

**ГОУ ВПО Российско-Армянский (Славянский)
университет**


Утверждено
Директор Института

«11» 06 2024, протокол № 12

УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКИЙ КОМПЛЕКС ДИСЦИПЛИНЫ

Наименование дисциплины: Молекулярная фармакология

Авторы Жамгарян Лусине Гагиковна, кандидат биологических наук

Направление подготовки: 30.05.01 Медицинская биохимия
Наименование образовательной программы: Медицинская биохимия

АННОТАЦИЯ

1.1. Краткое описание содержания данной дисциплины;

Молекулярная фармакология – это, по сути, раздел фармакодинамики, который играет решающую роль в открытии лекарств и терапии. Действие лекарств в биологических системах можно понять только путем изучения молекулярных путей. Учитывая сегодняшние результаты в продвижении открытия лекарств, молекулярная фармакология играет решающую роль благодаря предсказанию мишени лекарства, взаимодействию лекарство-лиганд, изучению действия лекарств на клеточном и молекулярном уровне и методов их применения, которые предоставляют платформу в процессе разработки лекарств и открытия новых молекул лекарств. Этот курс направлен на улучшение понимания молекулярных механизмов, лежащих в основе взаимодействия между определенными лигандами и их рецепторами, уделяется внимание механизмам действия лекарств и тому, как лекарства влияют на органы/организм. Он также направлен на выяснение молекулярной основы действия лекарств, взаимодействия между молекулами лекарств, клеткой и патофизиологических механизмов, которые открывают путь для дальнейшего открытия лекарств. В рамках курса даются базовые представления об общих принципах фармакологии, фармакокинетики, фармакодинамике, метаболизме лекарственных средств; механизмах функционирования и фармакологии периферической и центральной нервной системы; механизмах функционирования и фармакологии сердечно-сосудистой, кровеносной системы и крови; организации эндокринной сигнализации в организме; основных принципах химиотерапии; организации иммунной системы, механизмах воспалительного ответа и связанных с ними фармакологических подходах; основах фармакологической токсикологии; современных принципах разработки лекарственных средств и тенденциях фармакологии.

1.2. Трудоемкость в академических кредитах и часах, формы итогового контроля (экзамен/зачет);

Общий объем составляет 3 академических кредита, 108 академических часов. Итоговый контроль – экзамен.

1.3. Взаимосвязь дисциплины с другими дисциплинами учебного плана специальности (направления)

Содержание дисциплины охватывает аспекты биоорганической химии, биохимии, молекулярной биологии, биомедицинской химии, клеточной биологии и т.п., имеющие отношение к современному пониманию механизмов действия лекарственных препаратов, с использованием методов биохимии, биофизики, молекулярной биологии, структурной

биологии, клеточной биологии и физиологии клеток. Комплекс знаний, предлагаемых курсом, синтезирует современные представления из целого ряда дисциплин на стыке химии и биологии: биоорганической химии, биохимии, молекулярной биологии, биомедицинской химии, молекулярной физиологии.

1.4. Результаты освоения программы дисциплины:

Код компетенции (в соответствии рабочим с учебным планом)	Наименование компетенции (в соответствии рабочим с учебным планом)
ОПК 4	готовностью к ведению медицинской документации

2. УЧЕБНАЯ ПРОГРАММА

2.1. Цели и задачи дисциплины

Основной целью освоения дисциплины является усвоение студентами основных положений молекулярной фармакологии и общей фармакологии отдельных систем организма, изучение классификации лекарственных средств, фармакологических групп и основных представителей, молекулярных основ действия лекарственных средств, принципов применения знаний о молекулярных механизмах нормальных и патологических процессов для терапии и охраны здоровья человека; формирование умения применения полученных знаний для научно-исследовательской работы и в сфере внепрофессиональной деятельности. Курс призван существенно расширить познания студентов в области молекулярных основ нормальной и патологической биологии, а также ознакомить студентов с влиянием природных и синтетических физиологически активных веществ на процессы в клетке.

2.2. Трудоемкость дисциплины и виды учебной работы (в академических часах и зачетных единицах)

Виды учебной работы	Всего, в акад. часах	Распределение по семестрам
		<u>9</u> сем
1	2	3
1. Общая трудоемкость изучения дисциплины по семестрам, в т. ч.:		
1.1. Аудиторные занятия, в т. ч.:		
1.1.1. Лекции	34	34
1.1.2. Практические занятия, в т. ч.	34	34
1.2. Самостоятельная работа, в т. ч.:	13	13
Итоговый контроль (Экзамен, Зачет, диф. зачет -	Экзамен 27	Экзамен 27

указать)		
----------	--	--

2.3. Содержание дисциплины

2.3.1. Тематический план и трудоемкость аудиторных занятий (модули, разделы дисциплины и виды занятий) по рабочему учебному плану

Разделы и темы дисциплины	Всего (ак. часов)	Лекции (ак. часов)	Практ. Занятия (ак. часов)	Семинары (ак. часов)	Лабор. (ак. часов)
1	2=3+4+5+6 +7	3	4	5	6
Тема 1. Введение в молекулярную фармакологию. Общая фармакология. Научные подходы к созданию новых лекарственных препаратов. Принципы доказательной медицины	10	4	6		
Тема .2. Определение и классификация молекулярных мишеней для лекарств. Типы рецепторов и сигнальные пути.	8	4	4		
Тема 3. Молекулярная фармакология средств, влияющих на периферическую и на центральную нервную систему	6	4	2		
Тема 4. Молекулярная фармакология средств для лечения нейродегенеративных заболеваний. Молекулярная фармакология нейролептиков, транквилизаторов, седативных средств	6	4	2		
Тема 5. Пептидергическая система. Молекулярная фармакология наркотических анальгетиков.	6	4	2		
Тема 6. Молекулярная фармакология средств, влияющих на сердечно-сосудистую систему и на свертывающую систему крови.	10	4	6		
Тема .7. Молекулярная фармакология средств, влияющих на функции исполнительных органов	8	4	4		
Тема .8. Молекулярная фармакология средств, влияющих на процессы тканевого обмена, воспаления и иммунные процессы	8	4	4		
Тема 9. Молекулярная фармакология химиотерапевтических средств	8	4	4		
ИТОГО	68	34	34		

2.3.2. Краткое содержание разделов дисциплины в виде тематического плана

Тема 1. Введение в молекулярную фармакологию. Научные подходы к созданию новых лекарственных препаратов. Принципы доказательной медицины.

