

ЛЬВІВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ
ІМЕНІ ДАНИЛА ГАЛИЦЬКОГО

кафедра фармацевтичної, органічної і біоорганічної хімії

ЗАТВЕРДЖУЮ

Перший проректор з науково-
педагогічної роботи
доц. І.І. Солонинко

“ ___ ” _____ 2023 р.

НАВЧАЛЬНА ПРОГРАМА ВИБІРКОВОЇ ДИСЦИПЛІНИ

Хімія ліків

(назва навчальної дисципліни)

**підготовки фахівців другого (магістерського) рівня вищої освіти
галузі знань 22 «Охорона здоров'я»
спеціальності 226 «Фармація, промислова фармація»**

Обговорено та ухвалено
на методичному засіданні кафедри
фармацевтичної, органічної і
біоорганічної хімії
Протокол № _
від “_” червня 2023 р.
Завідувач кафедри
проф. Лесик Р.Б.

Затверджено
профільною методичною комісією
з фармацевтичних дисциплін
Протокол № 3
від “21” червня 2023 р.
Голова профільної методичної
комісії
проф. Білоус С.Б.

Навчальна програма вибіркової дисципліни Хімія ліків
для студентів 3 курсу фармацевтичного факультету (очна та заочна форма навчання),
які навчаються за спеціальністю 226 «Фармація, промислова фармація»
складена проф. Лесик Р.Б., доц. Камінський Д.В., доц. Крицишин-Дилевич А.П., доц. Демчук
І.Л., ст. викл. Новікевич О.Т., доц. Лозинський А.В.

(вказати авторів, їхні посади, наукові ступені та вчені звання)

на підставі примірної програми навчальної дисципліни _____, що затверджена ДУ
«Центральний методичний кабінет з вищої медичної освіти МОЗ України»

_____ та навчальної програми, затвердженої профільною
(дата затвердження)

методичною комісією (протокол №3 від 21.06.2022)

Зміни та доповнення до програми навчальної дисципліни на 2022-2023 н.р.

№ з/п	Зміст внесених змін (доповнень)	Дата і № протоколу засідання кафедри	Примітки
	Немає		

Завідувач кафедри
проф. Лесик Р.Б.

(підпис)

1. ОПИС НАВЧАЛЬНОЇ ДИСЦИПЛІНИ

Зростаюча кількість лікарських засобів, інноваційних підходів до дизайну та оптимізації біологічно активних сполук вимагає поглибленого вивчення аспектів «хімії лікарських засобів», зокрема підходів до їх створення, хімічних особливостей реалізації біологічної дії та метаболізму. Курс за вибором «Хімія ліків» направлений на формування чіткого розуміння про первинність хімічної структури біологічно активних сполук та лікарських засобів в реалізації біологічного ефекту. Це особливо важливо в контексті холістичної концепції – «*від ідеї – до препарату*», що є базисною як для фармацевтичної галузі загалом, так і в навчанні майбутніх фахівців зокрема. Вдалою ілюстрацією якої є силденафіл – історія впровадження і використання якого включає – фундаментальні дослідження ролі оксиду азоту; дослідження родини фосфодіестераз; дизайн високоафінних/селективних інгібіторів; до-клінічні та клінічні дослідження; впровадження Viagra® для лікування еректильної дисфункції; впровадження генериків та аналогів; продовження досліджень артеріальної/легеневої гіпертензії (в тому числі NO-асоційованих процесів); впровадження Revatio® для лікування легеневої артеріальної гіпертензії. З іншого боку невід’ємним завданням для розуміння сучасних підходів та методів створення нових лікарських засобів є вивчення взаємозв’язку структура – активність. Розуміння хімічного підґрунтя різноманітності та спорідненості фармакологічних ефектів лікарських засобів та біологічно активних сполук дозволяє майбутньому спеціалісту не тільки глибше розуміти аспекти реалізації фармакологічної активності а й формувати можливі напрямки модифікації молекулярної структури потенційних лікарських засобів з використанням методів органічного синтезу.

Програма з курсу за вибором «Хімія ліків» для студентів III курсу фармацевтичного факультету складена згідно з освітньо-кваліфікаційною характеристикою (ОКХ) і освітньо-професійними програмами (ОПП) підготовки фахівців освітньо-кваліфікаційного рівня «спеціаліст».

**Опис вибіркової дисципліни «Хімія ліків»
для студентів фармацевтичного факультету
за спеціальністю 226 «Фармація, промислова фармація»**

Структура навчальної дисципліни	Кількість кредитів, годин, з них				Рік навчання семестр	Вид контролю
	Всього кредитів ECTS / год.	Аудиторних		СРС		
		Лекцій	Практичних занять			
<i>Очна форма</i>	3,0 90 год	10	20	60	3 курс (VI семестр)	залік
<i>Заочна форма</i>	3,0 90 год	4	4	82	3 курс (VI семестр)	залік

2. МЕТА ТА ЗАВДАННЯ НАВЧАЛЬНОЇ ДИСЦИПЛІНИ

Мета вивчення та завдання курсу за вибором «Хімія ліків» встановлюється на основі ОПП підготовки провізора за фахом відповідно до блоку змістових модулів і є основою для побудови змісту навчальної програми.

Метою навчальної дисципліни є вивчення підходів до створення інноваційних лікарських засобів, аспектів хімічного перетворення молекул лікарських засобів при реалізації їх фармакологічної активності та метаболізму, взаємозв'язку структура-активність в межах певних фармакологічних груп.

1.1. *Компетентності та результати навчання*, формуванню яких сприяє дисципліна (взаємозв'язок з нормативним змістом підготовки здобувачів вищої освіти, сформульованим у термінах результатів навчання у Стандарті вищої освіти).

Згідно з вимогами проекту Стандарту вищої освіти дисципліна забезпечує набуття студентами **компетентностей**:

- загальні: ЗК2; ЗК6; ЗК11; ЗК12.
- фахові: ФК 4; ФК 7; ФК 12; ФК 20

Деталізація компетентностей відповідно до дескрипторів НРК у формі «Матриці компетентностей».

