоргаников.

Третий раздел включает **органические лекарственные средства,** которые составляют около 90 % от общей численности лекарственных веществ, используемых в медицинской практике для диагностики, профилактики и лечения болезней. В нем приводится краткий обзор истории открытия и прогресса химии данного класса лекарственных средств. Рассматривается общая фармакологическая характеристика основных представителей, а также свойства наиболее важных современных лекарственных препаратов, взаимосвязь между химической структурой активного вещества и его действием на организм. Приводятся сведения о терапевтическом назначении и клиническом использовании многих лекарственных веществ, их токсикологии, наблюдаемых побочных эффектах и взаимодействии с другими препаратами, рассматривается проблема пролекарств, а также метаболизм некоторых лекарственных веществ в организме. Поскольку одной из основных задач фармацевтической химии является поиск и получение новых эффективных, избирательно действующих и безопасных для здоровья лекарственных средств, достаточно подробно рассматриваются методы химического и микробиологического синтеза большинства известных лекарственных веществ, обсуждаются механизмы

протекающих при этом реакций, а также пути биосинтеза некоторых лекарственных средств природного происхождения. Отметим, что лекарственные вещества природного происхождения сгруппированы с их синтетическими аналогами, полученными в результате всестороннего изучения этих природных соединений.

Каждую группу лекарственных веществ предлагается рассматривать на примере нескольких соединений, а в лабораторных работах используются отдельные модельные соединения, что демонстрирует унифицированный подход к изучению группы веществ, характеризующихся специфическими структурными особенностями.

Содержание типовой учебной программы дисциплины «Фармацевтическая химия» для химических факультетов учреждений высшего образования имеет некоторые особенности, отличающие ее от типовой учебной программы, принятой в медико-фармацевтических учебных заведениях. Она предусматривает не только изучение физико-химических свойств лекарственных и диагностических средств, знакомство с использованием стандартных методик оценки их качества, описанных в Государственной Фармакопее и другой нормативной документации, но и изучение особенностей химических процессов их получения, поскольку учебный процесс нацелен прежде всего на подготовку специалистов в области синтеза и анализа лекарственных веществ. В связи с этим типовая учебная программа содержит раздел, посвященный физико-химическим основам препаративной фармацевтической химии. Важно, чтобы студенты при изучении этого материала уяснили характер влияния различных факторов на химический процесс и свойства образующихся продуктов (чистоту, структуру, дисперсность, фазовый состав, однородность, морфологию), а также научились обосновывать методику синтеза и оценивать рациональность его условий для различных классов лекарственных и вспомогательных веществ.

В результате изучения учебной дисциплины «Фармацевтическая химия» студент **должен:**

знать:

- классификацию, источники и методы синтеза лекарственных веществ;
- основы фармакопейного анализа лекарственных средств;
- физические, химические и фармакологические свойства основных групп лекарственных средств;
- основные принципы направленного поиска и разработки лекарственных средств, а также выбора методов физико-химического анализа;

уметь:

- использовать нормативную, справочную и научную литературу для получения и исследования лекарственных средств;
- определять влияние на фармакологическую активность лекарственных средств фармацевтических факторов;

- выбирать оптимальные варианты синтеза, выделения и очистки лекарственных средств;
- лабораторный анализ на соответствие лекарственного вещества требованиям нормативной документации;

владеть:

- основными методами и приемами фармакопейного анализа лекарственных средств.

При изучении данной дисциплины реализуются такие формы занятий как лекции, семинары, лабораторный практикум и самостоятельная работа студентов. На лабораторных занятиях студенты осуществляют синтезы лекарственных веществ и исследование их свойств, которое включает качественный и количественный анализ по фармакопейным статьям, идентификацию фазового состава и структуры веществ с использованием физико-химических методов. На основании полученных данных студенты должны сделать вывод о соответствии синтезированного вещества фармакопейным стандартам и требуемым структурным характеристикам, проанализировать возможные причины несоответствия и предложить способы корректировки методики синтеза.

Контроль самостоятельной работы студентов может осуществляться в ходе текущего и итогового контроля знаний, в форме устного опроса, коллоквиумов, письменных контрольных работ (как в традиционном, так и тестовом вариантах). Одной из важных составляющих контроля знаний и умений студентов может быть написание и защита курсовой работы. Для общей оценки усвоения студентами учебного материала рекомендуется использование рейтинговой системы.

