

федеральное государственное автономное образовательное учреждение высшего
образования

**Первый Московский государственный медицинский университет им. И.М. Сеченова
Министерства здравоохранения Российской Федерации**

(Сеченовский Университет)

Институт фармации им. А.П.Нелюбина

Кафедра фармацевтической и токсикологической химии им. А.П.Арзамасцева

Методические материалы по дисциплине:

Медицинская химия

основная профессиональная образовательная программа высшего
образования - программа специалитета

33.05.01 Фармация

1. Рибозимы – это:

- А) молекулы РНК, обладающие каталитическим действием
- Б) комплексы РНК и белка, приобретающие каталитические свойства
- В) группа ферментов, катализирующих процессинг РНК
- Г) белковые компоненты рибосом

1. Ключевое свойство полимераз, используемых в ПЦР:

- А) термостабильность
- Б) термолабильность
- В) высокая точность вставки нуклеотидов
- Г) высокая скорость реакции

2. Мукополисахаридозы – группа заболеваний, связанных с нарушением протеолитического расщепления в лизосомах:

- А) гликозидаминогликанов
- Б) полисахаридов
- В) липогликанов
- Г) аминокликозидов

3. Ингибитором дигидрофолатредуктазы является:

- А) Ко-тримексазол (триметоприм)
- Б) фузидиевая кислота
- В) гентамицин
- Г) рифампицин

4. Фермент, обеспечивающий разрезание иммуноглобулина на 1 Fc и 2 Fab фрагмента:

- А) папаин
- Б) пепсин
- В) трипсин
- Г) бромелин

5. Цитохромы – это:

- А) гем-связанные белки
- Б) флуоресцентные белки
- В) белки, используемые для окрашивания клеток
- Г) хромовые тельца клетки

6. Промежуточные продукт всех (белковый, углеводный, липидный) видов обмена:

- А) Ацетил-КоА
- Б) цитрат
- В) щавелево-уксусная кислота
- Г) лактат

7. Патологический процесс в каком органе ассоциирован с повышенной активностью ЛДГ1:

- А) сердце
- Б) почки
- В) печень
- Г) поджелудочная железа

8. Фермент, являющийся основной фармакологической мишенью, участвующий в синтезе простагландинов, простацклинов и тромбосанов:

- А) циклооксигеназа
- Б) скваленэпоксидаза
- В) лакказа
- Г) супероксиддисмутаза

9. Фермент, обеспечивающий поддержание потенциала покоя и регулировку клеточного объёма:

- А) Na^+/K^+ - АТФаза
- Б) H^+/K^+ - АТФаза
- В) Ca^{2+} - АТФаза
- Г) Mg^{2+} - АТФ-аза

10. Омепразол ингибирует:

- А) H^+/K^+ - АТФаза
- Б) Na^+/K^+ - АТФаза
- В) Ca^{2+} - АТФаза
- Г) Mg^{2+} - АТФ-аза

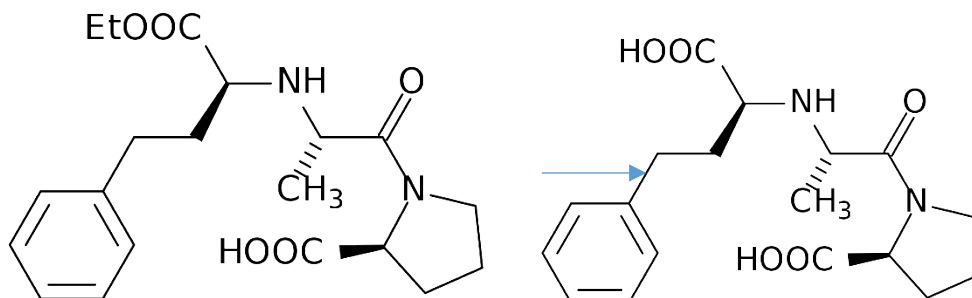
11. Недостаточная активность глюкозо-6-фосфатазы связана с болезнью:

- А) Гирке
- Б) Аддисона
- В) Крона
- Г) Конна

12. Этот фермент НЕ является антиоксидантом:

- А) пууролаза
- Б) супероксиддисмутаза
- В) пероксидаза
- Г) каталаза

13. Фермент, катализирующий превращение пролекарства Эналаприл в фармакологически активное вещество Эналаприлат:

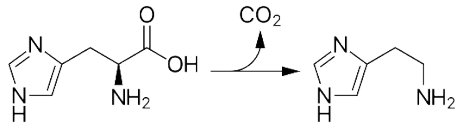


- А) карбоксиэстераза
- Б) ацетилаза
- В) хеликаза
- Г) каталаза

14. Ренин гидролизует:

- А) пептидную связь
- Б) сложноэфирную связь
- В) дисульфидную связь
- Г) углерод-углеродную связь

15. Гистидиндекарбоксилаза относится к:



- А) Лиазам
- Б) Гидролазам
- В) Трансферазам
- Г) Оксидоредуктазам

16. ФОВ ингибируют ацетилхолинэстеразу:

- А) необратимо, полностью
- Б) необратимо, частично
- В) обратимо, полностью
- Г) обратимо, частично

17. Экзонуклеазы:

- А) катализируют отщепление терминальных мононуклетидов
- Б) катализируют разрыв фосфодиэфирных связей в середине полинуклеотидной цепи
- В) катализируют окисление нуклеотидов
- Г) катализируют разрыв водородных связей между двумя цепями полинуклеотидов

18. Кофермент метилтрансфераз является производным:

- А) метионина
- Б) цистеина
- В) изолейцина
- Г) аланина

19. Процессинг проинсулина в инсулин обеспечивают:

- А) эндопептидазы
- Б) энтеропептидазы
- В) сериновые протеазы
- Г) цистеиновые пептидазы

20. Гепарин – это:

- А) прямой антикоагулянт
- Б) антиагрегант
- В) Тромболитик
- Г) Антагонист витамина К

21. Ионы этого металла НЕ являются коферментами белков человека:

- А) алюминий
- Б) селен
- В) молибден

Г) магний

22. По механизму действия зидовудин является:

- А) ингибитором обратной транскриптазы
- Б) ингибитором нейраминидазы
- В) ингибитором протеазы
- Г) ингибитором нейраминидазы