Матриця компетентностей

№	Компетентність	Знання	Уміння	Комунікація	Автономія та відповідальність
1	ЗК 2. Здатність застосовувати знання у практичних ситуаціях	Знати методи реалізації знань у вирішенні практичних питань	Вміти використовувати фахові знання для вирішення практичних ситуацій	Встановлювати зв'язки із суб'єктами практичної діяльності	Нести відповідальність за своєчасність прийнятих рішень
2	ЗК 6. Знання та розуміння предметної області та розуміння професії.	Знати структуру та особливості професійної діяльності	Вміти здійснювати професійну діяльність, що потребує оновлення та інтеграції знань	Формувати комунікаційну стратегію у професійній діяльності	Нести відповідальність за професійний розвиток з високим рівнем автономності
3	ЗК 11. Здатність оцінювати та	Знати методи оцінювання	Вміти забезпечувати якісне виконання	Встановлювати зв'язки для	Нести відповідальність

	забезпечувати якість виконуваних робіт.	показників якості діяльності	професійної роботи	забезпечення якісного виконання робіт	ь за якісне виконання робіт
4	ЗК 12. Здатність проведення досліджень на відповідному рівні	Знати компоненти системи охорони здоров'я, планування та оцінку наукового дослідження	Здійснювати пошук наукових джерел інформації; здійснювати вибір методик проведення наукового дослідження; використовувати методи математичного аналізу і моделювання, теоретичного і експериментального дослідження у фармації.	Використовувати інформаційні дані з наукових джерел	Нести відповідальність за розробку та реалізацію запланованих проектів
5	ФК 4. Здатність забезпечувати раціональне застосування рецептурних та безрецептурних лікарських засобів та інших товарів аптечного асортименту згідно з фізико-хімічними, фармакологічними характеристиками, біохімічними, патофізіологічними особливостями конкретного захворювання та фармакотерапевтичними схемами його лікування	Знати: хімічну будову лікарських засобів; основні групи біологічно активних речовин лікарської рослинної сировини; зв'язок "хімічна будова – фармакологічна дія"; механізм дії, фармакологічні ефекти, показання до застосування ліків; характерні ознаки певних фармакологічних та фармакотерапевтичних груп; клініко-біофармацевтичні особливості різних лікарських форм; нові лікарські форми пролонгованої дії. Терапевтичні системи доставки лікарських засобів; характеристика видів дії та шляхів введення лікарських препаратів; вплив ендогенних чинників (генетичні, вікові та статеві анатомо-фізіологічні особливості людини, захворювань окремих органів і систем) на фармакокінетику та фармакодинаміку (фармакологічні та токсикологічні	Проводити порівняльну характеристику лікарських засобів з урахуванням хімічної будови, механізму дії та фармакологічних властивостей з метою визначення переваг та недоліків окремих препаратів надавати порівняльну характеристику оригінальним (інноваційним) лікарським засобам (брендам) та їх копіям – генеричним лікам, керуючись даними клініко-фармакологічних досліджень, фармакоекономічних показників та інформаційною базою даних про лікарські засоби для обґрунтування оптимального вибору лікарського препарату; визначати переваги та недоліки тієї чи іншої лікарської форми конкретних лікарських препаратів різних фармакологічних груп з урахуванням біофармацевтичних, фармакокінетичних та фармакологічних особливостей	Отримувати необхідну інформацію з визначених джерел для забезпечення умов надання якісної та безпечної фармацевтичної допомоги	Нести відповідальність за обґрунтованість управлінських рішень щодо поліпшення якості фармацевтичної допомоги

		<p>властивості) ліків; основи фармакогенетики. Роль спадкової (генетичної) патології в механізмах індивідуальної переносимості ліків; основи хронофармокології. Вплив природних та циркадних ритмів людини на терапевтичну ефективність ліків; взаємодію лікарських речовин та їжі на етапах всмоктування, метаболізму та виведення; поняття про біоеквівалентність лікарських препаратів та принципи їх клінічного вивчення; поняття про оригінальні (інноваційні) препарати та генерики. Вимоги, що ставляться до генеричних лікарських засобів; сучасні схеми та напрямки фармакотерапії найбільш поширених хвороб; явища, що виникають при повторному та тривалому прийомі лікарських засобів; фармакологічні групи лікарських засобів, які можуть викликати лікарську залежність та механізми її розвитку; основні конституціональні типи людини та їх аномалії; особливості функціонування органів та систем при типових патологічних</p>	<p>лікарського засобу, а також анатомо-фізіологічних особливостей хворого (вік, стать, фізичний стан та ін.); визначати вплив факторів, які залежать від стану і особливостей організму людини (фізіологічні, патологічні тощо) на процеси всмоктування, розподілу, депонування, метаболізму та виведення лікарського засобу, ґрунтуючись на результатах опитування та анамнезі хворого; на основі анатомо-фізіологічних особливостей людини, фармакологічних властивостей лікарських препаратів та лікарських форм визначати оптимальний режим введення ліків (час, кратність, тривалість); визначати можливий вплив їжі на фармакокінетичні та фармакологічні властивості лікарських засобів (час та кількість всмоктування, тривалість дії, шлях виведення, можливість прояву небажаної дії та ін.) для підвищення ефективності та зменшення побічних ефектів; на основі фармакологічних і токсикологічних властивостей лікарських засобів визначати можливі негативні ефекти ліків (прояви алергії, гематотоксична і</p>	
--	--	-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	--