Для организации самостоятельной работы студентов в типовой учебной программе приводится основная и дополнительная литература; список литературы включает наряду с учебными пособиями по фармацевтической химии справочные издания, которые содержат обширную информацию о лекарственных средствах и могут существенным образом дополнить учебники при изучении данной учебной дисциплины.

Типовая учебная программа рассчитана на 460 часов, в том числе 274 аудиторных часов: 128 часов лекций, 66 часов лабораторных и 80 часов семинарских занятий.

При разработке учебных программ допускается изменение последовательности изучения, а также перенесение отдельных вопросов типовой учебной программы на семинарские занятия или на самостоятельное изучение без нарушения целостности ее содержания.

ПРИМЕРНЫЙ ТЕМАТИЧЕСКИЙ ПЛАН

№ темы	Наименование раздела, темы	Количество аудиторных часов			
		Всего	Лекции	Лаб. занятия	Сем. занятия
	Раздел I. Общая фармацевтическая химия	58	36	18	14
1.1	Структура, содержание, объекты и терминологическая система фармацевтической химии	2	2		
1.2	Краткая история развития, задачи и проблемы современной фармацевтической химии	2	2		
1.3	Основные направления и перспективы создания лекарственных средств	2	2		2
1.4	Биофармация – теоретическая основа получения лекарственных средств	2	2		2
1.5	Обеспечение качества лекарственных средств	2	2		
1.6	Основные положения и документы, регламентирующие фармацевтическую продукцию	6	4		2
1.7	Основные этапы и методы оценки качества лекарственных средств	20	8	12	4
1.8	Стабильность и сроки годности лекарственных средств	2	2		2
1.9	Физико-химические основы препаративной фармацевтической химии	20	12	6	2
	Раздел II. Специальная фармацевтическая химия. Неорганические лекарственные средства	48	18	12	18
2.1	Лекарственные средства – производные <i>p</i> -элементов VIIA–IIIA групп	20	8	4	8
2.2	Лекарственные и диагностические средства – производные <i>s</i> -элементов IIА и IA групп	12	4	4	4
2.3	Лекарственные и диагностические средства – производные <i>d</i> - и <i>f</i> -элементов VIIIB–IIB групп	12	4	4	4
2.4	Неорганические вспомогательные вещества в лекарственных средствах	4	2		2
	Раздел III. Специальная фармацевтическая химия. Органические лекарственные средства	140	74	36	48
3.1	Лекарственные средства на основе алканов и алкенов, галоидпроизводных углеводородов	4	2		2
3.2	Производные спиртов и углеводов в качестве лекарственных средств	8	2	6	2

3.3	Лекарственные средства на основе фенолов и хинонов	8	2	6	2
3.4	Производные альдегидов, кетонов, дикетонов, карбоновые кислоты и их производные	2	2		2
3.5	Нестероидные противовоспалительные средства	10	2	6	2
3.6	Аминокислоты и их производные	4	2		2
3.7	Лекарственные средства на основе алкил-ариламинов	2	2		2
3.8	Производные бис-(2-хлорэтил)аминов	4	2		2
3.9	Сульфаниламидные лекарственные средства	10	2	6	2
3.10	Производные мочевины, гуанидина, бигуанидина	2	2		2
3.11	Общая характеристика лекарственных средств на основе гетероциклических соединений	2	2		2
3.12	Лекарственные средства на основе оксирана, азиридина, пиррола, пирролидина, фурана	2	2		2
3.13	Производные тиофена, пиразола, имидазола, имидазолина	4	2		2
3.14	Производные индола, бензофурана, бензимидазола	4	2		2
3.15	Лекарственные средства, содержащие ядро пиридина	10	2	6	2
3.16	Производные пиперидина и пиперазина	2	2		2
3.17	Производные хинолина и изохинолина	4	2		2
3.18	Производные акридина и хинуклидина	2	2		
3.19	Производные хромона и кумарина	4	2		2
3.20	Лекарственные средства группы пиримидина	2	2		2
3.21	Лекарственные средства ряда пуринов	6	4		2
3.22	Производные фенотиазина	4	2		2
3.23	Бензодиазепины и другие семичленные гетероциклы	4	2		2
3.24	Алкалоиды	4	4		
3.25	Гормоны	6	4		2
3.26	Простагландины	2	2		
3.27	Витамины	10	4	6	
3.28	Сердечные гликозиды	2	2		
3.29	Антибиотики	6	4		2
3.30	Тетрациклины. Ароматические антибиотики	2	2		
3.31	Аминогликозиды. Пептидные и противоопухолевые антибиотики. Макролиды и азалиды. Полиеновые антибиотики	2	2		
3.32	Плазмозамещающие препараты.	2	2		