Общая фармакология, молекулярная фармакология Фармакодинамика и фармакокинетика лекарственных веществ. Молекулярные основы фармакокинетики лекарственных средств. Молекулярные основы фармакодинамики лекарственных средств. Механизмы действия лекарственных средств. Механизмы действия и идентификация цели. Обсуждение концепций и современных теорий молекулярной фармакологии и лекарств, развитие с акцентом на традиционную молекулярную фармакологию и процессы доставки лекарств. Деонтология медико-биологического эксперимента. Основные этапы доклинического изучения препаратов. Поиск новых фармакологически активных веществ, последующее изучение их лекарственных свойств, доклинические исследования, разработка технологий производства фармацевтических субстанций.

«Основная и дополнительная литература».

- 1- Курс лекций по общей фармакологии: учебно-методическое пособие / Л. В. Прокофьева [и др.]. – Ульяновск: УлГУ, 2017. – с. 155
- 2- Ronald L. Davis. Mechanism of Action and Target Identification: A Matter of Timing in Drug Discovery. iScience 2020, Sep 25; 23(9):
<https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC7479624/>
- 3- Chapter 1 Pharmacokinetics & Pharmacodynamics.
<https://www.ncbi.nlm.nih.gov/books/NBK595006/>

Тема 2. Определение и классификация молекулярных мишеней для лекарств. Типы рецепторов и сигнальные пути.

Понятие о рецепторах как молекулярных мишеней лекарственного средства, Классификация рецепторов, структура, рецептор лекарственного средства, взаимодействие, G-белок, характеристика рецептора, теории рецепторов, агонист, антагонист. Классификация GPCR, регуляция рецепторов: десенситилизация GPCR, понижающая регуляция, повышающая, регуляция, Регуляторы передачи сигналов G-белка. Ионные каналы и рецепторы, связанные с ионными каналами, и их регуляция. Ядерные рецепторы и Трансмембранные сигнальные механизмы, Система вторичных мессенджеров. Транскрипционные факторы, фармакологическая мишень и роль при различных заболеваниях Мембранные транспортеры и реакция на лекарства. Зависимость «доза-эффект» и различные типы антагонизма.

«Основная и дополнительная литература».

- 1- Курс лекций по общей фармакологии: учебно-методическое пособие / Л. В. Прокофьева [и др.]. – Ульяновск: УлГУ, 2017. – с. 155.
- 2- Yang et al. Review article : G protein-coupled receptors: structure- and function-based drug discovery Signal Transduction and Targeted Therapy (2021) 6:7. <https://www.nature.com/articles/s41392-020-00435-w>

Тема 3. Молекулярная фармакология средств, влияющих на периферическую и на центральную нервную систему.

Введение в фармакологию ЦНС. Нейромедиаторы и нейромодуляторы ЦНС Строение вегетативной нервной системы. Молекулярная фармакология средств, влияющих на афферентную нервную систему. Структура, функционирование и основные принципы регуляции холинергического синапса. Холинорецепторы. Молекулярная фармакология холинергических средств, лекарственных средств. Строение и функционирование адренергического синапса. Норадреналин как нейромедиатор. Адренорецепторы. Молекулярная фармакология адренергических средств, лекарственных средств.

Молекулярная фармакология средств, влияющих на афферентную нервную систему.

Местноанестезирующие средства, механизм действия, классификация лекарственных средств.

«Основная и дополнительная литература».

1. Фармакология [Электронный ресурс] / Харкевич Д.А. -11-е изд., испр. И доп.- М.: ГЭОТАР-Медиа, 2015. - <http://www.studmedlib.ru/book/ISBN9785970424278.html>
2. Balasanyan M.G., Dheryan L.G., Baykov A.V., Tananyan A.G., Voskanyan N.A. Pharmacology, Guideline For the third year students, Pharmacology of autonomic nervous system, YSMU, Yerevan-2017-2018
3. Клиническая фармакология: пособие для студентов 6 курса лечебного факультета / М.Р. Конорев, Н.Г. Гурин, О.В. Курлюк, О.П. Дорожкина (под ред М.Р. Конорева). - Витебск: ВГМУ, 2012 - 235 с.
4. Taylor, G. McLeod. Basic pharmacology of local anaesthetics. BJA Educ., 2020 Feb; 20(2): 34–41. <https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC7808030/#bib10>

Тема 4. Молекулярная фармакология средств для лечения нейродегенеративных заболеваний. Молекулярная фармакология нейролептиков, транквилизаторов, седативных средств.

Фармакологическая регуляция центральной нервной системы. Молекулярная фармакология снотворных, противосудорожных, противопаркинсонических средств, механизм действия, классификация лекарственных средств.

Молекулярная фармакология психотропных средств- стимуляторов ЦНС (общетонизирующие, актопротекторы, аналептики, психостимулирующие, ноотропные средства, нейролептики, антидепрессанты, психостимуляторы), механизм действия, классификация лекарственных средств.

«Основная и дополнительная литература».

1. Фармакология [Электронный ресурс] / Харкевич Д.А. -11-е изд., испр. И доп.- М.: ГЭОТАР-Медиа, 2015. - <http://www.studmedlib.ru/book/ISBN9785970424278.html>
2. Клиническая фармакология: пособие для студентов 6 курса лечебного факультета / М.Р. Конорев, Н.Г. Гурин, О.В. Курлюк, О.П. Дорожкина (под ред М.Р. Конорева). - Витебск: ВГМУ, 2012 - 235 с.

Тема 5. Пептидергическая система. Молекулярная фармакология наркотических анальгетиков.

Молекулярная фармакология наркотических анальгетиков. Нейропептиды, классификация опиоидных рецепторов. Молекулярные основы развития лекарственной зависимости. Средства, вызывающие наркоманию Медицинские аспекты наркомании и алкоголизма.

«Основная и дополнительная литература».

1. Фармакология [Электронный ресурс] / Харкевич Д.А. -11-е изд., испр. И доп.- М.:ГЭОТАР-Медиа, 2015. - <http://www.studmedlib.ru/book/ISBN9785970424278.html>
2. Al-Hasani, M. R. Bruchas. Molecular Mechanisms of Opioid Receptor-dependent Signaling and Behavior. Anesthesiology 2011; 115:1363–81 R.
3. Полякова, С. Р. Медицинские аспекты наркомании / С. Р. Полякова, В. М. Коротких, М. М. Осокина, М. М. Магамедэминова. — Текст : непосредственный // Молодой ученый. — 2020. — № 8 (298). — С. 78-79. <https://moluch.ru/archive/298/67528/> (дата обращения: 25.10.2023).