		<p>процесах; клінічні прояви (симптоми та синдроми) захворювань, за якими призначаються лікарські засоби; біохімічний склад їжі; біохімію ферментів.</p>	<p>гепатотоксична дія, виникнення звикання та пристрасті тощо) для проведення заходів щодо їх запобігання.</p>		
6	<p>ФК 7. Здатність забезпечувати належне зберігання лікарських засобів та інших товарів аптечного асортименту відповідно до їх фізико-хімічних властивостей та правил Належної практики зберігання (GSP) у закладах охорони здоров'я</p>	<p>Знати: класифікацію лікарських засобів та лікарських форм; накази МОЗ України щодо отримання, зберігання та видачі отруйних, наркотичних і прирівняних до них лікарських засобів; фізико-хімічні властивості лікарських речовин. Види тари, закупорювальних засобів і пакувальних матеріалів, які використовуються у медицині та фармації; накази МОЗ України про організацію зберігання в аптечних закладах різних груп лікарських засобів та виробів медичного призначення; правила зберігання лікарських речовин з різними фізико-хімічними властивостями; фармакологічні властивості лікарських засобів; стабільність та терміни зберігання лікарських засобів.</p>	<p>Забезпечувати відповідні умови зберігання отруйних, наркотичних та прирівняних до них лікарських засобів, а також лікарських форм з ними; забезпечувати умови для запобігання небажаних наслідків, враховуючи можливий вплив умов зберігання на якість товарів аптечного асортименту, лікарської рослинної сировини та виробів медичного призначення; контролювати умови зберігання сировини та матеріалів на підприємствах фармацевтичного профілю; визначати стабільність лікарських засобів та виробів медичного призначення при зберіганні протягом встановлених строків придатності; перевіряти ліки, у яких скінчився строк придатності на можливість подовження строку їх подальшого застосування у медичній практиці, оформляти відповідний паспорт якості.</p>	<p>Проводити постійний моніторинг належного зберігання лікарських засобів та виробів медичного призначення на підприємствах фармацевтичного профілю</p>	<p>Нести відповідальність за зберігання лікарських засобів та виробів медичного призначення відповідно до Належної практики зберігання (GSP) у закладах охорони здоров'я</p>
7	<p>ФК 12. Здатність використовувати</p>	<p>Знати: - основи системи права і</p>	<p>- Користуватись нормативно-правовими</p>	<p>Формувати висновки та</p>	<p>Нести відповідальність</p>

<p>у професійній діяльності знання нормативно-правових, законодавчих актів України та рекомендацій належних фармацевтичних практик.</p>	<p>фармацевтичного законодавства; - основні механізми державного регулювання фармацевтичної діяльності; - принципи організації надання фармацевтичної допомоги населенню; - основні принципи організації фармацевтичного забезпечення населення; - правові та етичні норми фармацевтичної діяльності</p>	<p>актами, що регламентують фармацевтичну діяльність в Україні та за кордоном; - відстежувати та визначати зміни і доповнення у вітчизняному фармацевтичному законодавстві; - складати відомості про матеріально-технічну базу аптеки та аптечного пункту, а також організаційні документи, необхідні для їх діяльності; - формувати відносини з хворими та лікарями з метою виконання етичних критеріїв ВООЗ та принципів належної аптечної практики щодо просування лікарських засобів на ринку, мінімізації зловживання та невірному використанні лікарських засобів</p>	<p>фахово застосовувати закони та нормативні документи</p>	<p>ь за якісне та своєчасне використання нормативних документів у професійній діяльності</p>
-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	------------------------------------------------------------	----------------------------------------------------------------------------------------------

9	<p>ФК 20. Здатність здійснювати розробку методик контролю якості лікарських засобів, у тому числі активних фармацевтичних інгредієнтів, лікарської рослинної сировини і допоміжних речовин з використанням фізичних, хімічних, фізико-хімічних, біологічних, мікробіологічних, фармакотехнологічних та фармакоорганолептичних методів контролю</p>	<p>Знати: - якісний аналіз катіонів та аніонів; - лікарські засоби неорганічної природи; - елементний аналіз та аналіз за функціональними групами; - функціональний аналіз органічних сполук за функціональними групами; - загальні методи аналізу неорганічних та органічних лікарських сполук; - хімічні титриметричні методи аналізу; - хроматографічні методи ідентифікації, дослідження чистоти та кількісного вмісту лікарських засобів; - оптична активність і питоме обертання; - гравіметричний метод аналізу; - функціональний аналіз органічних сполук; - основні поняття титриметричного аналізу; - спектральні методи аналізу</p>	<p>- визначати катіони і аніони діючих речовин неорганічної природи у сировині, матеріалах, напівпродуктах та готовій продукції хімічними методами; - визначати функціональні групи діючих речовин органічної природи у сировині, матеріалах, напівпродуктах, готовій продукції; - готувати титровані, робочі розчини і розчини індикаторів з хімічних реактивів та встановлювати процентну концентрацію і молярність титриметричними та фізико-хімічними методами; -</p>	<p>Розробляти методики контролю якості фармацевтичної продукції</p>	<p>Нести відповідальність за валідність розроблених методик контролю якості</p>
---	-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	---------------------------------------------------------------------	---------------------------------------------------------------------------------

Результати навчання:

Інтегративні кінцеві програмні результати навчання, формуванню яких сприяє навчальна дисципліна:

ПРН 1 Проводити професійну діяльність у соціальній взаємодії оснований на гуманістичних і етичних засадах; ідентифікувати майбутню професійну діяльність як соціально значущу для здоров'я людини.

ПРН 2 Застосовувати знання з загальних та фахових дисциплін у професійній діяльності.

ПРН 3 Дотримуватись норм санітарно-гігієнічного режиму та вимог техніки безпеки при здійсненні професійної діяльності.

ПРН 4 Демонстрування вміння самостійного пошуку, аналізу та синтезу інформації з різних джерел та використання цих результатів для рішення типових та складних спеціалізованих завдань професійної діяльності.

ПРН 6 Аргументувати інформацію для прийняття рішень, нести відповідальність за них у стандартних і нестандартних професійних ситуаціях; дотримуватися принципів деонтології та етики у професійній діяльності.

ПРН 7 Виконувати професійну діяльність з використанням креативних методів та підходів.

ПРН 8 Здійснювати професійне спілкування державною мовою, використовувати навички усної комунікації іноземною мовою, аналізуючи тексти фахової спрямованості та перекладати іншомовні інформаційні джерела.

ПРН 9 Здійснювати професійну діяльність використовуючи інформаційні технології, «Інформаційні бази даних», системи навігації, Internet-ресурси, програмні засоби та інші інформаційно-комунікаційні технології.