	Диагностические средства				
--	--------------------------	--	--	--	--

СОДЕРЖАНИЕ УЧЕБНОГО МАТЕРИАЛА

Раздел I. ОБЩАЯ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ

Тема 1.1. Структура, содержание, объекты и терминологическая система фармацевтической химии

Предмет и значение фармацевтической химии; ее связь с другими науками. Номенклатура; методологические основы и принципы классификации (химической и фармакологической) лекарственных средств. Терминология. Международные непатентованные наименования (МНН) лекарственных веществ. Основные источники информации о лекарственных средствах.

Тема 1.2. Краткая история развития, задачи и проблемы современной фармацевтической химии

Основные этапы развития фармацевтической химии. Современные медико-биологические требования к лекарственным веществам (эффективность и безопасность) и задачи фармацевтической химии по разработке методов исследования, стандартизации, оценки качества и создания новых лекарственных средств. Состояние и перспективы развития фармацевтической промышленности в Республике Беларусь. Мировой фармацевтический рынок.

Тема 1.3. Основные направления и перспективы создания лекарственных средств

Источники получения лекарственных веществ. Взаимосвязь источников и методов получения с проблемами исследования лекарственных веществ (содержание исходных, промежуточных и сопутствующих продуктов, формирование показателей качества). Основные этапы эмпирического и направленного поиска, синтеза и испытаний лекарственных средств. Основные области химического направленного синтеза: синтез эндогенных биорегуляторов и метаболитов; синтез в рядах известных лекарственных средств; синтез полиморфных модификаций лекарственных и вспомогательных веществ; стереоселективный синтез наиболее активных изомеров лекарственных веществ; компьютерный дизайн лекарственных веществ и др. Общая характеристика основных направлений биологического синтеза лекарственных веществ.

Тема 1.4. Биофармация – теоретическая основа получения лекарственных средств

Общая характеристика концепции биофармации. Понятие о терапевтической неэквивалентности лекарственных средств; способы ее преодоления. Факторы, влияющие на фармакологическую эффективность лекарственных средств. Связь между структурой вещества и его воздействием на организм. Общие закономерности влияния важнейших функциональных групп и структурных фрагментов на биологическую активность. Зависимость фармакологического действия лекарственных веществ от их физических и химических свойств. Прогнозирование биологической активности.

Тема 1.5. Обеспечение качества лекарственных средств

Современная международная концепция обеспечения качества лекарственных средств. Обеспечение качества лекарственных средств в соответствии с требованиями международных стандартов. Правила надлежащей лабораторной практики (Good Laboratory Practice – GLP). Правила надлежащей клинической практики (Good Clinical Practice – GCP). Правила надлежащей производственной практики (Good Manufacturing Practice – GMP). Правила надлежащей дистрибьюторской практики (Good Distribution Practice – GDP). Правила надлежащей аптечной практики (Good Pharmacy Practice – GPP).

Государственная система создания и контроля качества лекарственных соединений в Республике Беларусь. Система мероприятий по обеспечению качества лекарственных средств на стадиях их разработки, изготовления, распределения, транспортирования, хранения и потребления.

Тема 1.6. Основные положения и документы, регламентирующие фармацевтическую продукцию

Стандартизация лекарственных средств и лекарственных форм; нормативная документация (НД): Государственная фармакопея, общие фармакопейные статьи (ОФС), фармакопейные статьи (ФС), технические условия (ТУ). Законодательный характер фармакопейных статей. Общая характеристика НД (требования, нормы и методы контроля). Международные и региональные сборники унифицированных требований и методов испытания лекарственных средств, их функции и влияние на развитие фармацевтической химии и стандартизации лекарственных средств. Международная фармакопея Всемирной Организации Здравоохранения, Европейская фармакопея, другие региональные и национальные фармакопеи.