Тема 6. Молекулярная фармакология средств, влияющих на сердечно-сосудистую систему и на свертывающую систему крови.

Молекулярная фармакология антигипертензивных и гипертензивных средств Фармакологическая регуляция артериального давления. Молекулярная фармакология

кардиотонических и антиаритмических средств. Молекулярная фармакология средств, применяемых при недостаточности коронарного кровообращения. Антигипертензивные пептиды, модулирующие функцию РАС. Молекулярные механизмы, связанные с физиологическими реакциями на воспаление и окислительный стресс при сердечно-сосудистых заболеваниях. Механизмы действия, классификация лекарственных средств. Гемостаз, классификация антикоагулянтов и тромболитиков.

«Основная и дополнительная литература».

- 1- Molecular Targets of Antihypertensive Peptides: Understanding the Mechanisms of Action Based on the Pathophysiology of Hypertension. <https://www.mdpi.com/1422-0067/16/1/256>
- 2- Zhazykbayeva S., S. Pabel, A. et al. The molecular mechanisms associated with the physiological responses to inflammation and oxidative stress in cardiovascular diseases. *Biophysical Reviews*, 2020; 12:947–968. <https://link.springer.com/article/10.1007/s12551-020-00742-0>.
- 3- Anticoagulants: A Short History, Their Mechanism of Action, Pharmacology, and Indications. <https://www.mdpi.com/2073-4409/11/20/3214>.
- 4- Molecular Targets of Antihypertensive Peptides: Understanding the Mechanisms of Action Based on the Pathophysiology of Hypertension. *Int. J. Mol. Sci* 2015,16(1), 256-283; <https://doi.org/10.3390/ijms16010256>; <https://www.mdpi.com/1422-0067/16/1/256>
<https://link.springer.com/article/10.1007/s12551-020-00742-0>
<https://www.frontiersin.org/articles/10.3389/fphar.2020.569132/full>
<https://www.ncbi.nlm.nih.gov/books/NBK557411>

Тема 7. Молекулярная фармакология средств, влияющих на функции исполнительных органов.

Лекарственные средства, влияющие на функции органов дыхания и их молекулярная фармакология, механизм действия, классификация. Общая воспалительная реакция при заболеваниях дыхательных путей: патогены, токсины, загрязнители, раздражители и аллергены в качестве воспалительных стимулов, механизм воспаления при астме.

Лекарственные средства, влияющие на функции органов пищеварения и их молекулярная фармакология, механизм действия, классификация. Функциональные желудочно-кишечные расстройства, дисфункция кишечного барьера. Эффекты 5-НТ и его рецепторов в желудочно-кишечном тракте.

«Основная и дополнительная литература».

1-R. Farré ,M. Fiorani, Saeed Abdu Rahiman, Gianluca Matteoli. Intestinal Permeability, Inflammation and the Role of Nutrients. Nutrients 2020, 12(4), 1185. <https://www.mdpi.com/2072-6643/12/4/1185>

2-Current Treatment Options and Therapeutic Insights for Gastrointestinal Dysmotility and Functional Gastrointestinal Disorders.

<https://www.frontiersin.org/articles/10.3389/fphar.2022.808195/full>

3- <https://www.frontiersin.org/articles/10.3389/fphys.2021.567650/full>

4-The Mechanism of Secretion and Metabolism of Gut-Derived 5-Hydroxytryptamine
<https://www.mdpi.com/1422-0067/22/15/7931>

5-<https://www.frontiersin.org/articles/10.3389/fphar.2023.1217306/full>

Тема 8. Молекулярная фармакология средств, влияющих на процессы тканевого обмена, воспаления и иммунные процессы.

Молекулярная фармакология противовоспалительных средств; лекарственные средства, угнетающие воспаление и влияющие на иммунные процессы. Роль липидных медиаторов в развитии воспаления, ключевые участники воспалительного процесса. Простаноиды, их рецепторы и вызываемые эффекты. Противовоспалительные и провоспалительные цитокины.

«Основная и дополнительная литература».

1. Фармакология [Электронный ресурс] / Харкевич Д.А. -11-е изд., испр. И доп.- М.:ГЭОТАР-Медиа, 2015. - <http://www.studmedlib.ru/book/ISBN9785970424278.html>
2. Jun-Ming Zhang, Jianxiong An. Cytokines, Inflammation and Pain. Cytokines, Inflammation and Pain doi: [10.1097/AIA.0b013e318034194e](https://doi.org/10.1097/AIA.0b013e318034194e)

Тема 9. Молекулярная фармакология химиотерапевтических средств.

Химиотерапевтические средства. Основы действия химиотерапевтических средств. Антибиотики: классификация и механизмы действия с акцентом на молекулярные аспекты. Механизм развития устойчивости к антибиотикам. Молекулярные механизмы действия противоопухолевых средств. Классификация лекарственных препаратов по механизму действия. Особенности спектра противоопухолевого действия алкилирующих средств, антиметаболитов, препаратов платины, антибиотиков, моноклональных антител, ингибиторов тирозинкиназ. Ингибиторы топоизомеразы: камптотецины, антрациклины и этопозид. Проблема лекарственной устойчивости при химиотерапии.

«Основная и дополнительная литература».

- 1- Фармакология [Электронный ресурс] / Харкевич Д.А. -11-е изд., испр. И доп.- М.:ГЭОТАР-Медиа, 2015. - <http://www.studmedlib.ru/book/ISBN9785970424278.html>

- 2- Quinolones: Mechanism, Lethality and Their Contributions to Antibiotic Resistance <https://www.mdpi.com/1420-3049/25/23/566>
- 3- Nisha Rijalin. Tetracyclines: Mode of Action and Mechanism of Resistance. Bacteriology, Last Updated December 29, 2023: <https://microbeonline.com/tetracyclines-mode-of-action-and-mechanism-of-resistance/>
- 4- Mechanisms of Multidrug Resistance in Cancer Chemotherapy. <https://www.mdpi.com/1422-0067/21/9/3233>
- 5- Химиотерапевтические средства. Антибиотики. <https://studfile.net/preview/5290991/page:7/>

2.3.3. Краткое содержание семинарских/практических занятий

Изложение материала в процессе семинарских занятий проводится в мультимедийной форме (в виде презентаций, докладов). Смысловая нагрузка семинара смещается в сторону от изложения теоретического материала или экспериментальной статьи к формированию мотивации самостоятельного обучения через постановку проблем обучения и показ путей решения профессиональных проблем в рамках изучаемой темы.