23. Адреналин является активатором:

- А) ТАГ-липазы
- Б) фосфолипазы С
- В) липопротеинлипазы
- Г) холестеролэстеразы

24. Серотонин – продукт метаболизма:

- А) триптофана
- Б) тирозина
- В) треонина
- Г) триметоприма

25. Акцептором аминогрупп в реакциях трансаминирования аминокислот являются:

- А) Альфа-кетоглутарат
- Б) Аргининосукцинат
- В) Лактат
- Г) Цитруллин

26. Недостаточность этого фермента приводит к гипераммониемии:

- А) карбамоилфосфатсинтетаза
- Б) орнитинтранскарбамойлаза
- В) аргининсукцинат-синтетаза
- Г) аргининогидролаза

27. Диета является ключевым фактором лечения этой ферментопатии:

- А) фенилкетонурия
- Б) алкаптонурия
- В) болезнь Тея-Сакса
- Г) болезнь Нимана-Пака

28. Ураты это продукты метаболизма:

- А) пуринов
- Б) пиримидинов
- В) гема
- Г) белков

29. Ингибитор фосфодиэстеразы:

- А) винпоцетин
 - Б) индапамид
 - В) холерный токсин
 - Г) шига-токсин
-

1. Сродство налтрексона к опиоидным рецепторам характеризуется соотношением:

- А) $\mu > \kappa > \delta$
- Б) $\mu > \delta > \kappa$
- В) $\delta > \mu > \kappa$
- Г) $\kappa > \mu > \delta$

2. Арипипразол по отношению к дофаминовым рецепторам:

- А) агонист-антагонист
- Б) агонист
- В) необратимый антагонист
- Г) обратимый антагонист

3. Метоклопрамид тормозит деятельность:

- А) 5НТ-3 рецепторов
- Б) 5НТ-2 рецепторов
- В) 5НТ-1 рецепторов
- Г) 5НТ-4 рецепторов

4. Эта аминокислота НЕ является нейромедиатором:

- А) гистидин
- Б) глицин
- В) глутаминовая кислота
- Г) гамма-аминомасляная кислота

5. Ионотропным рецептором является:

- А) глициновый
- Б) секретинный
- В) дофаминовый
- Г) каннабиноидный

6. G-белок – связанный рецептор:

- А) цАМФ
- Б) ГАМК
- В) НМДА
- Д) никотиновый

7. Сигнальный путь андрогенового рецептора предполагает:

- А) проникновение в ядро с последующим изменением экспрессии зависимых генов
- Б) процессинг сигнальных молекул, изменяющих экспрессию генов
- В) перевод тестостерона в метаболически неактивную форму
- Г) дефосфорелирование аденилат-циклазы

8. Используют вторичный посредник цАМФ для распространения сигнала:

- А) глюкагон
- Б) соматотропин
- В) пролактин
- Г) трийодтиронин

9. Блокатор α-адренорецепторов, используемый в терапии гиперплазии предстательной железы:

- А) тамсулозин
- Б) эрготамин
- В) ницерголин
- Г) пророксан

10. Механизм ингибирования биосинтеза холестерина путём отрицательной обратной связи:

- А) холестерол блокирует протеазу, активирующую транскрипционный фактор этой кассеты генов
- Б) сквален ингибирует 24-дегидрохолестерол редуктазу
- В) ацетил-КоА ингибирует фосфорилирование скваленэпоксидазы, что останавливает её активность
- Г) Ланостерин ингибирует ГМГ-КоА-редуктазу

11. Примером положительной обратной связи может служить:

- А) гиперцитокинемия
- Б) регуляция активности треонин-дегидратазы
- В) взаимодействие УТФ и карбамоилфосфатсинтетазы
- Г) взаимодействие глицеральдегидфосфатазы и глюкозо-6-фосфата

12. Группа рецепторов, НЕ участвующих в антигенпрезентации:

- А) ADAR
- Б) TLR
- В) CD
- Г) MHC

13. Цитокины по своей химической природе являются:

- А) пептиды
- Б) производные аминокислот
- В) липополисахариды
- Г) гликопротеины

14. К механизмам действия интерферонов НЕ относится:

- А) образование тетрамерного комплекса с толл-подобными рецепторами
- Б) регуляция экспрессии интерферон-стимулируемых генов
- В) активация иммунопротеасомы
- Г) презентация антигенов вирусом Т-лимфоцитам

15. ВИЧ поражает клетки:

- А) CD4+
- Б) CD8+
- В) CD8-
- Г) CD4-

16. Тормозящий эффект ГАМК НЕ связан с:

- А) повышением проницаемости постсинаптической мембраны для Na
- Б) повышением проницаемости постсинаптической мембраны для K
- В) повышением проницаемости постсинаптической мембраны для Ca
- Г) повышением проницаемости постсинаптической мембраны для Cl

17. Ионотропный подтип серотониновых рецепторов:

- А) 5-НТ3
- Б) 5-НТ2
- В) 5-НТ1
- Г) 5-НТ4

18. Поступление NO в клетку сопровождается:

- А) повышением уровня цГМФ
- Б) повышением уровня цАМФ
- В) понижением уровня цАМФ
- Г) повышением уровня инозитол-3-фосфата

19. Подтип дофаминовых рецепторов, активирующий аденилатциклазу:

- А) D1
- Б) D2
- В) D3
- Г) D4

20. Барбитураты и бензодиазепины связываются с:

- А) ГАМК-а рецептор
- Б) ГАМК-в рецептор
- В) ГАМК-с рецептор
- Г) глициновым рецептор

21. По отношению к гонадолиберину рецептору гозерелин является:

- А) суперагонистом
- Б) полным агонистом
- В) агонистом-антагонистом
- Г) антагонистом

22. Изадрин по отношению к бета-адренорецепторам:

- А) полный агонист
- Б) суперагонист
- В) частичный агонист
- Г) агонист-антагонист

23. Бупренорфин по отношению к мю-опиоидным рецепторам является:

- А) частичным агонистом
- Б) полным агонистом
- В) суперагонистом
- Г) агонистом-антагонистом

24. Основной мишенью энкефалина являются:

- А) μ , δ
- Б) μ , κ
- В) δ , κ
- Г) μ , δ , κ

25. Бета3-адренорецепторы локализованы в:

- А) жировой ткани
- Б) сердце
- В) лёгких
- Г) артериолах

26. Мемантин по отношению к НМДА-рецепторам является:

- А) неконкурентным антагонистом
- Б) конкурентным антагонистом
- В) агонистом-антагонистом
- Г) частичным агонистом

27. Необратимым ингибитором моноаминоксидазы является:

- А) селегилин
- Б) пирлиндол
- В) моклобемид
- Г) гармалин

28. НЕ является ядерным рецептором:

- А) каннабиноидный
- Б) тиреоидный
- В) андрогенный
- Г) прогестероновый

29. Рецептор вазопрессина:

- А) ионотропный
- Б) G-белок – связанный

30. Какое свойство больше прочих влияет на проницаемость молекулы через ГЭБ?

