

# ОДЕСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

Кафедра Фармацевтичної хімії  
(назва кафедри)

ЗАТВЕРДЖУЮ

Завідувач кафедри

 (Володимир ГЕЛЬМБОЛЬДТ)  
ПІБ

« 27 » серпня 2021 р.

## МЕТОДИЧНА РОЗРОБКА ПРАКТИЧНОГО ЗАНЯТТЯ

Курс II рік підготовки докторів філософії Факультет Фармацевтичний

Навчальна дисципліна Фторидні компоненти засобів лікування та профілактики карієсу

(назва навчальної дисципліни)

Практичне заняття № 8 Тема: Біологічна активність амонієвих гексафторосилікатів.

(назва теми)

Практичне заняття розробив:

Завідувач кафедри

 (Володимир ГЕЛЬМБОЛЬДТ)

підпис

ПІБ

Практичне заняття обговорено на  
методичній нараді кафедри

«27» серпня 2021 р.

Протокол № 1

## Практичне заняття № 8

**Тема:** Біологічна активність амонієвих гексафторосилікатів.

**Мета:** Узагальнити систему «структура-ефект» у складі солей гексафторосилікатів.

**Основні поняття:** фармакофорні групи; амонієві гексафторосилікати; біологічна активність.

**Обладнання:** наочний матеріал, мультимедійний проектор.

**Навчальний час:** 2 години.

### План

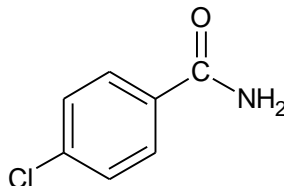
- I. Організаційний момент (привітання, перевірка присутніх, повідомлення теми, мети заняття, мотивація студентів щодо вивчення теми).
- II. Контроль опорних знань: (письмова робота, письмове тестування, фронтальне опитування тощо):
  - 2.1. Вимоги до теоретичної готовності студентів до виконання практичних занять.  
Здобувач повинен:
    - Знати: класифікацію нестероїдних протизапальних лікарських засобів, антисептичних та антибактеріальних засобів.
    - Вміти: ідентифікувати фармакофорні групи та передбачити ефект.Дидактичні одиниці: підручник; банк тестових завдань.
  - 2.2. Питання (тестові завдання, задачі, клінічні ситуації) для перевірки базових знань за темою заняття:
    1. Введення у структуру фенольного гідроксилу надає наступну біоактивність:
      - A. Антисептичної;
      - B. Снодійної;
      - C. Транквілізуючої;
      - D. Протизапальної;
      - E. Протигельмінтозної.
    2. Введення у структуру карбоксамідної групи надає наступну біоактивність:
      - A. Снодійної;
      - B. Антисептичної;
      - C. Транквілізуючої;
      - D. Протизапальної;
      - E. Антигістамінної.
    3. Введення у структуру диарил (аміноалкіл)метанової групи надає наступну біоактивність:
      - A. Антигістамінної;
      - B. Снодійної;
      - C. Транквілізуючої;

- D. Протизапальної
- E. Антисептичної.
- 4. Розгалужені алкільні замісники у присутності атомів галогенів забезпечують:
  - A. Утруднення метаболізму;
  - B. Прискорення метаболізму;
  - C. Не впливають на метаболізм;
  - D. Прискорення гідролізу;
  - E. Прискорення окиснення.
- 5. Наявність n-алкільних ланцюгів забезпечують:
  - A. Підвищення ліпофільності;
  - B. Зниження ліпофільності;
  - C. Прискорення метаболізму;
  - D. Утруднення метаболізму;
  - E. Антисептичну дію.
- 6. Циклоалкільні групи покращують зв'язуваність з біорецептором за рахунок:
  - A. Ван-дер-Ваальсових сил;
  - B. Електростатики;
  - C. Драгон`с топологічного індексу;
  - D. Ліпофільності;
  - E. Донор/акцептор Н-зв'язків.
- 7. Етери та естери змінюють полярність молекул та впливають на біодоступність шляхом:
  - A. Уповільнення біодекарбоксілювання;
  - B. Уповільнення біоокиснення;
  - C. Прискорення біодекарбоксілювання;
  - D. Прискорення біоокиснення;
  - E. Уповільнення гідролізу.
- 8. Плоскі органічні кільця мають:
  - A. Однакому фармакологічну дію;
  - B. Гетероциклічні кільця мають більш виражену фармакологічну дію;
  - C. Різну фармакологічну дію;
  - D. Карбоциклічні кільця мають більш виражену фармакологічну дію;
  - E. Не мають впливу на структуру.
- 9. Введення у структуру атому бромі придає наступну біоактивність:
  - A. Седативну;
  - B. Транквілізуючу;
  - C. Прискорюють метаболізм;
  - D. Снодійну;
  - E. Протизапальну.
- 10. Введення у структуру ізопропілової групи придає наступну біоактивність:

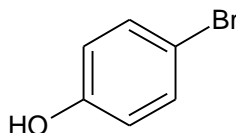
- A. Протизапальну;
- B. Аналгетичну;
- C. Снодійну;
- D. Антисептичну;
- E. Антиангінальну.

III. Формування професійних вмінь, навичок:

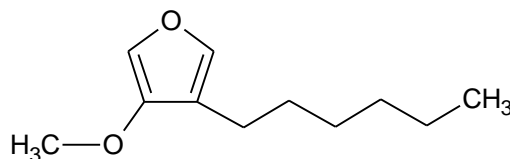
1.1. Задача 1. Виходячи з структурної формули сформулювати фармакологічні ефекти:



Задача 2. Виходячи з структурної формули сформулювати фармакологічні ефекти:



Задача 3. Виходячи з структурної формули сформулювати фармакологічні ефекти:



1.2. Рекомендації (інструкції) щодо виконання завдань:

№/№	Основні завдання	Вказівки	Відповіді
1	2	3	4
1.	Фармакофор.	Перерахувати фармакофорні групи.	Фармацевтична хімія / П.О. Безуглий, В.А. Георгіянц, І.С. Гриценко, І.В. та ін.: за ред. П.О. Безуглого. – Вінниця: Нова книга, 2017. – 456 с.

1.3. Вимоги до результатів роботи, в т.ч. до оформлення: Індивідуальний бланк відповідей на тестові завдання (бланк додається).

IV. Підведення підсумків.

У результаті заняття здобувач ознайомився фармакофорними групами та її впливом на фармакологічний ефект.

Список рекомендованої літератури

1. Державна Фармакопея України: в 3 т. / Державне підприємство «Український науковий фармакопейний центр якості лікарських засобів». — 2-е вид. — Харків: Державне підприємство «Український науковий фармакопейний центр якості лікарських засобів». — 2016.
2. Фармацевтична хімія / П.О. Безуглий, В.А. Георгіянц, І.С. Гриценко, І.В. та ін.: за ред. П.О. Безуглого. — Вінниця: Нова книга, 2017. — 456 с.
3. Фармацевтичний аналіз: Навч. посіб. для студ. вищ. фармац. навч. закл. III-IV рівнів акредитації / П.О. Безуглий, В.О. Грудько, С.Г. Леонова та ін.; За ред. П.О. Безуглого. — Х.: Вид-во НФАУ; Золоті сторінки, 2001- 240 с.
4. Лікарські засоби у стоматології: посібник / Л. Н. Максимовська, П. И. Рощина. — М.: Медицина, 2000. — 240 с.
5. Гексафторосилікати з гетероциклічними катіонами: фізико-хімічні властивості та фармакологічна активність / В. О. Гельмбольдт, В. Є. Кузьмін, В. Ю. Анісімов, О. В. Продан // Одеський медичний журнал. — 2013. - №1. — С. 6-10
6. Гельмольдт В. О. Розчинність у воді «онієвих» гексафторосилікатів з гетероциклічними катіонами – потенційних антикарієсних і біоцидних препаратів / В. О. Гельмбольдт, Л. В. Короєва // Одеський медичний журнал. — 2011. - № 6. — С. 11-13.
7. Гельмбольдт В.О., Анісімов В.Ю. Амонієві гексафторосилікати: новий тип антикарієсних агентів // Фарм. журн. — 2018. — № 5-6. — С. 48-69.
8. В.Ю. Анісімов, І.О. Шишкін, В.О. Гельмбольдт, А.П. Левицький. *Вісник фармації*. 2017, № 4(78), 75-83.
9. Gelmboldt V.O., Anisimov V.Yu., Shyshkin I.O. et al. Synthesis, crystal structures, properties and caries prevention efficiency of 2-, 3-, 4-carboxymethylpyridinium hexafluorosilicates // J. Fluor. Chem. — 2018. — V. 205, № 1. — P. 15-21.
10. Gelmboldt V.O., Anisimov V.Yu., Shyshkin I.O., Fonari M.S., Kravtsov V.Ch. Synthesis, structure, and anticaries activity of 2-amino-4,6-dihydroxypyrimidinium hexafluorosilicate // *Pharm. Chem. J.* — 2018. — V. 52, № 7. — P. 606-610. (*scopus*)
11. Gelmboldt V.O., Shyshkin I.O., Fonari M.S., Kravtsov V.Ch. Synthesis, crystal structure and some properties of 4-hydroxymethylpyridinium hexafluorosilicate // J. Struct. Chem. — 2019. — V. 60, № 7. — P. 1150-1155. (*scopus*)
12. Gelmboldt V.O., Shyshkin I.O., Anisimov V.Yu., Fonari M.S., Kravtsov V.Ch. *Bis(3-hydroxymethylpyridinium) hexafluorosilicate monohydrate as a new potential anticaries agent: Synthesis, crystal structure and pharmacological properties* // J. Fluorine Chem. — 2020. — V. 235. Article 109547. (*scopus*)
13. Шишкін І.О., Анісімов В.Ю., Гельмбольдт В.О. Деякі властивості гексафторосилікатів 3,5-дизаміщених похідних 1,2,4-триазолу // *Фармацевтичний часопис*. — 2016. — № 4. — С. 21-23.
14. Гельмбольдт В.О., Анісімов В.Ю., Шишкін І.О. Синтез октенідину