Тема 1.7. Основные этапы и методы оценки качества лекарственных средств

Общая характеристика современных физических и химических методов разделения и очистки лекарственных веществ. Методы установления элементного состава, молекулярной массы и химической структуры.

Особенности и критерии фармацевтического анализа. Основные формы контроля качества лекарственных средств: фармакопейный анализ; постадийный контроль качества в процессе производства лекарственных средств; анализ лекарственных форм; экспресс-анализ лекарственных средств; биофармацевтический анализ.

Отличие фармакопейных требований от норм и методов анализа для химической и другой продукции, выпускаемой по Государственным стандартам и техническим условиям. Унификация и стандартизация однотипных испытаний в группах лекарственных веществ (общие положения, общие и частные статьи фармакопеи, их взаимосвязь).

Идентификация неорганических и органических лекарственных веществ (индивидуальных и входящих в сложные лекарственные формы). Общие принципы и методы определения подлинности лекарственных веществ.

Общие фармакопейные положения для определения посторонних веществ (примесей) в лекарственных средствах. Влияние примесей на качественный и количественный состав лекарственного средства и возможность изменения его фармакологической активности (специфические и общие примеси). Основной критерий чистоты лекарственного вещества. Факторы, которые учитываются при разработке фармакопейных стандартов качества лекарственного вещества. Общие требования к испытаниям на доброкачественность. Унификация испытаний. Способы установления доброкачественности лекарственных веществ. Общие и частные методы обнаружения примесей. Фармакопейные испытания на наиболее часто встречающиеся примеси (хлориды, сульфаты и т.п.). Испытание на мышьяк.

Унификация методов количественного анализа лекарственных средств, ее значение; общие статьи Государственной фармакопеи. Обоснование выбора метода, позволяющего провести оценку содержания лекарственного вещества по функциональным группам, характеризующим его свойства; учет полифункционального характера лекарственных веществ при выборе метода количественного определения.

Классификация лекарственных форм и особенности их фармацевтического анализа; общие принципы оценки качества лекарственных форм.

Общая характеристика экспресс-анализа лекарственных форм.

Общая характеристика физических и физико-химических методов качественного и количественного анализа лекарственных средств. Особенности использования биологических методов анализа лекарственных средств.

Значение фармацевтического анализа для создания и использования лекарственных и диагностических средств.

Тема 1.8. Стабильность и сроки годности лекарственных средств

Критерии стабильности лекарственных средств. Физико-химические и химические процессы, происходящие при хранении лекарственных средств. Влияние условий получения, хранения, транспортировки на стабильность лекарственных средств.

Нормативные документы, определяющие условия хранения различных групп лекарственных веществ в зависимости от их свойств и природы воздействующих факторов.

Сроки годности (хранения) лекарственных средств. Нормативные документы, регламентирующие сроки годности лекарственных средств. Порядок установления сроков годности лекарственных средств, их научное обоснование. Возможность прогнозирования сроков годности на основании метода «ускоренного старения». Методы повышения стабильности лекарственных средств.

Тема 1.9. Физико-химические основы препаративной фармацевтической химии

Принципы создания реакционной среды для синтеза в растворе лекарственных веществ с заданными свойствами (структурой, дисперсностью, однородностью, морфологией и др.) и для изготовления лекарственных форм.

Современные представления о закономерностях образования твердой фазы в растворе (общая характеристика). Особенности гомогенного и гетерогенного зародышеобразования и роста частиц твердой фазы в растворе. Основные принципы подбора условий осаждения твердой фазы с определенной дисперсностью, структурой, морфологией.

Вторичные процессы, приводящие к укрупнению частиц твердой фазы (агрегация, флокуляция, оствальдовское созревание и др.). Особенности образования и превращения метастабильных фаз, структурных модификаций лекарственных веществ.