- А) липофильность
- Б) наличие кислотных центров
- В) гидрофильность
- Г) способность к диссоциации

Нуклеиновые кислоты. Рациональные подходы к созданию интеркалирующих и алкилирующих агентов, их механизм действия. Вещества, действующие на генетический аппарат.

1. Буквенный код «N» означает, что в данной позиции находится нуклеотид:

- А. А или Т или G или С
- Б. А или Т или С
- В. А или Т
- Г. G или С

2. Специфично ли алкилирование ДНК с помощью алкилирующих антинеопластических препаратов? Если да, то по какому сайту?

- А. Специфично, 7 атом азота пуринового кольца гуанина
- Б. Специфично, 7 атом азота пуринового кольца аденина
- В. Специфично, 1 атом азота пиримидинового кольца цитозина
- Г. Неспецифично

3. На один виток спирали ДНК приходится:

- А. 10 нуклеотидов
- Б. 5 нуклетидов
- В. 3 нуклеотида
- Г. 12 нуклеотидов

4. Структурной единицей ДНК и РНК являются:

- А. нуклеотиды
- Б. нуклеозиды
- В. Нуклеосомы
- Г. Нуклеид

5. Неизбежный побочный эффект применения алкилирующих ДНК препаратов:

- А. алопеция
- Б. ихтиоз
- В. Гирсутизм
- Г. Муковисцидоз

6. Интеркалирующий агент, широко применяемый в лабораторных исследованиях нуклеиновых кислот:

- А. бромистый этидий
- Б. Афлатоксин В-1
- В. Адриамицин
- Г. Метилртуть

7. Индикатор, применяемый в фармацевтической химии, обладающий интеркалирующими свойствами:

- А. метиленовый синий
- Б. метиленовый красный
- В. Тропеолин 00
- Г. Хром тёмно-синий

8. Наиболее часто используемый металл в синтезе металлоорганических интеркаляторов ДНК:

- А. рутений
- Б. рубидий
- В. Технеций
- Г. Молибден

9. Цитостатическое средство алкилирующего действия:

- А. циклофосфамид
- Б. доксорубицин
- В. Винкристин
- Г. Паклитаксел

10. Цитостатическое средство интеркалирующего действия:

- А. доксорубицин
- Б. циклофосфамид
- В. Винкристин
- Г. Паклитаксел

11. Промутаген – это:

- А. вещество, не обладающее мутагенной активностью, метаболизируемое в мутаген
- Б. вещество, приобретающее мутагенные свойства при накоплении в организме человека
- В. Вещество, индуцирующее мутагенез не напрямую
- Г. Метаболит мутагена, не обладающий мутагенными свойствами

12. Механизмом антинеопластической резистентности является:

- А. повышенный уровень репарации ДНК
- Б. повышенный аэробный метаболизм
- В. Накопление протеолитических телец
- Г. РНК-интерференция

13. Механизмом антинеопластической резистентности является:

- А. нарушения апоптоза
- Б. нарушение образования веретена деления
- В. Гиперэкспрессия процессинговых белков
- Г. Образование плотных межклеточных контактов

14. В какой стадии жизненного цикла клетки действуют препараты платины:

- А. G0
- Б. G1
- В. G2
- Г. S

15. Особенным свойством производных нитрозомочевины является:

- А. проникают через ГЭБ
- Б. не выводятся через дыхательные пути
- В. Вызывают повышение артериального давления
- Г. Связаны с облитерирующим эндоартеритом

16. Миелосан:

- А. алкилирующее средство
- Б. антиметаболит
- В. Цитотоксический препарат
- Г. Интеркалирующий агент

17. К алкилирующим средствам не относятся:

- А. адриамицин, фторафур
- Б. адриамицин, сарколизин
- В. Хлорбутин, фторафур
- Г. Сарколизин, хлорбутин

18. Алкилирующие антинеопластические агенты, требующие для своего действия внутриклеточной активации:

- А. оксазафосфорины
- Б. производные бис-бетахлорэтиламина
- В. Алкилсульфонаты
- Г. Препараты платины

19. Механизм действия эстрамустина:

- А. ингибирование образования микротрубочек
- Б. алкилирование ДНК
- Г. Нарушение образования комплексов ДНК-белок
- В. Образование тетрамеров ДНК

20. Процесс внутрипочечного бондинга связан с применением:

- А. алкилирующих препаратов
 - Б. интеркалирующих препаратов
 - В. Аналогов нуклеотидов
 - Г. Цитотоксических препаратов
-

Структурные особенности различных химических соединений. Взаимосвязь структуры вещества и его биологической активности.