При этом основным методом проведения семинара является метод проблемного изложения материала. Обсуждение какого-либо вопроса, проблемы, рассматривается как метод, активизирующий процесс обучения, изучения сложной темы, теоретической проблемы. Важной характеристикой дискуссии, отличающей её от других видов спора, является аргументированность. Обсуждая дискуссионную проблему, каждая сторона, оппонируя мнению собеседника, аргументирует свою позицию.

2.3.4. Материально-техническое обеспечение дисциплины

Перечень помещений, необходимых для проведения аудиторных занятий по дисциплине:

Специально оборудованные кабинеты и аудитории для проведения лекционных занятий, оснащенные мультимедийными системами для демонстрации учебных материалов,

Наглядные средства, мультимедийные системы, компьютеры, тематические слайды, видеоматериалы, презентации по различным разделам молекулярной фармакологии.

2.4. Модульная структура дисциплины с распределением весов по формам контролей

Формы контролей	Вес формы (форм) текущего контроля в результирующей оценке текущего контроля (по модулям)		Вес формы промежуточного контроля в итоговой оценке промежуточного контроля		Вес итоговой оценки промежуточного контроля в результирующей оценке промежуточных контролей		Вес итоговой оценки промежуточного контроля в результирующей оценке промежуточных контролей (семестровой оценке)	Веса результирующей оценки промежуточных контролей и оценки итогового контроля в результирующей оценке итогового контроля
	M1 ¹	M2	M1	M2	M1	M2		
Вид учебной работы/контроля								
Контрольная работа				1				
Устный опрос <i>(при наличии)</i>		0.2						
Тест <i>(при наличии)</i>								
Письменные домашние задания <i>(при наличии)</i>								
Реферат <i>(при наличии)</i>								
Эссе <i>(при наличии)</i>								
Проект <i>(при наличии)</i>		0.2						
Семинар		0.2						
Веса результирующих оценок текущих контролей в итоговых оценках промежуточных контролей						0.6		
Веса оценок промежуточных контролей в итоговых оценках промежуточных контролей						0.4		
Вес итоговой оценки 1-го промежуточного контроля в результирующей оценке промежуточных контролей								
Вес итоговой оценки 2-го промежуточного контроля в результирующей оценке промежуточных контролей							1	
Вес результирующей оценки промежуточных контролей в результирующей оценке итогового контроля								0.5
Вес итогового контроля (Экзамен) в результирующей оценке итогового контроля								0.5
	$\Sigma = 1$	$\Sigma = 1$	$\Sigma = 1$	$\Sigma = 1$	$\Sigma = 1$	$\Sigma = 1$	$\Sigma = 1$	$\Sigma = 1$

¹ Учебный Модуль

3. Теоретический блок

3.1. Материалы по теоретической части курса

3.1.1. Учебник(и);

1. Фармакология [Электронный ресурс]: электронный учебник для медицинских вузов / Д.А. Харкевич, В.П. Фисенко, О.Н. Чиченков, В.В. Чурюканов, Е.Ю. Лемина, В.А. Шорр; под ред. Д.А. Харкевича. - М.: ГЭОТАР-Медиа, 2016. <http://www.studmedlib.ru/book/06-COS-2401.html>
2. Фармакология [Электронный ресурс]: учебник / под ред. Р.Н. Аляутдина. - 5-е изд., перераб. и доп. - М.: ГЭОТАР-Медиа, 2016. <http://www.studmedlib.ru/book/ISBN9785970437339.html>
3. Фармакология [Электронный ресурс] / Харкевич Д.А. -11-е изд., испр. И доп.- М.: ГЭОТАР-Медиа, 2015. - <http://www.studmedlib.ru/book/ISBN9785970424278.html>
4. Н.Л. Шимановский, М.А. Епинетов, М.Я. Мельников. Молекулярная фармакология и нанофармакология, М.: Физматлит, 2010.
5. А.Г. Гилман, пер. с англ. Под ред. Р.Р. Алиповой. Клиническая фармакология по Гудману и Гилману. В 4 томах, Москва, 2006

3.1.2. Учебное(ые) пособие(я);

1. Курс лекций по общей фармакологии: учебно-методическое пособие / Л.В. Прокофьева [и др.]. – Ульяновск: УлГУ, 2017. – с. 155.
2. Клиническая фармакология: пособие для студентов 6 курса лечебного факультета / М.Р. Конорев, Н.Г. Гурин, О.В. Курлюк, О.П. Дорожкина (под ред М.Р. Конорева). - Витебск: ВГМУ, 2012 - 235 с.
3. Balasanyan M.G., Dheryan L.G., Baykov A.V., Tananyan A.G., Voskanyan N.A. Pharmacology, Guideline For the third year students, Pharmacology of autonomic nervous system, YSMU, Yerevan-2017-2018

3.1.3. Курс лекций;

1. Введение в молекулярную фармакологию (МФ). Научные подходы к созданию новых лекарственных средств (ЛС).
2. Молекулярные основы фармакокинетики ЛС. Пути введения, механизмы всасывания и распределения, связывание с белками плазмы крови, элиминация ЛС.
3. Молекулярная фармакология средств, влияющих на афферентную нервную систему. Молекулярная фармакология ЛС, влияющих на периферическую нервную систему.