- гексафторосилікату – нового потенційного карієспрофілактичного і антибактеріального агента // *Фармацевтичний часопис*. – 2017. – № 3. – С. 13-16.
15. Шишкін І.О., Тимчишин О.Л., Гельмбольдт В.О. Гостра токсичність 4-карбоксиметилпіридинію гексафторосилікату // *Фарм. часопис*. – 2018. – № 3. – С. 80-84.
16. Приступа Б.В., Шишкін І.О., Рожковський Я.В., Гельмбольдт В.О. Оцінка протизапальної активності 2-, 3-, 4-карбоксиметилпіридинію гексафторосилікатів на каррагінановій моделі запалення // *Фарм. журнал*. – 2019. – № 4. – С. 82-87.
17. Продан О.В., Анісімов В.Ю., Кузьмін В.Є., Гельмбольдт В.О. Оцінка біологічної активності функціоналізованих піридинів і дїпіридинів як потенційних компонентів карієспротекторних агентів // *Одеський мед. журн.* – 2015. – № 3 (149). – С. 25-29.
18. Effect of ammonium hexafluorosilicate application for arresting caries treatment on demineralized primary tooth enamel / Y. Hosoya, K. Tadokore, H. Otani [et al.] // *J. Oral Science*. – 2013. – Vol. 55, № 2. – P. 115–121.
19. Ammonium hexafluorosilicate elicits calcium phosphate precipitation and shows continuous dentin tubule occlusion/ T. Suge, A. Kawasaki, K. Ishikawa [et al.] // *Dent. Mater.* – 2008. – Vol. 24, № 2. – P. 192–198.
20. V.O. Gelmboldt, V.Ch. Kravtsov, M.S. Fonari. *J. Fluorine Chem.*, 2019, 221, 91-102.
21. T. Suge, A. Kawasaki, K. Ishikawa, T. Matsuo, S. Ebisu. *Dent. Mater.* 2010, 26, 29-34.
22. T. Suge, A. Kawasaki, K. Ishikawa, T. Matsuo, S. Ebisu. *Dent. Mater.* 2008, 24, 192-198.
23. Принципові підходи до оцінки співвідношення користь/ризик при виборі лікарського засобу / О.П. Вікторов, В.І. Мальцев, Ж.А. Хоменко [та ін.] // *Сучасні проблеми токсикології*. – 2006. – №2. – С. 21-28
24. Доклінічне дослідження лікарських засобів: метод. рекомендації / під. ред. чл-кор. АМН України А.В. Стефанова. – К.: Авіценна, 2002. – 567 с.
25. Аналітична хімія кремнію / Л. В. Мишляева, В. В. Краснощеків. – М.: Наука, 1972. – 212 с.