1. Поиск количественных соотношений структура – свойство:

- А. QSAR
- Б. TBLASTN
- В. Pymol
- Г. Coot

2. Методы изучения структурно-активных отношений:

- А. регрессионные модели
- Б. индуктивные модели
- В. Пространственные модели
- Г. Инверсионные модели

3. Методы изучения структурно-активных отношений:

- А. фармакофорные модели
- Б. аффинажные модели
- В. Стереохимические модели
- Г. Гносеологические модели

4. Методы изучения структурно-активных отношений:

- А. CoMFA
- Б. Culombic
- В. CCP4
- Г. Sybyl-X

5. Помимо фармакофорной(ых) группировки(ок), препарат для эффективной переноски к соответствующим системам организма должен содержать:

- А. липофильные и\или гидрофильные группировки
- Б. ароматические структуры
- В. Кислотные и\или основные группировки
- Г. Протогенность и\или протофильность

6. У этого вещества нет токсичного энантиомера:

- А. аскорбиновая кислота
- Б. ибупрофен
- В. Тироксин
- Г. Талидомид

7. Энантиомеры нельзя разделить:

- А. фотоэлектроколориметрией
- Б. хроматографией
- В. Механическим расщеплением
- Г. Ферментативным расщеплением

8. Наименьшую долю на современном фармацевтическом рынке имеют:

- А. индивидуальные стереомеры
- Б. рацемические смеси
- В. Диастереомеры
- Г. Оптически неактивные препараты

9. Растворимость препарата не оказывает значительно влияние на:

- А. биотрансформацию
- Б. всасывание
- В. Фильтрацию
- Г. Диффузию

10. С точки зрения гидрофильности, наименее активной группой является:

- А. имидогруппа
- Б. амидогруппа
- В. Иминогруппа
- Г. Аминогруппа

11. С точки зрения гидрофильности, наиболее активной группой является:

- А. карбоксильная
- Б. гидроксильная
- В. Альдегидная
- Г. Кетогруппа

12. С точки зрения гидрофобности, наиболее активной структурой является:

- А. фенильная
- Б. пентильная
- В. Бутильная
- Г. неопентильная

13. С точки зрения гидрофобности, наименее активной структурой является:

- А. метильная
- Б. метиленовая
- В. Этильная
- Г. Этиленовая

14. Логарифмический коэффициент распределения ЛВ в системе октанол-вода – характеристика:
- А. гидрофобности
 - Б. гидрофильности
 - В. Липофобности
 - Г. Липофильности
15. В ряду молекул $XN(R)_2$, больше всего способствует проникновению через ГЭБ R:
- А. C_2H_5
 - Б. CH_3
 - В. CHO
 - Г. $COOH$
16. Выберите наиболее токсичное соединение:
- А. $CH_2ClCHClCH_2Cl$
 - Б. $CH_2OHCHClCH_2Cl$
 - В. $CH_2ClCHONCH_2Cl$
 - Г. $CH_2OHCHClCH_2OH$
17. Выберите наиболее токсичное соединение:
- А. CH_3Cl
 - Б. CH_2Cl_2
 - В. CCl_4
 - Г. $CHCl_3$
18. При введении этой группировки как правило наблюдается понижение кровяного давления:
- А. алифатическая нитритная
 - Б. ароматическая нитритная
 - В. Алифатическая нитрильная
 - Г. Ароматическая нитрильная
19. Курареподобные свойства веществу придаёт:
- А. четвертичный атом азота
 - Б. третичный атом азота
 - В. Вторичный атом азота
 - Г. Первичный атом азота
20. В ряду соединений: фенол, морфин, анилин введение карбоксильной\сернистой группировки приведёт к:
- А. снижению биологической активности
 - Б. потенцированию биологической активности
 - В. Потере биологической активности
 - Г. Изменению биологической активности.

Методы модификации различных химических соединений, используемые в разработке лекарственных средств.

1. Если цель модификации – повышение растворимости ЛП в воде, не учитывается:

- А. характер образуемых связей вода-молекула
- Б. тип группы
- В. Обратимость введения группировки
- Г. Участок модификации

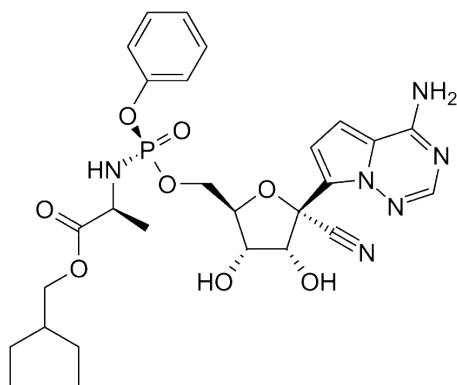
2. Метилирование морфина приводит к:

- А. снижению анальгезирующего эффекта, усилению противокашлевых свойств
- Б. повышению анальгезирующего эффекта, снижению противокашлевых свойств
- В. Приобретению противокашлевых свойств
- Г. Потере анальгезирующего свойства

3. Метилирование катехоламин приводит к:

- А. снижению биологической активности
- Б. повышению биологической активности

4. Исходя из структуры молекулы, предположите, аналогом какого нуклеотида является данное вещество:



- А. аденина
- Б. гуанина
- В. Тимина
- Г. Цитозина

5. Повышение стабильности терапевтических пептидов достигается:

- А. пегилированием
- Б. фосфорилированием
- В. СУМОирования
- Г. Гликозилированием

6. Снижение иммуногенности терапевтических пептидов достигается путём:

- А. пегилирования
- Б. образования альтернативной конформации пептида
- В. Модификации гидрофильных остатков аминокислот
- Г. Убиквитинирования

7. Метилдофа – синтетическое метилированное производное L-ДОФА, предшественника дофамина, обладает следующим фармакологическими свойством:

- А. гипотензивное
- Б. нормотимическое
- В. Антипсихотическое
- Г. Стимулирующее

8. Химическая модификация лекарственных веществ представляет собой:

- А. использование лекарственных веществ в виде различных солей, кислот, оснований
- Б. степень измельчения
- В. растворимость в различных растворителях
- Г. аморфность или кристалличность, форма кристаллов

9. Изучением влияния физико-химической модификации лекарственных веществ на их биодоступность занимается наука:

- А. биофармация
- Б. фармакология
- В. Фармацевтическая технология
- Г. Фармацевтическая химия

10. Параметр полярности молекулы, отражающий её способность пересечь билипидный слой или ГЭБ

- А. PSA
- Б. BSA
- В. MSA
- Г. DSA

11. Избежать гидроксирования препарата под действием P450 цитохрома печени можно достичь путём замены водородов в ароматической структуре на:

- А. фтор
- Б. хлор
- В. бром
- Г. Йод

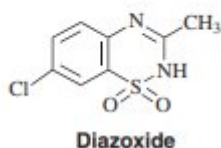
12. Ауксофор – это:

- А. часть молекулы, обеспечивающая её структурные, но не фармакологические свойства
- Б. неметаболизируемое фармакологически активное соединение
- В. Фармакологически активное соединение, обладающее различными путями метаболизма
- Г. Часть молекулы, обеспечивающая её вторичные фармакологические эффекты

13. Фармакофор – это:

- А. фармакологически активная часть молекулы
- Б. неметаболизируемое фармакологически активное соединение
- В. Фармакологически активное соединение, обладающее разными терапевтическими свойствами
- Г. Часть молекулы, обеспечивающая её вторичные фармакологические эффекты

14. Если правая молекула обладает диуретическими свойствами, то левая обладает свойствами:



- А. вазодилатирующими
- Б. антимикробными
- В. Диуретическими
- Г. Антиангинальными

15. В ряду производных тиазида и фенотиазина встречаются молекулы с галогензаместителями в ароматических кольцах. Данная модификация способствует:

- А. повышению аффинитета препарата к мишени
- Б. снижению токсических свойств
- В. Улучшению растворимости препарата
- Г. Повышению почечной экскреции препарата

16. Введение в структуру молекулы алкильного фрагмента как правило повышает её липофильность. Однако, если его длина ≥ 12 , это может привести к снижению его эффективности. В первую очередь, это связано с:

- А. нарушением образования мицеллярных сольватов молекулы
- Б. избыточная липофильность препарата приводит к его «застреванию» в мембранах
- В. Нарушение всасываемости препарата
- Г. Нарушение распределения электронной плотности на поверхности молекулы

17. Токсикофор – это:

- А. часть молекулы, связанная с её токсическими свойствами
- Б. неметаболизируемое фармакологически активное соединение
- В. Фармакологически активное соединение, обладающее разными терапевтическими свойствами
- Г. Часть молекулы, обеспечивающая её вторичные фармакологические эффекты

18. Группировка, как правило обладающая свойствами токсикофора:

- А. эпоксидная
- Б. фенильная
- В. Карбоксильная
- Г. Этильная

19. Наибольшей липофильностью среди алкильных группировок обладают:

- А. неразветвленные группировки
- Б. разветвлённые группировки
- В. Циклические алкильные группировки

Дизайн лекарственных веществ на примере различных фармакологических групп.

1. Типичный набор стадий в современном драг дизайне:

- А. выбор мишени – создание ведущей структуры – модификации ведущей структуры – доклинические исследования – клинические исследования – регистрация
- Б. создание ведущей структуры – модификации ведущей структуры – выбор мишени – доклинические исследования – клинические исследования – регистрация
- В. выбор мишени – регистрация – создание ведущей структуры – модификации ведущей структуры – доклинические исследования – клинические исследования
- Г. создание ведущей структуры – выбор мишени– модификации ведущей структуры – доклинические исследования – клинические исследования – регистрация

2. Показателем выбора хорошей ведущей структуры не является:

- А. токсичность
- Б. взаимодействие с мишенью с желаемым эффектом
- В. Легкая модифицируемость
- Г. Достигает мишени

3. ADME – это:

- А. адсорбция, распределение, метаболизм, выведение
- Б. аденозиддиметилэпоксид
- В. Среда разработки ведущей структуры
- Г. Адсорбция, деструкция, метаболизм, элиминация

4. Процесс спонтанного сворачивания полипептидной цепи в трёхмерную структуру:

- А. фолдинг
- Б. докинг
- В. Процессинг
- Г. Посттрансляционная модификация

5. Метод моделирования, предсказывающий наиболее стабильную ориентацию лиганда в структуре целевого белка:

- А. докинг
- Б. фолдинг
- В. Процессинг
- Г. Посттрансляционная модификация

6. Целью для лекарственного препарата может быть:

- А. всё верно
- Б. белок
- В. ДНК
- Г. РНК

7. Слепой скрининг ведущей структуры как правило ведётся:

- А. In silico
- Б. In vivo
- В. In vitro

8. Метод, не используемый в тестах фармакокинетики-фармакодинамики:

- А. NMR
- Б. микродиализ
- В. PET

Г. MRS

9. В качестве радиометки при изучении распределения и связывания психоактивных препаратов как правило используется:

- А. ^{11}C
- Б. ^{18}F
- В. ^{31}S
- Г. ^{55}I

10. Оценка алгоритмов докинга не идёт по параметру:

- А. разрешение докинга
- Б. точность докинга
- В. Фактор обогащения
- Г. Сопоставительный анализ

11. Цисплатин состоит всего из 11 атомов, однако, спектр его фармакологических и побочных эффектов крайне широк. Это связано с его:

- А. низкой специфичностью
- Б. высокой токсичностью
- В. Высокой биодоступностью
- Г. Высокой реакционной способностью

12. Не является методом установления структуры макромолекулы-мишени:

- А. нефелометрия
- Б. рентгеноструктурный анализ
- В. ЯМР
- Г. Молекулярное моделирование

13. В случае если препарат плохо проникает внутрь клетки для достижения мишени, адекватной стратегией является:

- А. создание препарата, взаимодействующего с G-белок опосредованных передатчиком, регулирующим деятельность мишени
- Б. модификация препарата для увеличения его липофильности
- В. Выбор альтернативной мишени
- Г. Изменение фармакофора препарата

14. Антигистаминные препараты 2го поколения, по сравнению с первым, не обладают седативным эффектом. Это было достигнуто за счёт:

- А. уменьшения липофильности препаратов
- Б. повышению афинности препаратов к серотониновым рецепторам
- В. Увеличению липофильности препаратов
- Г. Снижению афинности препаратов к адренорецепторам рецепторам

15. H₂-блокаторы 3 поколения по сравнению с первым имеют следующие свойства:

- А. всё верно
- Б. сниженная токсичность по отношению к ЦНС
- В. Повышенная активность
- Г. Повышенное время действия

16. Классические тесты фармакокинетики-фармадинамики не подходят для данной группы препаратов:

- А. генотерапевтические вирусные вектора
- Б. иммунизирующие сыворотки
- В. Препараты без резорбтивного действия
- Г. Интерфероны

17. Упрощение молекулы X позволило получить более активное лекарственное средство:

- А. лоратадин
- Б. хинин
- В. Таксол
- Г. Пиретрин

18. Один из случаев модификации лекарственных препаратов направленный на снижение его аффинности к биологической мишени:

- А. цефалоспорины
- Б. макролиды
- В. Антифолаты
- Г. Сульфаниламиды

19. Модификация морфина, основа для разработки антагонистов опиоидных рецепторов:

- А. тебаин
- Б. папаин
- В. Бромелин
- Г. Папаверин

20. Хиральная молекула при взаимодействии с рецептором ориентируется по:

- А. 3 точкам
- Б. 4 точкам
- В. 2 точкам
- Г. 1 точке

Нуклеиновые кислоты. Рациональные подходы к созданию интеркалирующих и алкилирующих агентов, их механизм действия. Вещества, действующие на генетический аппарат.