4. Строение вегетативной нервной системы. Молекулярная фармакология холинергических средств. Молекулярная фармакология адренергических средств.
 5. Фармакологическая регуляция центральной нервной системы. Молекулярная фармакология снотворных, противоэпилептических, противопаркинсонических средств.
 6. Молекулярная фармакология средств для лечения нейродегенеративных заболеваний. Молекулярная фармакология нейролептиков, транквилизаторов, седативных средств
 7. Пептидергическая система. Молекулярная фармакология наркотических анальгетиков.
 8. Молекулярная фармакология средств, влияющих на сердечно-сосудистую систему и на свертывающую систему крови.
 9. Молекулярная фармакология средств, влияющих на функции исполнительных органов
 10. Молекулярная фармакология средств, влияющих на процессы тканевого обмена, воспаления и иммунные процессы
 11. Молекулярная фармакология химиотерапевтических средств
- 3.1.4. Электронные материалы (электронные учебники, учебные пособия, курсы и краткие конспекты лекций, презентации PPT и т.п.);

<https://www.youtube.com/watch?v=aOofXg1nB0Q>

<https://www.youtube.com/watch?v=OnLsLByuo0E>

<https://www.youtube.com/watch?v=-I-NN2PSAU8>

<https://www.youtube.com/watch?v=JtBtk00EiVM>

Antibiotics - Mechanisms of Action, Animation:

<https://www.youtube.com/watch?v=Cj9UADDIidI>

Antibiotic Resistance, Animation: <https://www.youtube.com/watch?v=8VZH4GZLWZc>

4. Фонды оценочных средств

4.1. Планы практических и семинарских занятий

Целевое назначение практических занятий и семинаров состоит в развитии познавательных способностей, самостоятельности мышления и творческой активности студентов; углублении, расширении, детализировании знаний, полученных на лекции в

обобщенной форме, и содействии выработке навыков профессиональной деятельности. Содержание практических занятий и семинаров соответствует требованиям рабочей программы по дисциплине. В отдельных случаях на практических занятиях и семинарах руководителем занятия сообщаются дополнительные знания. Ведущей дидактической целью семинарских занятий является систематизация и обобщение знаний по изучаемой теме, разделу, формирование умений работать с дополнительными источниками информации (статьи и научные материалы, публикации, конспектировать прочитанное, высказывать свою точку зрения и т.п.

Основной план для проведения практических занятий и семинаров состоит из следующих компонентов и уровней заданий:

- обучение студентов практическим приемам и методам анализа теоретических положений и концепций учебной дисциплины;
- приобретение студентами умений и навыков использования современных теоретических и научно-технических методов в решении конкретных практических задач на установление взаимосвязанности действий;
- демонстрация видеоматериалов, развитие профессионального мышления и познавательной мотивации;
- использование профессиональных знаний в учебных условиях – овладение терминологией соответствующей дисциплины, навыками оперирования формулировками, понятиями, определениями, классификации лекарственных препаратов на основе механизмов их действия и особенностей фармакодинамики;

Семинары могут проходить в виде выступлений студентов с докладами, рефератами и их обсуждением; интеллектуального и коммуникативного тренинга, проводится также повторение и закрепление знаний, общения с аудиторией и т.д.; организации обратной связи руководителя занятия и студентов. План практических занятий в основном типичный и состоит из вступления преподавателя, работа студентов по заданиям преподавателя, и практической части, включающая разбор конкретных ситуаций, решение ситуационных задач, тренировочные упражнения и т.д. В структуру

практического занятия входят: тема занятия, цель занятия, план занятия, материалы для контроля исходного и конечного уровней усвоения, обучающая задача (видеоматериал, статья).

Семинарские и практические занятия проводятся в учебных кабинетах. Продолжительность, как правило, не менее двух академических часов. Необходимыми структурными элементами семинарского и практического занятия, помимо самостоятельной деятельности студентов, являются анализ и оценка выполненных заданий и степени овладения студентами запланированными знаниями и умениями.

4.2. Материалы по практической части курса

Смотреть пункт 3

4.3. Вопросы и задания для самостоятельной работы студентов

- 4.3.1. Что происходит с лекарственным веществом в результате прохождения I и II фаз метаболизма?
- 4.3.2. Как взаимодействие молекул лекарства и мишени определяет эффективность и активность лекарственного препарата? Какие свойства некоторых лекарств позволяют принимать их без постоянного контроля их уровня в плазме крови, в то время как другие лекарства требуют такого контроля? Почему при низком терапевтическом индексе лекарства его нужно применять с большой осторожностью?
- 4.3.3. Почему у пациента, длительное время употреблявшего лекарственный препарат в безопасной дозировке, внезапно может проявиться его токсический эффект?
- 4.3.4. Как дегенерация особой группы нейронов приводит к развитию симптомов, характерных для болезни Паркинсона? Почему леводопа используется для лечения болезни Паркинсона? Как структура этого вещества соотносится со структурой дофамина? Почему потребление белка снижает транспорт леводопы в мозг?
- 4.3.5. Какие реакции вызывают отек при развитии воспалительного процесса? Какие регуляторные пути в воспалительном каскаде можно прервать при помощи известных лекарственных средств?

- 4.3.6. Какие механизмы могут привести к сердечной недостаточности? Почему для ее терапии используют диуретики и ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента?
- 4.3.7. Каким образом высокий уровень холестерина повышает риск развития заболеваний сердечно-сосудистой системы? Каково фармакологическое действие статинов? Как изменяется синтез холестерина при приеме статинов? Как будут изменяться показатели лабораторных тестов при приеме статинов?
- 4.3.8. Основные возможности регуляции холинергической передачи?
- 4.3.9. Опиатные механизмы антиноцицепции. Классификация и эффекты возбуждения подтипов опиатных рецепторов.
- 4.3.10. Каковы патогенетический и молекулярный механизмы антиангинальной активности нитроглицерина?

4.4. Тематика рефератов, эссе и других форм самостоятельных работ

- 4.4.1. Перспективные механизмы доставки лекарственных средств
- 4.4.2. Нанотехнологии в создании лекарственных средств.
- 4.4.3. Фармакология иммуносупрессии
- 4.4.4. Одно- и двухкамерные модели фармакокинетики лекарственных веществ.
- 4.4.5. Фармакогенетика. Зависимость фармакокинетики и фармакодинамики лекарственных средств от генетического профиля пациента.
- 4.4.6. Генотерапия как новое направление в фармакологии.
- 4.4.7. Механизмы развития зависимости при использовании психоактивных соединений.
- 4.4.8. Основные направления фармакологической коррекции аддиктивных состояний.
- 4.4.9. Уровни доказательности эффективности лекарственных средств, применяющихся при лечении сердечной недостаточности
- 4.4.10. Новые направления и перспективы создания противоопухолевых средств

4.5. Образцы вариантов контрольных работ, тестов и/или других форм текущих и промежуточных контролей

- 1- Пожалуйста, сопоставьте фармакокинетические процессы со следующими этапами для препарата
- | | |
|--|----------------------------|
| <u>а.</u> высвобождение и растворение лекарственного средства | всасывание/ абсорбция |
| <u>б.</u> препарат в тканях и системном кровообращении | метаболизм |
| <u>в.</u> выведение лекарства | распределение/ дистрибуция |
| <u>г.</u> превращение лекарства в метаболиты | удаление из организма |

2- Опишите, пожалуйста, биофармацевтические принципы разработки лекарств, основанные на следующем:

а. путь введения, основанный на физиологических факторах

б. биодоступность;

в. Фармакокинетика;

г. предпочтительная лекарственная форма и ее соответствующая дозировка.