Учет полиморфных свойств лекарственных веществ при их получении и хранении. Химические методы получения полиморфных модификаций лекарственных веществ. Псевдополиморфизм. Фармацевтическое значение полиморфизма.

Физическая (физико-химическая) и химическая несовместимость компонентов в лекарственных средствах и основные принципы ее преодоления.

Правила безопасности при получении и хранении лекарственных средств.

РАЗДЕЛ II. СПЕЦИАЛЬНАЯ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ. НЕОРГАНИЧЕСКИЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА

Тема 2.1. Лекарственные средства – производные *p*-элементов VIIA–IIIA групп

Лекарственные средства – производные элементов VIIA группы периодической системы для коррекции ионного равновесия. Лекарственные средства – производные фтора, хлора, брома, йода.

Лекарственные средства – производные элементов VIA группы периодической системы: вода, кислород, перекись водорода и ее соединения; сера и ее соединения; соединения селена.

Лекарственные средства – производные элементов VA группы периодической системы: лекарственные средства – доноры NO; соединения мышьяка, сурьмы и висмута.

Лекарственные средства – производные элементов IVA группы периодической системы: активированный уголь, соединения кремния.

Лекарственные средства – производные элементов IIIA группы периодической системы: соединения бора, соединения алюминия.

Тема 2.2. Лекарственные и диагностические средства – производные *s*-элементов IIA и IA групп

Лекарственные средства – производные элементов IIA группы периодической системы: соединения кальция, соединения магния. Рентгеноконтрастные препараты бария.

Лекарственные средства – производные элементов IA группы периодической системы: соединения натрия, соединения калия, соединения лития.

Тема 2.3. Лекарственные и диагностические средства – производные *d*- и *f*-элементов VIIIB–II B групп

Лекарственные средства – производные элементов VIIIB группы периодической системы: соединения железа; соединения платины.

Лекарственные средства – производные элементов VIIB группы периодической системы: соединения марганца.

Магниторезонансные контрастные средства – производные элементов IIIB группы периодической системы: соединения гадолиния.

Лекарственные средства – производные элементов IIB группы периодической системы: соединения цинка; соединения ртути.

Лекарственные средства – производные элементов IB группы периодической системы: соединения меди; соединения серебра; соединения золота.

Тема 2.4. Неорганические вспомогательные вещества в лекарственных средствах

Неорганические вещества, используемые в качестве вспомогательных компонентов в лекарственных средствах. Основные типы взаимодействия в системе «лекарственное вещество–вспомогательное вещество».

Неорганические полимеры в фармации (аэросил, бентониты).

РАЗДЕЛ III. СПЕЦИАЛЬНАЯ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ. ОРГАНИЧЕСКИЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА

Тема 3.1. Лекарственные средства на основе алканов и алкенов, галоидпроизводных углеводов

Продукты переработки нефти, угля, торфа, древесины и др. Производные алициклических и каркасных углеводов. Адамantan и его производные в качестве лекарственных средств.

Лекарственные средства на основе галоидпроизводных углеводов в качестве анестетиков, средств ингаляционного наркоза, плазмозамещающих препаратов и др.

Тема 3.2. Производные спиртов и углеводов в качестве лекарственных средств

Производство и использование этанола, этиленгликоля, глицерина. Лекарственные средства на их основе. Моно-, ди- и полисахариды, их производные в качестве лекарственных средств. Ментол и его производные.

Тема 3.3. Лекарственные средства на основе фенолов и хинонов

Производные двухатомных фенолов. Алкилированные фенолы. Производные *n*-аминофенола. Производные *o*- и *n*-хинонов.

Тема 3.4. Производные альдегидов, кетонов, дикетонов, карбоновые кислоты и их производные

Производные формальдегида, глиоксаля, камфоры, изатина. Предельные и ненасыщенные карбоновые кислоты, их соли и другие производные, используемые в качестве лекарственных средств. Производные вальпроевой и фиброевой кислот.

Тема 3.5. Нестероидные противовоспалительные средства

Производные салициловой, анраниловой, *n*-аминобензойной, 2-арилпропионовой и других кислот. Механизм действия. Селективные ингибиторы циклооксигеназы-2.

Тема 3.6. Аминокислоты и их производные

Природные и синтетические аминокислоты и их производные в качестве лекарственных средств. Ноотропные препараты. Ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента.