21. Буквенный код «N» означает, что в данной позиции находится нуклеотид:

- А. А или Т или G или С
- Б. А или Т или С
- В. А или Т
- Г. G или С

22. Специфично ли алкилирование ДНК с помощью алкилирующих антинеопластических препаратов? Если да, то по какому сайту?

- А. Специфично, 7 атом азота пуринового кольца гуанина
- Б. Специфично, 7 атом азота пуринового кольца аденина
- В. Специфично, 1 атом азота пиримидинового кольца цитозина
- Г. Неспецифично

23. На один виток спирали ДНК приходится:

- А. 10 нуклеотидов
- Б. 5 нуклетидов

- В. 3 нуклеотида
- Г. 12 нуклеотидов

24. Структурной единицей ДНК и РНК являются:

- А. нуклеотиды
- Б. нуклеозиды
- В. Нуклеосомы
- Г. Нуклеид

25. Неизбежный побочный эффект применения алкилирующих ДНК препаратов:

- А. алоpecia
- Б. ихтиоз
- В. Гирсутизм
- Г. Муковисцидоз

26. Интеркалирующий агент, широко применяемый в лабораторных исследованиях нуклеиновых кислот:

- А. бромистый этидий
- Б. Афлатоксин В-1
- В. Адриамицин
- Г. Метилртуть

27. Индикатор, применяемый в фармацевтической химии, обладающий интеркалирующими свойствами:

- А. метиленовый синий
- Б. метиленовый красный
- В. Тропеолин 00
- Г. Хром тёмно-синий

28. Наиболее часто используемый металл в синтезе металлоорганических интеркаляторов ДНК:

- А. рутений
- Б. рубидий
- В. Технеций
- Г. Молибден

29. Цитостатическое средство алкилирующего действия:

- А. циклофосфамид
- Б. доксорубицин
- В. Винкристин
- Г. Паклитаксел

30. Цитостатическое средство интеркалирующего действия:

- А. доксорубицин
- Б. циклофосфамид
- В. Винкристин
- Г. Паклитаксел

31. Промутаген – это:

- А. вещество, не обладающее мутагенной активностью, метаболизируемое в мутаген
- Б. вещество, приобретающее мутагенные свойства при накоплении в организме человека
- В. Вещество, индуцирующее мутагенез не напрямую
- Г. Метаболит мутагена, не обладающий мутагенными свойствами

32. Механизмом антинеопластической резистентности является:

- А. повышенный уровень репарации ДНК
- Б. повышенный аэробный метаболизм
- В. Накопление протеолитических телец
- Г. РНК-интерференция

33. Механизмом антинеопластической резистентности является:

- А. нарушения апоптоза
- Б. нарушение образования веретена деления
- В. Гиперэкспрессия процессинговых белков
- Г. Образование плотных межклеточных контактов

34. В какой стадии жизненного цикла клетки действуют препараты платины:

- А. G0
- Б. G1
- В. G2
- Г. S

35. Особенным свойством производных нитрозомочевины является:

- А. проникают через ГЭБ
- Б. не выводятся через дыхательные пути
- В. Вызывают повышение артериального давления
- Г. Связаны с облитерирующим эндоартеритом

36. Миелосан:

- А. алкилирующее средство
- Б. антиметаболит
- В. Цитотоксический препарат
- Г. Интеркалирующий агент

37. К алкилирующим средствам не относятся:

- А. адриамицин, фторафур
- Б. адриамицин, сарколизин
- В. Хлорбутин, фторафур
- Г. Сарколизин, хлорбутин

38. Алкилирующие антинеопластические агенты, требующие для своего действия внутриклеточной активации:

- А. оксазафосфорины
- Б. производные бис-бетахлорэтиламина
- В. Алкилсульфонаты
- Г. Препараты платины

39. Механизм действия эстрамустина:

- А. ингибирование образования микротрубочек

- Б. алкилирование ДНК
- Г. Нарушение образования комплексов ДНК-белок
- В. Образование тетрамеров ДНК

40. Процесс внутрицепочечного бондинга связан с применением:

- А. алкилирующих препаратов
 - Б. интеркалирующих препаратов
 - В. Аналогов нуклеотидов
 - Г. Цитотоксических препаратов
-

Структурные особенности различных химических соединений. Взаимосвязь структуры вещества и его биологической активности.

21. Поиск количественных соотношений структура – свойство:

- А. QSAR
- Б. TBLASTN
- В. Pymol
- Г. Coot

22. Методы изучения структурно-активных отношений:

- А. регрессионные модели
- Б. индуктивные модели
- В. Пространственные модели
- Г. Инверсионные модели

23. Методы изучения структурно-активных отношений:

- А. фармакофорные модели
- Б. аффинажные модели
- В. Стереохимические модели
- Г. Гносеологические модели

24. Методы изучения структурно-активных отношений:

- А. CoMFA
- Б. Culombic
- В. CCP4
- Г. Sybyl-X

25. Помимо фармакофорной(ых) группировки(ок), препарат для эффективной переноски к соответствующим системам организма должен содержать:

- А. липофильные и\или гидрофильные группировки
- Б. ароматические структуры
- В. Кислотные и\или основные группировки
- Г. Протогенность и\или протофильность

26. У этого вещества нет токсичного энантиомера:

- А. аскорбиновая кислота
- Б. ибупрофен

- В. Тироксин
- Г. Талидомид

27. Энантиомеры нельзя разделить:

- А. фотоэлектроколориметрией
- Б. хроматографией
- В. Механическим расщеплением
- Г. Ферментативным расщеплением

28. Наименьшую долю на современном фармацевтическом рынке имеют:

- А. индивидуальные стереомеры
- Б. рацемические смеси
- В. Диастереомеры
- Г. Оптически неактивные препараты

29. Растворимость препарата не оказывает значительное влияние на:

- А. биотрансформацию
- Б. всасывание
- В. Фильтрацию
- Г. Диффузию

30. С точки зрения гидрофильности, наименее активной группой является:

- А. имидогруппа
- Б. амидогруппа
- В. Иминогруппа
- Г. Аминогруппа

31. С точки зрения гидрофильности, наиболее активной группой является:

- А. карбоксильная
- Б. гидроксильная
- В. Альдегидная
- Г. Кетогруппа

32. С точки зрения гидрофобности, наиболее активной структурой является:

- А. фенильная
- Б. пентильная
- В. Бутильная
- Г. неопентильная

33. С точки зрения гидрофобности, наименее активной структурой является:

- А. метильная
- Б. метиленовая
- В. Этильная
- Г. Этиленовая

34. Логарифмический коэффициент распределения ЛВ в системе октанол-вода – характеристика:

- А. гидрофобности
- Б. гидрофильности
- В. Липофобности
- Г. Липофильности

35. В ряду молекул $XN(R)_2$, больше всего способствует проникновению через ГЭБ R:

- А. C_2H_5
- Б. CH_3
- В. CHO
- Г. $COOH$

36. Выберите наиболее токсичное соединение:

- А. $CH_2ClCHClCH_2Cl$
- Б. $CH_2OHCHClCH_2Cl$
- В. $CH_2ClCHONCH_2Cl$
- Г. $CH_2OHCHClCH_2OH$

37. Выберите наиболее токсичное соединение:

- А. CH_3Cl
- Б. CH_2Cl_2
- В. CCl_4
- Г. $CHCl_3$

38. При введении этой группировки как правило наблюдается понижение кровяного давления:

- А. алифатическая нитритная
- Б. ароматическая нитритная
- В. Алифатическая нитрильная
- Г. Ароматическая нитрильная

39. Курареподобные свойства веществу придаёт:

- А. четвертичный атом азота
- Б. третичный атом азота
- В. Вторичный атом азота
- Г. Первичный атом азота

40. В ряду соединений: фенол, морфин, анилин введение карбоксильной\сернистой группировки приведёт к:

- А. снижению биологической активности
- Б. потенцированию биологической активности
- В. Потере биологической активности
- Г. Изменению биологической активности.

Методы модификации различных химических соединений, используемые в разработке лекарственных средств.

20. Если цель модификации – повышение растворимости ЛП в воде, не учитывается:

- А. характер образуемых связей вода-молекула
- Б. тип группы
- В. Обратимость введения группировки
- Г. Участок модификации

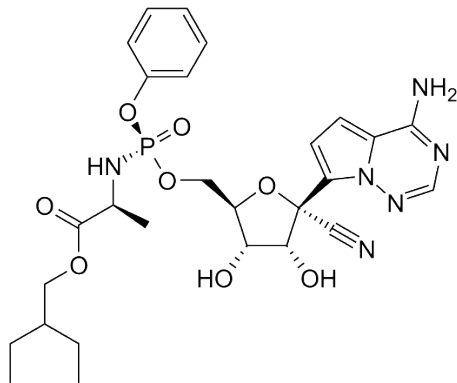
21. Метилирование морфина приводит к:

- А. снижению анальгезирующего эффекта, усилению противокашлевых свойств
- Б. повышению анальгезирующего эффекта, снижению противокашлевых свойств
- В. Приобретению противокашлевых свойств
- Г. Потере анальгезирующего свойства

22. Метилирование катехоламин приводит к:

- А. снижению биологической активности
- Б. повышению биологической активности

23. Исходя из структуры молекулы, предположите, аналогом какого нуклеотида является данное вещество:



- А. аденина
- Б. гуанина
- В. Тимина
- Г. Цитозина

24. Повышение стабильности терапевтических пептидов достигается:

- А. пегилированием
- Б. фосфорилированием
- В. СУМОирования
- Г. Гликозилированием

25. Снижение иммуногенности терапевтических пептидов достигается путём:

- А. пегилирования
- Б. образования альтернативной конформации пептида
- В. Модификации гидрофильных остатков аминокислот
- Г. Убиквитинирования

26. Метилдофа – синтетическое метилированное производное L-ДОФА, предшественника дофамина, обладает следующим фармакологическими свойством:

- А. гипотензивное
- Б. нормотимическое

В. Антипсихотическое

Г. Стимулирующее

27. Химическая модификация лекарственных веществ представляет собой:

А. использование лекарственных веществ в виде различных солей, кислот, оснований

Б. степень измельчения

В. растворимость в различных растворителях

Г. аморфность или кристалличность, форма кристаллов

28. Изучением влияния физико-химической модификации лекарственных веществ на их биодоступность занимается наука:

А. биофармация

Б. фармакология

В. Фармацевтическая технология

Г. Фармацевтическая химия

29. Параметр полярности молекулы, отражающий её способность пересечь билипидный слой или ГЭБ

А. PSA

Б. BSA

В. MSA

Г. DSA

30. Избежать гидроксирования препарата под действием P450 цитохрома печени можно достичь путём замены водородов в ароматической структуре на:

А. фтор

Б. хлор

В. бром

Г. Йод

31. Ауксофор – это:

А. часть молекулы, обеспечивающая её структурные, но не фармакологические свойства

Б. неметаболизируемое фармакологически активное соединение

В. Фармакологически активное соединение, обладающее различными путями метаболизма

Г. Часть молекулы, обеспечивающая её вторичные фармакологические эффекты

32. Фармакофор – это:

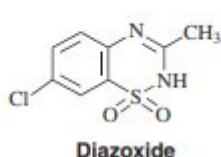
А. фармакологически активная часть молекулы

Б. неметаболизируемое фармакологически активное соединение

В. Фармакологически активное соединение, обладающее разными терапевтическими свойствами

Г. Часть молекулы, обеспечивающая её вторичные фармакологические эффекты

33. Если правая молекула обладает диуретическими свойствами, то левая обладает свойствами:



А. вазодилатирующими

Б. антимикробными

В. Диуретическими

Г. Антиангинальными

34. В ряду производных тиазида и фенотиазина встречаются молекулы с галогензаместителями в ароматических кольцах. Данная модификация способствует:

- А. повышению аффинитета препарата к мишени
- Б. снижению токсических свойств
- В. Улучшению растворимости препарата
- Г. Повышению почечной экскреции препарата

35. Введение в структуру молекулы алкильного фрагмента как правило повышает её липофильность. Однако, если его длина ≥ 12 , это может привести к снижению его эффективности. В первую очередь, это связано с:

- А. нарушением образования мицеллярных сольватов молекулы
- Б. избыточная липофильность препарата приводит к его «застреванию» в мембранах
- В. Нарушение всасываемости препарата
- Г. Нарушение распределения электронной плотности на поверхности молекулы

36. Токсикофор – это:

- А. часть молекулы, связанная с её токсическими свойствами
- Б. неметаболизируемое фармакологически активное соединение
- В. Фармакологически активное соединение, обладающее разными терапевтическими свойствами
- Г. Часть молекулы, обеспечивающая её вторичные фармакологические эффекты

37. Группировка, как правило обладающая свойствами токсикофора:

- А. эпоксидная
- Б. фенильная
- В. Карбоксильная
- Г. Этильная

38. Наибольшей липофильностью среди алкильных группировок обладают:

- А. неразветвленные группировки
- Б. разветвлённые группировки
- В. Циклические алкильные группировки

Дизайн лекарственных веществ на примере различных фармакологических групп.

21. Типичный набор стадий в современном драг дизайне:

- А. выбор мишени – создание ведущей структуры – модификации ведущей структуры – доклинические исследования – клинические исследования – регистрация
- Б. создание ведущей структуры – модификации ведущей структуры – выбор мишени – доклинические исследования – клинические исследования – регистрация
- В. выбор мишени – регистрация – создание ведущей структуры – модификации ведущей структуры – доклинические исследования – клинические исследования
- Г. создание ведущей структуры – выбор мишени – модификации ведущей структуры – доклинические исследования – клинические исследования – регистрация

22. Показателем выбора хорошей ведущей структуры не является:

- А. токсичность

- Б. взаимодействие с мишенью с желаемым эффектом
- В. Легкая модифицируемость
- Г. Достигает мишени

23. ADME – это:

- А. адсорбция, распределение, метаболизм, выведение
- Б. аденозиддиметилэпоксид
- В. Среда разработки ведущей структуры
- Г. Адсорбция, деструкция, метаболизм, элиминация

24. Процесс спонтанного сворачивания полипептидной цепи в трёхмерную структуру:

- А. фолдинг
- Б. докинг
- В. Процессинг
- Г. Посттрансляционная модификация

25. Метод моделирования, предсказывающий наиболее стабильную ориентацию лиганда в структуре целевого белка:

- А. докинг
- Б. фолдинг
- В. Процессинг
- Г. Посттрансляционная модификация

26. Целью для лекарственного препарата может быть:

- А. всё верно
- Б. белок
- В. ДНК
- Г. РНК

27. Слепой скрининг ведущей структуры как правило ведётся:

- А. In silico
- Б. In vivo
- В. In vitro

28. Метод, не используемый в тестах фармакокинетики-фармакодинамики:

- А. NMR
- Б. микродиализ
- В. PET
- Г. MRS

29. В качестве радиометки при изучении распределения и связывания психоактивных препаратов как правило используется:

- А. ^{11}C
- Б. ^{18}F
- В. ^{31}S
- Г. ^{55}I

30. Оценка алгоритмов докинга не идёт по параметру:

- А. разрешение докинга
- Б. точность докинга

- В. Фактор обогащения
- Г. Сопоставительный анализ

31. Цисплатин состоит всего из 11 атомов, однако, спектр его фармакологических и побочных эффектов крайне широк. Это связано с его:

- А. низкой специфичностью
- Б. высокой токсичностью
- В. Высокой биодоступностью
- Г. Высокой реакционной способностью

32. Не является методом установления структуры макромолекулы-мишени:

- А. нефелометрия
- Б. рентгеноструктурный анализ
- В. ЯМР
- Г. Молекулярное моделирование

33. В случае если препарат плохо проникает внутрь клетки для достижения мишени, адекватной стратегией является:

- А. создание препарата, взаимодействующего с G-белок опосредованных передатчиком, регулирующим деятельность мишени
- Б. модификация препарата для увеличения его липофильности
- В. Выбор альтернативной мишени
- Г. Изменение фармакофора препарата

34. Антигистаминные препараты 2го поколения, по сравнению с первым, не обладают седативным эффектом. Это было достигнуто за счёт:

- А. уменьшения липофильности препаратов
- Б. повышению афинности препаратов к серотониновым рецепторам
- В. Увеличению липофильности препаратов
- Г. Снижению афинности препаратов к адренорецепторам рецепторам

35. H₂-блокаторы 3 поколения по сравнению с первым имеют следующие свойства:

- А. всё верно
- Б. сниженная токсичность по отношению к ЦНС
- В. Повышенная активность
- Г. Повышенное время действия

36. Классические тесты фармакокинетики-фармакодинамики не подходят для данной группы препаратов:

- А. генотерапевтические вирусные вектора
- Б. иммунизирующие сыворотки
- В. Препараты без резорбтивного действия
- Г. Интерфероны

37. Упрощение молекулы X позволило получить более активное лекарственное средство:

- А. лоратадин
- Б. хинин
- В. Таксол
- Г. Пиретрин

38. Один из случаев модификации лекарственных препаратов направленный на снижение его аффинности к биологической мишени:

- А. цефалоспорины
- Б. макролиды
- В. Антифолаты
- Г. Сульфаниламиды

39. Модификация морфина, основа для разработки антагонистов опиоидных рецепторов:

- А. тебаин
- Б. папаин
- В. Бромелин
- Г. Папаверин

40. Хиральная молекула при взаимодействии с рецептором ориентируется по:

- А. 3 точкам
- Б. 4 точкам
- В. 2 точкам
- Г. 1 точке