Например, для перорального, инъекционного или ингаляционного применения

3- Выберите правильное определение биодоступности:

а. Биодоступность определяется как % дозы лекарственного средства или его активной части, которая абсорбировалась и достигла системного кровообращения в неизменном виде, а следовательно, и места действия;

б. степень всасывания препарата;

в. Биодоступность определяется как % дозы лекарственного средства или его активной части, которая достигает системного кровообращения в измененном виде, и выводится из организма;

г. Часть принятой внутрь дозы, которая попадает в общий кровоток в неизменном виде .

4- Учитывая что биодоступность (F1) пероральной таблетки 0,4 мг составляет 60% по сравнению с биодоступностью (F2) 80% лекарственной формы сиропа (0,1 мг/мл), рассчитайте дозу сиропа, эквивалентную таблетке/

5- Из нижеперечисленных какие относятся к энтеральному , парентеральному путям или другому пути введения ; дополните примерами

перорально, сублингвально, внутримышечно, внутривенно, подкожно, ректально, буккально, интраназально, трансдермально, местно, сублингвально, ингаляционно

6- В процессе первичного метаболизма имеет место участие следующих компонентов

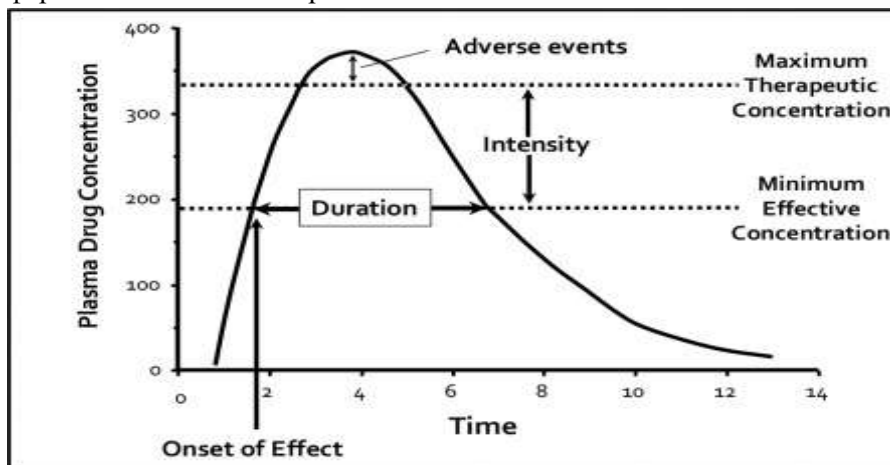
а. Ферменты печени (биотрансформация)_ реакции окисления и конъюгации

б. потеря лекарственного средства на пути в большой круг кровообращения

в. Ферменты кишечной стенки (цитохром Р и другие ферменты печени также могут присутствовать в слое слизистой оболочки)

г. распределение лекарства на основе липофильности

7- Укажите и напишите основные фармакокинетические параметры на приведенной фармакокинетической кривой:



8- Рассчитать долю занятых рецепторов по следующей формуле при концентрации лиганды/лекарства в 1.5 раза больше Kd

$$\text{Fractional occupancy} = \frac{[\text{Ligand}]}{[\text{Ligand}] + K_d}$$

9- Какие утверждения из нижеперечисленных неправильны:

- a.** Лекарство с большей эффективностью менее важно с терапевтической точки зрения, чем препарат с большей потенцией
- б.** Максимальная эффективность лекарства предполагает, что все рецепторы заняты лекарством, и если добавить больше лекарства аддитивного (добавочного) ответа наблюдаться не будет.
- в.** ПОТЕНЦИЯ/ сила ЛЕКАРСТВА: Концентрация препарата, вызывающая эффект, составляющий 50% от максимального эффекта (EC50).
- г.** Максимальный ответ (эффективность) менее важен, чем ПОТЕНЦИЯ/ сила препарата;
- д.** препараты с малым терапевтическим индексом более безопасны, чем с большим

10- Рассчитать терапевтический индекс препарата ТИ=TD50/ED50 если токсическая доза 50% составляет 25 мг а терапевтическая доза 50% 200 мг

11- Заполните в таблице пропущенную информацию “Механизмы действия лекарств”:

Механизм действия	Описание	Пример
Рецептор-опосредованное действие		
	блокируют ионные каналы Na ⁺ , K ⁺ , Cl ⁻ , Ca ²⁺	
		ингибиторы АПФ, ЦОГ, АХЭ
	Непосредственное химическое взаимодействие	
	происходит транспорт лекарств через клеточную мембрану	
	усиление или уменьшение	

	экспрессии или выключение гена	
действие на проницаемость клеточных мембран		стероидные, противоаллергические, противогрибковые, НСПВ препараты

12- Опишите структуру холинергического синапса:

a- аксональные окончания

b-

_____ посредник распознается и формируется соответствующий ответ

c-

_____ пространство 20-40 нм _____

d-

_____ В результате взаимодействия синаптических везикул с пресинаптической мембраной образуются синаптопоры, которые высвобождают медиатор в синаптическую ключицу.

e-

_____ и предотвращает диффузию медиатора в системный кровоток

13- Охарактеризуйте Холинорецепторы:

a- Механизм трансдукции: они соединяются с Gq-белками, активируют фосфолипазу-C (DAG + ИТР3 - Ca²⁺).

_____ Механизм

трансдукции: они связаны с ингибирующим Gi-белком. Активация этих холинорецепторов приводит к инактивации аденилатциклазы (цАМФ): в результате развивается ингибирующее действие.

_____ Ме

ханизм трансдукции: аналогичен M1-рецепторам. Они связаны с Gq-белком.