Тема 3.7. Лекарственные средства на основе алкилариламинов

Адреналин, адреномиметики и адренолитики. Блокаторы кальциевых каналов. Другие виды биологической активности катехоламинов.

Тема 3.8. Производные бис-(2-хлорэтил)аминов

Механизм противоопухолевого действия. Основные представители.

Тема 3.9. Сульфаниламидные лекарственные средства

Механизм антимикробного действия сульфаниламидов. Получение основных представителей данной группы.

Тема 3.10. Производные мочевины, гуанидина, бигуанидина

Производные мочевины с противоопухолевой активностью. Пероральные антидиабетические лекарственные средства. Бигуаниды в качестве антисептических лекарственных средств.

Тема 3.11. Общая характеристика лекарственных средств на основе гетероциклических соединений

Значение гетероциклических лекарственных средств для фармацевтической химии. Классификация и особенности свойств гетероциклических лекарственных средств. Общие методы синтеза важнейших гетероциклов.

Тема 3.12. Лекарственные средства на основе оксирана, азиридина, пиррола, пирролидина, фурана

Основные представители лекарственных средств, содержащие трех- и пятичленные гетероциклы с атомом азота или кислорода. Их назначение, механизмы действия. Производные 5-нитрофурана. Антиульцерогенные лекарственные средства.

Тема 3.13. Производные тиофена, пиазола, имидазола, имидазолина

Лекарственные средства – представители пятичленных гетероциклов, содержащих атом серы или два атома азота. Нитроимидазолы. Производные имидазолина и пиазолина.

Тема 3.14. Производные индола, бензофурана, бензимидазола

Основные представители природных и синтетических лекарственных средств, содержащих индол, бензофуран, бензимидазол.

Тема 3.15. Лекарственные средства, содержащие ядро пиридина

Производные никотиновой и изоникотиновой кислот. Антагонисты ионов кальция.

Тема 3.16. Производные пиперидина и пиперазина

Наркотические анальгетики и транквилизаторы. Противопаразитарные лекарственные средства.

Тема 3.17. Производные хинолина и изохинолина

Лекарственные средства на основе 8-гидроксихинолина. Антималарийные лекарственные средства. Хинолоны и фторхинолоны.

Тема 3.18. Производные акридина и хинуклидина

Основные представители лекарственных средств на основе акридина и хинуклидина.

Тема 3.19. Производные хромона и кумарина

Противоастматические лекарственные средства. Противосвертывающие (антитромботические) лекарственные средства.

Тема 3.20. Лекарственные средства группы пиримидина

Основные представители лекарственных средств пиримидинового ряда с анаболическим, противоопухолевым и другими видами действия. Барбитураты. Пиримидиновые основания.

Тема 3.21. Лекарственные средства ряда пуринов

Пуриновые основания. Основные представители лекарственных средств ряда пуринов. Природные нуклеозиды и их синтетические аналоги в качестве лекарственных средств.

Тема 3.22. Производные фенотиазина

Алкиламино- и ациламинопроизводные фенотиазина в качестве лекарственных средств.

Тема 3.23. Бензодиазепины и другие семичленные гетероциклы

Основные представители лекарственных средств на основе бензодиазепина и других семичленных гетероциклов, их психотропное и транквилизирующее действие.

Тема 3.24. Алкалоиды

Природные источники, выделение, очистка. Важнейшие алкалоиды в качестве лекарственных средств. Классификация. Синтетические аналоги.

Тема 3.25. Гормоны

Классификация гормонов, их роль в организме. Половые гормоны, их синтетические аналоги. Анаболические стероиды.

Тема 3.26. Простагландины

Цикл арахидоновой кислоты. Простагландины и другие простаноиды в качестве лекарственных средств.

Тема 3.27. Витамины

Роль витаминов в жизнедеятельности, их классификация. Источники получения. Важнейшие витамины. Витаминоподобные соединения.

Тема 3.28. Сердечные гликозиды

Растительные источники. Структурные особенности карденолидов. Синтетические кардиотонические лекарственные средства.

Тема 3.29. Антибиотики

Химическая классификация. Способы получения антибиотиков. Природные и полусинтетические пенициллины и цефалоспорины. Другие β -лактамы антибиотики.