ПРН 12 Аналізувати інформацію, отриману в результаті наукових досліджень, узагальнювати, систематизувати й використовувати її у професійній діяльності

ПРН 14 Визначати переваги та недоліки лікарських засобів різних фармакологічних груп з урахуванням їхніх хімічних, фізико-хімічних, біофармацевтичних, фармакокінетичних та фармакодинамічних особливостей. Рекомендувати споживачам безрецептурні лікарські засоби та інші товари аптечного асортименту з наданням консультативної допомоги та фармацевтичної опіки .

ПРН 16 Визначати вплив факторів, що впливають на процеси всмоктування, розподілу, депонування, метаболізму та виведення лікарського засобу і обумовлені станом, особливостями організму людини та фізико-хімічними властивостями лікарських засобів.

ПРН 19. Прогнозувати та визначати вплив факторів навколишнього середовища на якість лікарських засобів та споживчі характеристики інших товарів аптечного асортименту під час їх зберігання.

ПРН 24 Планувати та реалізовувати професійну діяльність на основі нормативно-правових актів України та рекомендацій належних фармацевтичних практик.

ПРН 31 Здійснювати усі види контролю якості лікарських засобів; складати сертифікати якості серії лікарського засобу та сертифікату аналізу враховуючи

вимоги чинних нормативних документів, Державної фармакопеї України та результати проведеного контролю якості. Розробляти специфікації та методики контролю якості відповідно до вимог чинної Державної фармакопеї.

Завданням курсу за вибором «хімія ліків» є формування знань і вмінь при аналізі структури лікарських засобів та, зокрема, аспектів зв'язку структура – активність в ряді певних фармакологічних груп

У результаті вивчення навчальної дисципліни студент повинен:

- знати хімічну та фармакологічну класифікацію лікарських засобів;
- засвоїти сучасні підходи/тенденції у пошуку нових лікарських засобів;
- орієнтуватися в основних напрямках перетворень структури лікарських засобів при реалізації їх фармакологічної активності та метаболізмі;
- вміти аналізувати взаємозв'язок між хімічною структурою та фармакологічною дією ліків.

3. ПРОГРАМА ВИБІРКОВОЇ ДИСЦИПЛІНИ

Змістовий модуль 1. *Створення лікарських засобів та біологічно-активних сполук*

Конкретні цілі:

- *Засвоїти основні сучасні підходи до створення інноваційних лікарських засобів*
- *Орієнтуватися в сучасних підходах до пошуку та оптимізації структури сполук-лідерів*

Тема 1. Основні підходи до створення інноваційних лікарських засобів: основні стратегії та підходи; етапи створення лікарських засобів – «від молекули до препарату»

Тема 2. Сполуки-лідери в створенні нових лікарських засобів. Підходи до одержання; методи модифікації та оптимізації

Тема 3. Інноваційні підходи до створення нових лікарських засобів. Фрагмент-орієнтований дизайн, ліганд-орієнтований дизайн, мішень-орієнтований дизайн, структурно-орієнтований дизайн лікарських засобів

Тема 4. Синтетичні та природні сполуки – донори сірководню, використання в створенні потенційних ЛЗ

Тема 5. Ліганди рецепторів активації проліферації пероксисом (Peroxisome proliferator-activated receptor) як приклад мішень-орієнтованого дизайну ЛЗ.

Змістовий модуль 2. *Механізми дії, перетворення лікарських засобів та зв'язок між структурою та активністю.*

Конкретні цілі:

- *Засвоїти основні етапи метаболізму, та основні механізми дії лікарських засобів, зважаючи на хімічну трансформацію структури лікарського засобу.*
- *Аналізувати аспекти взаємозв'язку структура – біологічна активність при вивченні певних класів лікарських засобів*

Тема 6. Основні етапи метаболізму, та механізми дії лікарських засобів. Поняття ADME/Tox. Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Функціональні групи та реакції залучені в метаболічні перетворення; поняття про про-ліки, подвійні ліки.

Тема 7. Зв'язок між структурою і активністю – як базисне поняття хімії ліків. Біоізомеризм. Фармакофори

Тема 8. Антиметаболіти в створенні лікарських засобів – аспекти хімічної модифікації. Подібність/відмінність хімічної структури та біологічного ефекту.

Змістовий модуль 3. *Аспекти медичної хімії вибраних груп лікарських засобів*

Конкретні цілі:

- *Знати основні хімічні класи сполук з певною фармакологічною активністю*
- *Знати основні методи синтезу, особливості біологічної дії та метаболізму, аспекти зв'язку структура-активність в певній фармакологічній групі.*

Тема 9. Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)

Тема 10. Аспекти медичної хімії похідних фенотіазину. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

Тема 11. Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

Тема 12. Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

Тема 13. Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

Тема 14. Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.

Тема 15. Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.

Тема 16. Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

Тема 17. Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

Тема 18. Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

Тема 19. Аспекти медичної хімії протівірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

Тема 20. Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

4. СТРУКТУРА ВИБІРКОВОЇ ДИСЦИПЛІНИ

№ п/ п	Тема	Лекції	Практичні заняття	СРС	Індивідуальна робота
<i>Змістовий модуль 1. Створення лікарських засобів та біологічно-активних сполук</i>					
1	Основні підходи до створення інноваційних лікарських засобів: основні стратегії та підходи; етапи створення лікарських засобів – «від молекули до препарату»	0,5	1	3	
2	Сполуки-лідери в створенні нових лікарських засобів. Підходи до одержання; методи модифікації та оптимізації	0,5	1	3	
3	Інноваційні підходи до створення нових лікарських засобів. Фрагмент-орієнтований дизайн, ліганд-орієнтований дизайн, мішень-орієнтований дизайн, структурно-орієнтований дизайн лікарських засобів	0,5	1	3	
4	Синтетичні та природні сполуки – донори сірководню, використання в створенні потенційних ЛЗ	0,5	1	3	
5	Ліганди рецепторів активації проліферації пероксисом (Peroxisome proliferator-activated receptor) як приклад мішень-орієнтованого дизайну ЛЗ	0,5	1	3	
<i>Разом за змістовим модулем 1</i>		2,5	5	15	
<i>Змістовий модуль 2. Механізми дії, перетворення лікарських засобів та зв'язок між структурою та активністю.</i>					
6	Основні етапи метаболізму, та механізми дії лікарських засобів. Поняття ADME/Tox. Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Функціональні групи та реакції залучені в метаболічні перетворення; поняття про про-ліки, подвійні ліки.	0,5	1	3	
7	Зв'язок між структурою і активністю – як базисне поняття хімії ліків. Біоізомеризм. Фармакофори.	0,5	1	3	
8	Антиметаболіти в створенні лікарських засобів – аспекти хімічної модифікації. Подібність / відмінність хімічної структури та біологічного ефекту.	0,5	1	3	
<i>Разом за змістовим модулем 2</i>		1,5	3	9	
<i>Змістовий модуль 3. Аспекти медичної хімії вибраних груп лікарських засобів</i>					
9	Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)	0,5	1	3	
10	Аспекти медичної хімії похідних фенотіазіну. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи	0,5	1	3	

	синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.				
11	Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
12	Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
13	Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
14	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
15	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
16	Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
17	Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
18	Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
19	Аспекти медичної хімії противірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
20	Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	1	3	
Разом за змістовим модулем 3		6,0	12	36	
Усього годин 90 / 3,0 кредитів ECTS		10	20	60	
Підсумковий контроль					залік

Заочна форма навчання

№ п/п	Тема	Лекції	Практичні заняття	СРС	Індивідуальна робота
Змістовий модуль 1. Створення лікарських засобів та біологічно-активних сполук					
1	Основні підходи до створення інноваційних лікарських засобів: основні стратегії та підходи; етапи створення лікарських засобів – «від молекули до препарату»	-	-	5	
2	Сполуки-лідери в створенні нових лікарських засобів. Підходи до одержання; методи модифікації та оптимізації	-	-	5	
3	Інноваційні підходи до створення нових лікарських засобів. Фрагмент-орієнтований дизайн, ліганд-орієнтований дизайн, мішень-орієнтований дизайн, структурно-орієнтований дизайн лікарських засобів	0,5	0,5	5	
4	Синтетичні та природні сполуки – донори сірководню, використання в створенні потенційних ЛЗ	0,5	0,5	5	
5	Ліганди рецепторів активації проліферації пероксисом (Peroxisome proliferator-activated receptor) як приклад мішень-орієнтованого дизайну ЛЗ	0,5	-	5	
Разом за змістовим модулем 1		1,5	1	25	
Змістовий модуль 2. Механізми дії, перетворення лікарських засобів та зв'язок між структурою та активністю.					
6	Основні етапи метаболізму, та механізми дії лікарських засобів. Поняття ADME/Tox. Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Функціональні групи та реакції залучені в метаболічні перетворення; поняття про про-ліки, подвійні ліки.	-	-	5	
7	Зв'язок між структурою і активністю – як базисне поняття хімії ліків. Біозостеризм. Фармакофори.	-	0,5	4	
8	Антиметаболіти в створенні лікарських засобів – аспекти хімічної модифікації. Подібність / відмінність хімічної структури та біологічного ефекту.	-	0,5	4	
Разом за змістовим модулем 2		-	1	13	
Змістовий модуль 3. Аспекти медичної хімії вибраних груп лікарських засобів					
9	Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)	-	-	4	
10	Аспекти медичної хімії похідних фенотіазіну. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм,	0,5	-	4	

	SAR.				
11	Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	-	-	4	
12	Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	-	-	4	
13	Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	-	-	4	
14	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	-	-	4	
15	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	0,5	0,5	4	
16	Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	0,5	4	
17	Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	-	-	4	
18	Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	-	-	4	
19	Аспекти медичної хімії противірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	0,5	4	
20	Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5	0,5	4	
Разом за змістовим модулем 3		2,5	2	48	
Усього годин 90 / 3,0 кредитів ECTS		4	4	86	
Підсумковий контроль					залік

5. ТЕМИ ПРАКТИЧНИХ ЗАНЯТЬ

№ п/п	Тема практичного заняття	Кількіст ь годин
	<i>Створення лікарських засобів та біологічно-активних сполук</i>	
1	Основні підходи до створення інноваційних лікарських засобів: основні стратегії та підходи; етапи створення лікарських засобів – «від молекули до препарату»	1
	Сполуки-лідери в створенні нових лікарських засобів. Підходи до одержання; методи модифікації та оптимізації	
	Інноваційні підходи до створення нових лікарських засобів. Фрагмент-орієнтований дизайн, ліганд-орієнтований дизайн, мішень-орієнтований дизайн, структурно-орієнтований дизайн лікарських засобів	
	Синтетичні та природні сполуки – донори сірководню, використання в створенні потенційних ЛЗ	
	Ліганди рецепторів активації проліферації пероксисом (Peroxisome proliferator-activated receptor) як приклад мішень-орієнтованого дизайну ЛЗ	
	<i>Аналіз взаємозв'язків структура-активність. Поняття ADME/Tox</i>	
2	Основні етапи метаболізму, та механізми дії лікарських засобів. Поняття ADME/Tox. Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Функціональні групи та реакції залучені в метаболічні перетворення; поняття про про-ліки, подвійні ліки.	1
	Зв'язок між структурою і активністю – як базисне поняття хімії ліків. Біоізоостеризм. Фармакофори.	
	Антиметаболіти в створенні лікарських засобів – аспекти хімічної модифікації. Подібність / відмінність хімічної структури та біологічного ефекту.	
	<i>Аспекти медичної хімії вибраних груп лікарських засобів</i>	
3	Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)	1
	Аспекти медичної хімії похідних фенотіазіну. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	1
	Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	1
	Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	1
	Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	1
	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС.	1

	Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	
	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	1
	Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	1
	Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	1
	Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	1
	Аспекти медичної хімії противірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	1
	Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	1
РАЗОМ		20

Заочна форма навчання

№ п/п	Тема практичного заняття	Кількість годин
	<i>Створення лікарських засобів та біологічно-активних сполук</i>	
1	Основні підходи до створення інноваційних лікарських засобів: основні стратегії та підходи; етапи створення лікарських засобів – «від молекули до препарату»	1
	Сполуки-лідери в створенні нових лікарських засобів. Підходи до одержання; методи модифікації та оптимізації	
	Інноваційні підходи до створення нових лікарських засобів. Фрагмент-орієнтований дизайн, ліганд-орієнтований дизайн, мішень-орієнтований дизайн, структурно-орієнтований дизайн лікарських засобів	
	Синтетичні та природні сполуки – донори сірководню, використання в створенні потенційних ЛЗ	
	Ліганди рецепторів активації проліферації пероксисом (Peroxisome proliferator-activated receptor) як приклад мішень-орієнтованого дизайну ЛЗ	
	<i>Змістовий модуль 2. Аналіз взаємозв'язків структура-активність. Поняття ADME/Tox</i>	
2	Основні етапи метаболізму, та механізми дії лікарських засобів. Поняття ADME/Tox. Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Функціональні групи та реакції залучені в метаболічні перетворення; поняття про про-ліки, подвійні ліки.	1
	Зв'язок між структурою і активністю – як базисне поняття хімії ліків.	