_____ Механ

изм трансдукции. Эти рецепторы связаны с ионными каналами, например. Na⁺-, Ca²⁺-, K⁺- каналы. Чтобы открыть ионные каналы, две молекулы Аха должны связаться с каждым рецептором.

14- Заполните в пропущенную информацию “ Ингибирование синтеза ацетилхолина”:

1. Гемихолин ингибирует действие _____, участвующего в транспорте холина. В условиях эксперимента его можно использовать для ингибирования синтеза АЦХ.

2. Действие на везикулярный транспорт и депонирование.

Весамикол

_____ в везикулы. В

результате нарушается везикулярный транспорт и хранение АЦХ. Его также используют в экспериментальных условиях.

2. Действия по высвобождению АХ. Ботулинический токсин (Ботокс) путем взаимодействия нарушает выброс АХ в синаптическую щель.
3. Паралитическая активность используется при лечении некоторых заболеваний, характеризующихся мышечным тонусом: спазм пищевода, ахалазии, блефароспазм. используется в косметологии для предотвращения образования морщин.
- 15- Приведите классификацию холинергических препаратов:
- 16- Выберите неправильные варианты для “Фармакологического действия Ингибиторов холинэстеразы”
- а.** Фосфорорганические -препараты очень легко всасываются через кожу и слизистые оболочки, поэтому очень опасны, так как используются в сельском хозяйстве как инсектициды.
- б.** Препараты АХЭ стимулируют перистальтику ЖКТ и секрецию, которая развивается за счет стимуляции М-рецепторов и внутримышечных сплетений кишечника.
- в.** Связываются с Nm-рецепторами нервно-мышечных синапсов, блокируют нервно-мышечную нейротрансмиссию на постсинаптическом уровне, приводят к снижению тонуса скелетных мышц и развитию параличей.
- г.** Блокирует все типы М-рецепторов и, таким образом, ингибирует М-рецепторы, которые уменьшают высвобождение АХ.
- 17- Местноанестезирующие средства_Механизм действия: Выберите правильные варианты:
- а. Блокируют voltage-зависимые натриевые каналы;
- б. Ингибируют действие АХ на холинорецепторы Nn, локализованные в вегетативных ганглиях/симпатических и парасимпатических;
- в. Временно блокируют чувствительные рецепторы и нарушают проведение возбуждения по чувствительным нервным волокнам;
- г. Обратимо блокируют все рецепторы M1, M2 и M3;
- д. При нанесении на слизистые или поверхность кожного дефекта вызывают коагуляцию поверхностных белков с образованием плотной белковой пленки, которая предохраняет чувствительные рецепторы от раздражения.
- 18- Приведите Классификацию Местноанестезирующих средств с примерами: сложные эфиры, амиды. Короткого действия, Средней продолжительности действия, Длительного действия. Виды местной анестезии

- 19- Выберите Физико-химические характеристики местных анестетиков:
- а. рКа
- б. Растворимость в липидах

- в. Связывание с белками
- г. Пути введения
- д. аллергический потенциал
- е. Вазоактивность местных анестетиков
- ж. диффузия местного анестетика через плаценту

20- **Заполните пропущенные детали “Виды местной анестезии”:**

– нанесение местного анестетика на поверхность кожи или слизистых.

Применение -

– пропитывание тканей раствором местного анестетика, путем его введения в низких концентрациях, в больших количествах под давлением.

Применение -

Препараты - анестезин, дикаин, лидокаин, тримекаин, пиромекаин, кокаин.

21- Охарактеризуйте адренорецепторы (распределение рецепторов в тканях и организме, селективность к адреналину или норадреналину):

а-Механизм трансдукции: Как только рецептор активируется, происходит каскад биохимических реакций, в которых метаболические пути включаются или выключаются. Приводит к расслаблению гладких мышц дыхательных путей, к увеличению бронхиальных тканей и снижению сопротивления потоку воздуха. В скелетных мышцах активация рецепторов приводит к активации нестероидного цитоплазматического анаболического пути PI3K/Akt/mTOR/p70S6 и ингибированию катаболического пути FOXO. Эти действия смещают баланс оборота белка в клетках в сторону большего синтеза и меньшей деградации.

б- Механизм трансдукции: все три типа данных адренорецепторов связаны с белком Gs. Активация β-адренорецепторов приводит к активации аденилатциклазы и увеличению цАМФ, активации различных протеинкиназ.

в- Механизм трансдукции: эти рецепторы в основном соединяются с белком Gq. Они ответственны за регуляцию активности мембранных фосфолипидов, а также за проницаемость Ca²⁺-каналов L-типа. Активация таких рецепторов, расположенных в гладких мышцах большинства систем органов, повышает уровень ионов Ca²⁺, что приводит к активации кальмодулин-зависимой киназы легких цепей миозина, необходимой для стимуляции взаимодействия актомиозина и сокращения гладких мышц.

г- Механизм трансдукции. Эти рецепторы ингибируют активность аденилатциклазы и вызывают снижение внутриклеточных уровней циклического аденозинмонофосфата (цАМФ).

22- Укажите возможные способы фармакологического вмешательства в адренергическую нейротрансмиссию:

- а.** Активация или ингибирование холинорецепторов;
- б.** ингибирование ацетилхолинэстеразы;
- в.** Изменение активности регуляторных α_2 и β_2 -рецепторов;
- г.** Влияние на хранение норадреналина в пресинаптических везикулах.

23- Приведите Классификацию препаратов, влияющих на адренергическую систему с примерами:

24- Какие из ниже перечисленных препаратов относятся к адреноблокаторам:

- а.** Clonidine
- б.** Dobutamine
- в.** Prazosine
- г.** Ephedrine
- д.** Metaprolol
- е.** Timolol

4.6. Перечень экзаменационных вопросов

- 1- Молекулярные основы фармакокинетики и фармакодинамики лекарственных средств, механизмы действия лекарств и типы мишеней.
- 2- Молекулярная фармакология холинергических средств, структура, функционирование и основные принципы регуляции холинергического синапса.
- 3- Холинергическая нейротрансмиссия, механизмы трансдукции. Холинорецепторы, агонисты и антагонисты, и антихолинэстеразные лекарственные средства, молекулярные механизмы их действия и мишени.
- 4- Молекулярная фармакология адренергических средств; структура, функционирование и основные принципы регуляции адренергического синапса.
- 5- Адренергическая нейротрансмиссия, механизмы трансдукции. Адренорецепторы, агонисты и антагонисты, симпатомиметики непрямого и смешанного типа, молекулярные механизмы их действия и мишени.
- 6- Нейромедиаторы и нейромодуляторы ЦНС, молекулярные механизмы их действия и мишени.
- 7- Молекулярная фармакология средств, влияющих на афферентную нервную систему. Местноанестезирующие средства, их классификация физико-химические характеристики, токсичность и фармакокинетика.
- 8- Молекулярная структура, типы и функции ГАМКергических рецепторов.