Тема 3.30. Тетрациклины. Ароматические антибиотики

Природные и полусинтетические тетрациклины. Антибиотики ароматического ряда.

Тема 3.31. Аминогликозиды. Пептидные и противоопухолевые антибиотики. Макролиды и азалиды. Полиеновые антибиотики

Основные представители аминогликозидов, пептидных и противоопухолевых антибиотиков, макролидов и азалидов, полиеновых антибиотиков. Структурные особенности и направленность действия.

Тема 3.32. Плазмозамещающие препараты. Диагностические средства

Общая характеристика, назначение и использование в медицине плазмозамещающих препаратов и диагностических средств.

Примечание. Общая схема изучения групп и отдельных лекарственных веществ:

- 1) **Принадлежность к химическому классу или группе;** химическая структура, номенклатура. Фармакологическая группа, лекарственная форма.
- 2) **Источники и способы получения.** Основные методы и схемы синтеза лекарственных веществ данной группы; способы их выделения и очистки.
- 3) **Физические, химические и фармакологические свойства.** Выявление взаимосвязи между структурой и свойствами лекарственных веществ данной группы. Стабильность; возможности физических и химических превращений; химическая несовместимость. Особенности биотрансформации (метаболизма).
- 4) **Методы контроля качества.** Требования к качеству лекарственного вещества в связи с его получением, применением, характером лекарственной формы и стабильностью.
- 5) **Стандартизация.** Фармакопейные требования, обоснование норм и методов, включенных в нормативную документацию. Обращение с лекарственными средствами и их хранение.

ИНФОРМАЦИОННАЯ ЧАСТЬ

Основная литература

1. Беликов В.Г. Фармацевтическая химия. 4-е изд. М.: МЕДпресс-информ, 2007.
2. Граник В. Г. Основы медицинской химии. 2-е изд. М.: Вузов. книга, 2006.
3. Лабораторные работы по фармацевтической химии / Под ред. В.Г. Беликова. М.: Высш. шк., 1989.
4. Логинова Н. В., Полозов Г. И. Общая фармацевтическая химия. Мн.: БГУ, 2012.
5. Солдатенков А.Т., Колядина Н.М., Шендрик И.В. Основы органической химии лекарственных веществ. – М.: Мир, 2003.
6. Тюкавкина Н.А., Бауков А. Г. Биоорганическая химия. М.: ДРОФА, 2006.
7. Фармацевтическая химия / Под ред. А.П. Арзамасцева. 3-е изд. М.: ГЭОТАР–Медиа, 2006.

Дополнительная литература

8. Руководство к лабораторным занятиям по фармацевтической химии / Под ред. А.П. Арзамасцева. М.: Медицина, 2001.
9. Арзамасцев А. П., Печенников В. М., Родионова Г. М. и др. Анализ лекарственных смесей. М.: Спутник+, 2000.
10. Бабилов Ф.В., Андроник И.Я. Полиморфизм лекарственных веществ. Кишинев: Штиинца, 1982.
11. Балткайс Я. Я., Фатеев В. А. Взаимодействие лекарственных веществ (фармацевтические аспекты). М.: Медицина, 1991.
12. Беликов В. Г. Современные синтетические и природные лекарственные средства: Краткий справочник. 2-е изд. Пятигорск, 2000.
13. Вартамян Р.С. Синтез основных лекарственных средств. М.: МИА, 2004.
14. Волох Д.С., Максютин Н.П., Кириченко Н.П. и др. Справочник провизора-аналитика. Киев: Здоровья, 1989.
15. Годовальников Г.В. История лекарствоведения. Молодечно: «Типография «Победа», 2007.
16. Государственная фармакопея Республики Беларусь. Т. 1. Мн.: Минск. Гос. ПТК полиграфии, 2006.
17. Государственная фармакопея Республики Беларусь. Т. 2. Молодечно: «Типография «Победа», 2008.
18. Государственная фармакопея СССР. 10-е изд. М.: Медицина, 1968.
19. Государственная фармакопея СССР. 11-е изд. М.: Медицина, 1987.
20. Зенько И.В., Бондаренко А.И. Приготовление и контроль качества экстемпоральных лекарственных форм с элементами самоконтроля. Мн.: Вышэйш. шк., 1992
21. Каркищенко Н. Н. Клиническая и экологическая фармакология в терминах и понятиях: Тезаурус. М.: ИМП-Медицина, 1995.