	Біоізостеризм. Фармакофори.	
	Антиметаболіти в створенні лікарських засобів – аспекти хімічної модифікації. Подібність / відмінність хімічної структури та біологічного ефекту.	
	Аспекти медичної хімії вибраних груп лікарських засобів	
3	Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)	2
	Аспекти медичної хімії похідних фенотіазіну. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	
	Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	
	Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	
	Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	
	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	
	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	
	Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	
	Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	
	Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	
Аспекти медичної хімії протівірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.		
Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.		
РАЗОМ		4

6. САМОСТІЙНА РОБОТА

№ п/п	Тема самостійної роботи	Кількіст ь годин
1	Етапи створення лікарських засобів – «від молекули до препарату», основні стратегії у створенні лікарських засобів	3
2	Сполуки лідери – пошук та модифікація	3
3	Спрямований дизайн сполук-лідерів: фрагмент-орієнтований дизайн, ліганд-орієнтований дизайн, мішень-орієнтований дизайн, структурно-орієнтований дизайн.	3
4	Використання досягнень фундаментальних досліджень в підходах до створення нових лікарських засобів: газотрансмітери при створенні нових ЛЗ	3
5	Рецептор орієнтований дизайн у створенні полі фармакологічних агентів – агоністи/антагоністи лігандів рецепторів активації проліферації пероксисом. Глітазони	3
6	Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Параметри ADME/Tox – хімічні аспекти	3
7	Зв'язок між структурою і активністю – подібність VS різноманітність	3
8	Метаболіти та антиметаболіти в створенні лікарських засобів	3
9	Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)	3
10	Аспекти медичної хімії похідних фенотіазіну. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	3
11	Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	3
12	Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	3
13	Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	3
14	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	3
15	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	3
16	Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	3

17	Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	3
18	Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	3
19	Аспекти медичної хімії протівірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	3
20	Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	3
	РАЗОМ	60

Заочна форма

№ п/п	Тема самостійної роботи	Кількість годин
1	Етапи створення лікарських засобів – «від молекули до препарату», основні стратегії у створенні лікарських засобів	5
2	Сполуки лідери – пошук та модифікація	5
3	Спрямований дизайн сполук-лідерів: фрагмент-орієнтований дизайн, ліганд-орієнтований дизайн, мішень-орієнтований дизайн, структурно-орієнтований дизайн.	4
4	Використання досягнень фундаментальних досліджень в підходах до створення нових лікарських засобів: газотрансмітери при створенні нових ЛЗ	4
5	Рецептор орієнтований дизайн у створенні полі фармакологічних агентів – агоністи/антагоністи лігандів рецепторів активації проліферації пероксисом. Глітазони	4
6	Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Параметри ADME/Tox – хімічні аспекти	4
7	Зв'язок між структурою і активністю – подібність VS різноманітність	4
8	Метаболіти та антиметаболіти в створенні лікарських засобів	4
9	Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)	4
10	Аспекти медичної хімії похідних фенотіазіну. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	4
11	Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	4
12	Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості	4

	біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	
13	Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	4
14	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	4
15	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	4
16	Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	4
17	Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	4
18	Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	4
19	Аспекти медичної хімії протівірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	4
20	Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	4
	РАЗОМ	82

7. ТЕМАТИЧНИЙ ПЛАН ЛЕКЦІЙ

№ п/п	Тема лекції	Кількіст ь годин
1	Етапи створення лікарських засобів – «від молекули до препарату», основні стратегії у створенні лікарських засобів	0,5
2	Сполуки лідери – пошук та модифікація	0,5
3	Спрямований дизайн сполук-лідерів: фрагмент-орієнтований дизайн, ліганд-орієнтований дизайн, мішень-орієнтований дизайн, структурно-орієнтований дизайн.	0,5
4	Використання досягнень фундаментальних досліджень в підходах до створення нових лікарських засобів: газотрансмітери при створенні нових ЛЗ	0,5
5	Рецептор орієнтований дизайн у створенні полі фармакологічних агентів – агоністи/антагоністи лігандів рецепторів активації проліферації пероксисом. Глітазони	0,5
6	Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Параметри ADME/Tox – хімічні аспекти	0,5
7	Зв'язок між структурою і активністю – подібність VS різноманітність	0,5
8	Метаболіти та антиметаболіти в створенні лікарських засобів	0,5
9	Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)	0,5
10	Аспекти медичної хімії похідних фенотіазіну. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5
11	Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5
12	Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5
13	Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5
14	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	0,5
15	Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.	0,5
16	Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5

17	Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5
18	Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5
19	Аспекти медичної хімії протівірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5
20	Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.	0,5
	РАЗОМ	10

Заочна форма

№ п/п	Тема лекції	Кількість годин
1	<p>Етапи створення лікарських засобів – «від молекули до препарату», основні стратегії у створенні лікарських засобів</p> <p>Сполуки лідери – пошук та модифікація</p> <p>Спрямований дизайн сполук-лідерів: фрагмент-орієнтований дизайн, ліганд-орієнтований дизайн, мішень-орієнтований дизайн, структурно-орієнтований дизайн.</p> <p>Використання досягнень фундаментальних досліджень в підходах до створення нових лікарських засобів: газотрансмітери при створенні нових ЛЗ</p> <p>Рецептор орієнтований дизайн у створенні полі фармакологічних агентів – агоністи/антагоністи лігандів рецепторів активації проліферації пероксисом. Глітазони</p> <p>Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Параметри ADME/Tox – хімічні аспекти</p> <p>Зв'язок між структурою і активністю – подібність VS різноманітність</p> <p>Метаболіти та антиметаболіти в створенні лікарських засобів</p> <p>Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)</p> <p>Аспекти медичної хімії похідних фенотіазіну. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.</p>	2

2	<p>Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.</p> <p>Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.</p> <p>Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.</p> <p>Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.</p> <p>Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.</p> <p>Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.</p> <p>Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.</p> <p>Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.</p> <p>Аспекти медичної хімії противірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.</p> <p>Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.</p>	2
	РАЗОМ	4

7. МЕТОДИ НАВЧАННЯ

Основними методами навчання при вивченні курсу за вибором є практичні заняття. Базовий теоретичний матеріал з дисципліни подається на заняттях.