- 9- Молекулярная структура, типы и функции дофамин- и серотонинергических рецепторов.
- 10- Молекулярная структура, типы и функции Глутаматергических рецепторов.
- 11- Молекулярная фармакология антидепрессантов, противоэпилептических, противопаркинсонических средств.
- 12- Пептидергическая система. Молекулярная фармакология наркотических анальгетиков. Молекулярные основы развития лекарственной зависимости.
- 13- Молекулярная фармакология антигипертензивных средств, классификация кардиоваскулярных препаратов. Молекулярные механизмы регуляции артериального давления.
- 14- Молекулярная фармакология кардиотонических, противоишемических и антиаритмических средств. Натрийуретическая пептидная система, вазопептидазы.
- 15- Молекулярная фармакология средств, влияющих на кроветворение и на свертывающую систему крови. Лекарственные средства, влияющие на агрегацию тромбоцитов, свертывание крови и фибринолиз, молекулярные механизмы их действия и мишени.
- 16- Молекулярная фармакология средств, влияющих на функции респираторных органов. Лекарственные средства, применяемые при бронхоспазмах, молекулярные механизмы их действия и мишени.
- 17- Молекулярная фармакология средств, влияющих на функции желудочно-кишечного тракта. Лекарственные средства, применяемые при функциональных расстройствах желудочно-кишечного тракта, молекулярные механизмы их действия и мишени.
- 18- Роль серотонина в регуляции желудочно-кишечного тракта и при воспалительных состояниях кишечника, типы 5-НТ рецепторов.
- 19- Молекулярные механизмы воспаления, ключевые медиаторы воспалительного процесса и механизмы их действия. Классификация противовоспалительных средств, провоспалительные и противовоспалительные цитокины.
- 20- Молекулярная фармакология химиотерапевтических средств, их классификация. Молекулярные механизмы действия и мишени химиотерапевтических средств, механизмы развития резистентности.

4.7. Образцы экзаменационных билетов

ЭКЗАМЕНАЦИОННЫЙ БИЛЕТ № 1

Предмет: Молекулярная фармакология

-
1. Пептидергическая система. Молекулярная фармакология наркотических анальгетиков. Молекулярные основы развития лекарственной зависимости.
 2. Роль серотонина в регуляции желудочно-кишечного тракта и при воспалительных состояниях кишечника, типы 5-НТ рецепторов.
 3. Тестовое задание N1

ЭКЗАМЕНАЦИОННЫЙ БИЛЕТ № 2
Предмет: **Молекулярная фармакология**

1. Молекулярная фармакология адренергических средств; структура, функционирование и основные принципы регуляции адренергического синапса.
2. Молекулярные механизмы воспаления, ключевые медиаторы воспалительного процесса и механизмы их действия. Классификация противовоспалительных средств, провоспалительные и противовоспалительные цитокины.
3. Тестовое задание N2

ЭКЗАМЕНАЦИОННЫЙ БИЛЕТ № 3
Предмет: **Молекулярная фармакология**

1. Молекулярная фармакология средств, влияющих на афферентную нервную систему. Местноанестезирующие средства, их классификация, физико-химические характеристики, токсичность и фармакокинетика.
2. Молекулярная фармакология кардиотонических, противоишемических и антиаритмических средств. Натрийуретическая пептидная система, вазопептидазы.
3. Тестовое задание N3

4.8. Образцы экзаменационных практических заданий

Экзаменационные тесты N 1

Заполните в таблице пропущенные данные соответственно молекулярно-фармакологическим характеристикам лекарственного средства

Лекарственное средство	Фармакологическая группа/ подгруппа	Механизм действия	Рецептор / мишень
Пилокарпин/ Pilocarpine			
Физостигмин/ Physostigmine			
Ацетилхолин/ Acetylcholine			
Эдрофоний / Edrophonium			
Гемихолиний/ Hemicholinium			

Экзаменационные тесты N 3

Заполните в таблице пропущенные данные соответственно молекулярно-фармакологическим характеристикам лекарственного средства

Лекарственное средство	Фармакологическая группа/ подгруппа	Механизм действия	Рецептор / мишень

Пропранолол / Propranolol			
Селегилин / Selegilin			
Клонидин / Clonidine			
Норадреналин /Noradrenaline			
Эфедрин / Ephedrine			

4.9. Методики решения и ответы к образцам тестовых заданий

«Казанский Государственный Медицинский Университет» Министерства Здравоохранения Российской Федерации, **Молекулярная фармакология, 2019.**



2019-1-FOS_Molphar
m.docx

5. Методический блок

5.1. Методика преподавания

5.1.1. Методические рекомендации для студентов по подготовке к семинарским, практическим или лабораторным занятиям, по организации самостоятельной работы студентов при изучении конкретной дисциплины.

Успешное изучение дисциплины требует от обучающихся посещения лекций, интерактивной работы на семинарских занятиях, выполнения всех учебных заданий преподавателя, ознакомления с базовыми учебниками, основной и дополнительной литературой. Лекции имеют в основном обзорный характер и нацелены на освещение наиболее трудных вопросов, а также призваны способствовать формированию навыков работы с научной литературой. Предполагается, что обучающиеся приходят на лекции, предварительно проработав соответствующий учебный материал по источникам, рекомендуемым программой. Основным методом обучения является самостоятельная работа студентов с учебно-методическими материалами, научной литературой, Интернет-ресурсами. Правильная организация самостоятельных учебных занятий, их систематичность, целесообразное планирование рабочего

времени позволяют обучающимся развивать умения и навыки в усвоении и систематизации приобретаемых знаний, обеспечивать высокий уровень успеваемости в период обучения, получить навыки повышения профессионального уровня. Основной формой промежуточного контроля и оценки результатов обучения по дисциплине является экзамен. Оценочные средства: Собеседование, контрольная работа, письменное тестирование, анализ ситуационных задач, рефераты и доклады.