22. Кулешова М.И., Гусева Л.Н., Сивицкая О.К. Пособие по качественному анализу лекарств. М.: Медицина, 1989.
23. Логинова Н.В. Металлокомплексы в медицине: от дизайна к химиотерапии и диагностике. Мн.: БГУ, 2006.
24. Логинова Н.В. Фармацевтическая химия: программы и методические указания к разделам «Общая фармацевтическая химия» и «Неорганические лекарственные средства». Мн.: БГУ, 2012.
25. Логинова Н.В. Фармацевтическая химия: вопросы и задачи к разделу «Основные этапы контроля качества лекарственных средств». Мн.: БГУ, 2012.
26. Логинова Н.В. Фармацевтическая химия: методическое руководство к семинарским занятиям по общей фармацевтической химии. Мн.: БГУ, 2012.
27. Логинова Н.В. Фармацевтическая химия: методические материалы к тестовому контролю знаний по разделу «Общая фармацевтическая химия». Мн.: БГУ, 2012.
28. Логинова Н.В. Фармацевтическая химия: учебно-методическое пособие. В 2-х ч. Мн.: БГУ, 2012.
29. Лурье Ю.Ю. Справочник по аналитической химии: Справ. изд., 6-е изд. М.: Химия, 1989.
30. Максютин Н.П., Каган Ф.Е., Кириченко Л.А. и др. Методы анализа лекарств. Киев: Здоровья, 1984.
31. Машковский М.Д. Лекарственные средства. 15-е изд. М.: Новая волна. 2007.
32. Международная фармакопея, 3 изд., Т. 1–3. Женева: ВОЗ, 1981, 1983, 1990.
33. Муравьев И.А., Козьмин В.Д., Кудрин А.И. Несовместимость лекарственных веществ. М.: Медицина, 1978.
34. Полимеры в фармации / Под ред. А.И. Тенцовой, М.Т. Алюшина. М.: Медицина, 1985.
35. Регистр лекарственных средств России (РЛС). Энциклопедия лекарств. Вып. 16. М.: РЛС–2008, 2007.
36. Справочник Видаль. Лекарственные средства в России. М.: Астра Фарм Сервис, 2007.
37. Справочник фармацевта / Под ред. А. И. Тенцовой. М.: Медицина, 1981.
38. Фармацевтический анализ лекарственных средств / Под общ. ред. В.А. Шаповаловой. Харьков: ИМП «Рубикон», 1995.
39. Харкевич Д. Фармакология. 10-е изд. М.: Медицина, 2008.
40. Шрайнер Р., Фьюзон Р., Кёртин Д., Моррилл Т. Идентификация органических соединений. М.: Мир, 1983.

ПЕРЕЧЕНЬ РЕКОМЕНДУЕМЫХ СРЕДСТВ ДИАГНОСТИКИ

В соответствии с типовым учебным планом по специальностям **1-31 05 01 «Химия (по направлениям)»** и **1-31 05 02 «Химия лекарственных соединений»** учебная дисциплина «Фармацевтическая химия» изучается в течение двух семестров.

Текущий контроль качества усвоения студентами знаний по данной учебной дисциплине может осуществляться с использованием следующих средств диагностики:

- письменных контрольных работ по отдельным темам учебной программы, а также по содержанию учебной дисциплины в целом;
- устного опроса при проведении аудиторных занятий;
- тестирования (в том числе и компьютерного) по отдельным темам учебной дисциплины;
- коллоквиумов;
- отчетов по практическим заданиям, выполняемым в рамках самостоятельной внеаудиторной работы;
- проверки типовых индивидуальных заданий, выполняемых на лабораторных занятиях;
- зачетной экспериментальной работы;
- защиты подготовленной студентом курсовой работы;
- рейтинговой системы оценки знаний и умений студента.

В качестве формы итогового контроля качества усвоения студентами учебного материала рекомендованы зачет и экзамен.