Практичні заняття мають наступний хід виконання:

- Обговорення найважливіших моментів теми і пояснення незрозумілих питань
- Засвоєння ключових питань теми
- Аналіз демонстраційного матеріалу
- Контроль рівня знань студентів
- Оцінювання теоретичної та практичної підготовки студентів з теми заняття.

Контроль вивчення курсу за вибором, засвоєння теоретичного матеріалу та практичних навиків викладачі здійснюють за допомогою тестів формату А та усного опитування. Тестові питання і ситуаційні задачі складені на основі матеріалу, зазначеного в змісті теми і наведеного в методичних рекомендаціях для кожного заняття.

8. МЕТОДИ КОНТРОЛЮ

Основним методом контролю при вивченні курсу за вибором «Хімія ліків» є поточний контроль.

Поточний контроль здійснюється на кожному практичному занятті згідно з конкретними цілями теми.

На кожному практичному занятті студент відповідає на тестові завдання, питання за темою практичного заняття, знання яких необхідні для розуміння поточної теми, самостійної роботи, які стосуються поточного заняття, демонструє знання згідно з темою заняття.

Самостійна робота студентів оцінюється під час поточного контролю теми на відповідному занятті. Засвоєння тем, які виносяться лише на самостійну роботу, контролюється протягом практичних занять.

9. РОЗПОДІЛ БАЛІВ, ЯКІ ОТРИМУЮТЬ СТУДЕНТИ

На кожному практичному занятті знання студента оцінюються за чотирибальною системою («5», «4», «3», «2») згідно з критеріями оцінювання поточної діяльності студента, поданими нижче. Студент повинен отримати оцінку з кожної теми, форми оцінювання поточної навчальної діяльності є стандартизованими і включають контроль теоретичної та практичної підготовки. **Відмінно «5».** Студент правильно відповів на 90-100% тестів формату А. Правильно, чітко, логічно і повно відповідає на стандартизовані питання поточної теми включно з питаннями лекційного курсу і самостійної роботи. Тісно пов'язує теорію з практикою і правильно демонструє виконання (знання) практичних навичок. Вільно читає результати аналізів, вирішує ситуаційні задачі підвищеної складності, вміє узагальнювати матеріал. Володіє методами хімічного аналізу.

Добре «4». Студент правильно відповів на 70-89% тестів формату А. Правильно і по-суті відповідає на стандартизовані питання поточної теми, лекційного курсу і самостійної роботи. Правильно використовує теоретичні знання при вирішенні прикладних завдань. Вміє вирішувати легкі і середньої складності ситуаційні задачі. Володіє необхідними практичними навиками і прийомами їх виконання в обсязі, що перевищує необхідний мінімум.

Задовільно «3». Студент правильно відповів на 50-69% тестів формату А. Неповно, за допомогою додаткових питань, відповідає на стандартизовані питання поточної теми і самостійної роботи. Не може самостійно побудувати чітку логічну відповідь. Під час відповіді і демонстрації практичних навичок студент робить помилки. Вирішує лише найлегші задачі, володіє лише обов'язковим мінімумом методів дослідження.

Незадовільно «2». Студент відповів на менше, ніж 50% тестів формату А. Не знає матеріалу поточної теми, не може побудувати логічну відповідь, не відповідає на додаткові питання, не розуміє змісту матеріалу. Під час відповіді робить значні грубі помилки.

Виставлені за традиційною шкалою оцінки конвертуються у бали.

Максимальна кількість балів, яку може набрати студент при вивченні дисципліни за поточну навчальну діяльність за семестр, формою підсумкового контролю в кінці якого є залік (диференційований залік), становить 200 балів.

Мінімальна кількість балів, яку повинен набрати студент за поточну навчальну діяльність для зарахування дисципліни, становить 120 балів.

Розрахунок кількості балів проводиться на підставі отриманих студентом оцінок за традиційною шкалою під час вивчення дисципліни впродовж семестру, шляхом обчислення середнього арифметичного (СА), округленого до двох знаків після коми. Отримана величина конвертується у бали за багатобальною шкалою таким чином:

$$x = \frac{CA \times 200}{5}$$

Таблиця 1

4-бальна шкала	200-бальна шкала
5	200
4.97	199
4.95	198
4.92	197
4.9	196
4.87	195
4.85	194
4.82	193
4.8	192
4.77	191
4.75	190
4.72	189
4.7	188
4.67	187
4.65	186
4.62	185
4.6	184
4.57	183
4.55	182
4.52	181
4.5	180

4-бальна шкала	200-бальна шкала
4.47	179
4.45	178
4.42	177
4.4	176
4.37	175
4.35	174
4.32	173
4.3	172
4.27	171
4.24	170
4.22	169
4.19	168
4.17	167
4.14	166
4.12	165
4.09	164
4.07	163
4.04	162
4.02	161
3.99	160
3.97	159

4-бальна шкала	200-бальна шкала
3.94	158
3.92	157
3.89	156
3.87	155
3.84	154
3.82	153
3.79	152
3.77	151
3.74	150
3.72	149
3.7	148
3.67	147
3.65	146
3.62	145
3.6	144
3.57	143
3.55	142
3.52	141
3.5	140
3.47	139
3.45	138

4-бальна шкала	200-бальна шкала
3.42	137
3.4	136
3.37	135
3.35	134
3.32	133
3.3	132
3.27	131
3.25	130
3.22	129
3.2	128
3.17	127
3.15	126
3.12	125
3.1	124
3.07	123
3.05	122
3.02	121
3	120
Менше 3	Недостатньо

Визначення кількості балів, яку набрав студент з дисципліни

Оцінка з курсу за вибором дисципліни базується на результатах поточної навчальної діяльності та виражається за двобальною шкалою «зараховано» або «незараховано». Для зарахування студент має отримати за поточну навчальну діяльність бал, не менший 60% суми балів з дисципліни (120 балів).

Бали з дисципліни незалежно конвертуються як в шкалу ETCS, так і в 4-бальну шкалу. Бали шкали ETCS у 4-бальну шкалу не конвертуються, і навпаки.

Бали студентів, які навчаються за однією спеціальністю, з урахуванням кількості балів, набраних з дисципліни ранжуються за шкалою ETCS таким чином:

Таблиця 2

Оцінка ETCS	Статистичний показник
A	Найкращі 10% студентів
B	Наступні 25% студентів
C	Наступні 30% студентів
D	Наступні 25% студентів
E	Останні 10% студентів

10. ПЕРЕЛІК ПИТАНЬ

з курсу за вибором «Хімія ліків»

1. Шлях лікарського засобу «від молекули – до препарату» (основні етапи).
2. Основні механізми дії лікарських засобів та біологічно активних сполук, поняття про молекулярні/біологічні мішені.
3. Характеристика ліганд-орієнтованого та мішень-орієнтованого дизайну біологічно активних сполук, відмінності.
4. Особливості фрагмент-орієнтованого (fragment-based) конструювання біологічно активних сполук.
5. Сполуки-хіти і сполуки-лідери, вимоги, характеристика, відмінності. Методи оптимізації сполук-лідерів.
6. Приклади сполук-лідерів. Приклади привілейованих структур.
7. Використання досягнень медико-біологічних досліджень в створенні лікарських засобів на прикладі газотрансмітерів та PPAR рецепторів
8. Основні етапи метаболізму лікарських засобів. Поняття ADME/Tox.
9. Фізико-хімічні вимоги до біологічно-активних сполук як потенційних лікарських засобів. Функціональні групи та реакції залучені в метаболічні перетворення; поняття про про-ліки, подвійні ліки.
10. Способи покращення ADME/Tox параметрів біологічно-активних сполук: модифікації по гідрокси-, меркаптогрупам; карбокси-, карбаклкокси і карбонільних групах; аміногрупі.
11. Антиметаболіти в створенні лікарських засобів – аспекти хімічної модифікації. Подібність / відмінність хімічної структури та біологічного ефекту (на прикладах конкретних груп препаратів)
12. Зв'язок між структурою і активністю – як базисне поняття хімії ліків.
13. Фармакофорні угруповання. Варіабельність молекул на основі біоізостерної заміни. Аспекти медичної хімії антигіпертензивних ЛЗ (ренін-ангіотензин-альдостеронова система)
14. Аспекти медичної хімії похідних фенотіазіну. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR

15. Аспекти медичної хімії похідних барбітурової кислоти. Характеристика групи, напрямки модифікації, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.
16. Аспекти медичної хімії нестероїдних протизапальних засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.
17. Аспекти медичної хімії адренергічних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.
18. Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на ЦНС. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.
19. Аспекти медичної хімії лікарських засобів з дією на периферичну нервову систему. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, типи біологічних ефектів, метаболізм, SAR.
20. Аспекти медичної хімії антибіотиків (на прикладі бета-лактамів). Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.
21. Аспекти медичної хімії протипаразитарних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.
22. Аспекти медичної хімії протипухлинних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.
23. Аспекти медичної хімії противірусних лікарських засобів. Характеристика хімічних груп, методи синтезу, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.
24. Аспекти медичної хімії лікарських засобів стероїдної будови. Характеристика різних груп, особливості біологічного ефекту, метаболізм, SAR.

11. РЕКОМЕНДОВАНА ЛІТЕРАТУРА

1. Орлов В.Д., Липсон В.В., Иванов В.В. Медицинская химия. – Харьков: Фолио, 2005. – 463 с.
2. Граник В.Г. Основы медицинской химии. – М.: Вузовская книга, 2001. – 384
3. Ковтуненко В.О. Лікарські засоби з дією на центральну нервову систему. – Ірпінь: ВТФ "Перун", 1997. - 464 с.
4. Ковтуненко В.О. Лікарські засоби з дією на периферійну нервову систему : Навчальний посібник для вузів. – Київ: Б.В., 2005. – 426 с.
5. С.А. Андронати Медицинская химия. Структура, свойства, молекулярные механизмы действия биологически активных веществ, Одесса, 2005. – 110с.
<http://www.studfiles.ru/preview/4032318/>
6. Wilson and Gisvold's textbook of organic of organic and pharmaceutical chemistry (Eds. J. Delgado, W. Remers) -10th ed. –Lippincot – 1998 – 970p.
7. Кубиньи Г. В поисках новых соединений-лидеров для создания лекарств // Рос. хим. журн. 2006. – №2. – С.5-17.
8. Patric G.L. An introduction to medicinal chemistry // Oxford, New York, Tokyo, Oxford University Press – 1995 – 336p.
9. Kryshchyshyn, A. P., Kaminskyu, D. V., & Lesyk, R. B. (2015). Створення інноваційних лікарських засобів (підходи та методологія drug design)—одне з ключових питань сучасної фармацевтичної освіти. *Журнал органічної та фармацевтичної хімії*, 13 (1 (49), 49-58.
10. Abraham D. J. Ed. Burger's medicinal chemistry and drug discovery, Vol. 1 Drug discovery. 6th ed. – New Jersey: Wiley, 2003, 932p. ISBN: 0471270903
11. Abraham D. J. Ed. Burger's medicinal chemistry and drug discovery, Vol. 2. Drug discovery and drug development. 6th ed. – New Jersey: Wiley, 2003, 808p. ISBN: 047370282