

Федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение  
высшего образования  
«Московский государственный университет имени М.В. Ломоносова»  
Химический факультет

УТВЕРЖДАЮ  
Декан химического факультета,  
Акад. РАН, профессор



/В.В. Лунин/

«27» февраля 2017 г.

## **РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)**

### **Основные аспекты медицинской химии**

**Уровень высшего образования:**

Специалитет

---

**Направление подготовки (специальность):**

04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия

**Направленность (профиль) ОПОП:**

Медицинская химия и тонкий органический синтез

**Форма обучения:**

очная

---

Рабочая программа рассмотрена и одобрена  
Учебно-методической комиссией факультета  
(протокол №1 от 27.01.2017)

Москва 2017

Рабочая программа дисциплины разработана в соответствии с самостоятельно установленным МГУ образовательным стандартом (ОС МГУ) для реализуемых основных профессиональных образовательных программ высшего образования по направлению подготовки / специальности 04.05.01 «Фундаментальная и прикладная химия» (программа специалитета), утвержденного приказом МГУ от 22 июля 2011 года № 729 (в редакции приказов МГУ от 22 ноября 2011 года № 1066, от 21 декабря 2011 года № 1228, от 30 декабря 2011 года № 1289, от 27 апреля 2012 года № 303, от 30 декабря 2016 года № 1671).

Год (годы) приема на обучение

2014/2015, 2015/2016, 2016/2017, 2017/2018, 2018/2019

---

1. Наименование дисциплины (модуля) **Основные аспекты медицинской химии**
2. Уровень высшего образования – **специалитет.**
3. Направление подготовки: **04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия.**
4. Место дисциплины (модуля) в структуре ООП: вариативная часть ООП, блок ПД.
5. Планируемые результаты обучения по практике, соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы (компетенциями выпускников)

Компетенция	Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю)
<b>ОПК-1.С.</b> Способность решать современные проблемы фундаментальной и прикладной химии, используя методологию научного подхода и систему фундаментальных химических понятий и законов	<p><b>Уметь</b> анализировать научную литературу с целью выбора направления и методов, применяемых в исследовании по теме выпускной квалификационной работы,</p> <p><b>Уметь:</b> самостоятельно составлять план исследования</p> <p><b>Владеть</b> навыками поиска, критического анализа, обобщения и систематизации научной информации, постановки целей исследования и выбора оптимальных путей и методов их достижения</p>
<b>СПК-2.С</b> Способность выдвигать концепции направленной структурной модификации соединения-лидера в зависимости от наличия информации о его молекулярной мишени в организме	<p><b>Знать:</b> базовую стратегию создания лекарственных веществ в современном мире и ее принципиальное отличие от традиционного поиска лекарственных средств</p> <p><b>Уметь:</b> выдвигать концепции направленной структурной модификации соединения-лидера</p> <p><b>Владеть:</b> базовыми навыками дизайна структур лекарственных веществ</p>
<b>СПК-3.С</b> Способность оценивать методы дизайна структур потенциальных лекарств и методы определения их физиологической активности <i>in vivo</i> и <i>in vitro</i> и интерпретировать результаты биотестирования	<p><b>Знать:</b> принципы получения аналогов соединений-лидеров с противовирусной, противораковой, противоопухолевой, анальгетической, антигистаминной, антибактериальной и гормоноподобной активностью</p> <p><b>Уметь:</b> ориентироваться в многообразии биологических мишеней</p> <p><b>Владеть:</b> навыками критического анализа статей из основных мировых журналов по медицинской химии</p>

<b>СПК-5.С</b> Владение теоретическими основами методов предсказания физиологической активности веществ и навыками, применение их при решении практических задач	<b>Знать:</b> рациональные подходы к созданию лекарственных веществ, действующих как ингибиторы ферментов, агонистов или антагонистов различных рецепторных систем, интеркаляторов в ДНК и ДНК-алкилирующих агентов <b>Уметь:</b> интерпретировать качественные зависимости «структура – активность» <b>Владеть:</b> навыками приблизительной оценки фармакокинетических и фармакодинамических свойств веществ
--	--

6. Объем дисциплины в зачетных единицах с указанием количества академических или астрономических часов, выделенных на контактную работу обучающихся с преподавателем (по видам учебных занятий) и на самостоятельную работу обучающихся:

*Объем дисциплины (модуля) составляет 4 зачетных единицы, всего 144 часа, из которых 84 часа составляет контактная работа студента с преподавателем (54 часа занятия лекционного типа, 18 часов – занятия семинарского типа, 4 часа – групповые консультации, 4 часа - промежуточный контроль успеваемости), 64 часа составляет самостоятельная работа студента.*

7. Входные требования для освоения дисциплины (модуля), предварительные условия:

Обучающийся должен

**Знать:** основные естественнонаучные дисциплины в рамках образовательной программы бакалавра, главным образом, органическую химию, неорганическую химию и аналитическую химию

**Уметь:** пользоваться химической литературой и современными интернет-ресурсами

**Владеть:** базовыми навыками синтеза и анализа органических веществ, работы с компьютерными программами

8. Содержание дисциплины (модуля), структурированное по темам.

Наименование и краткое содержание разделов и тем дисциплины (модуля),  форма промежуточной аттестации	Всего (часы)	В том числе	
		Контактная работа (работа во взаимодействии с преподавателем), часы из них	Самостоятельная работа обучающегося, часы из них

		Занятия лекционного типа	Занятия семинарского типа	Групповые консультации	Индивидуальные консультации	Учебные занятия, направленные на проведение текущего контроля успеваемости, промежуточной аттестации (*)	<b>Всего</b>	Выполнение домашних заданий	Подготовка рефератов и т.п.	<b>Всего</b>
Раздел 1. Основные понятия и термины медицинской химии. Стратегии поиска и генерирования соединений-лидеров.	<b>4</b>	4	-				<b>4</b>			
Раздел 2. Биологические мишени действия лекарств и принципы создания структур лигандов этих мишеней.	<b>36</b>	30	-	2			<b>32</b>	4		<b>4</b>
Раздел 3. Вариации структур лекарственных веществ для улучшения фармакокинетических характеристик. Количественная характеристика биологической активности.	<b>10</b>	6	-				<b>6</b>	4		<b>4</b>
Раздел 4. Принципы конструирования структур отдельных типов лекарственных препаратов.	<b>58</b>	14	18	2			<b>34</b>	24		<b>24</b>

Промежуточная аттестация <i>экза- мен</i>	<b>36</b>					4	<b>4</b>			<b>32</b>
<b>Итого</b>	<b>144</b>	<b>54</b>	<b>18</b>	<b>4</b>		<b>4</b>	<b>80</b>			<b>64</b>

(\*) текущий контроль осуществляется во время семинарских занятий

#### 9. Образовательные технологии:

- применение компьютерных симуляторов, обработка данных на компьютерах, использование компьютерных программ, управляющих приборами;
- использование средств дистанционного сопровождения учебного процесса;
- преподавание дисциплин в форме авторских курсов по программам, составленным на основе результатов исследований научных школ МГУ.

#### 10. Учебно-методические материалы для самостоятельной работы по дисциплине (модулю):

1. О.Н. Зефирова. Основные понятия и термины медицинской химии (под ред. акад. Н.С. Зефирова). Методическое пособие. М.: Цифровичок, 2013, 40 с.
2. О.Н. Зефирова, Н.С. Зефиров. Физиологически активные соединения, взаимодействующие с глутаматными рецепторами. *Журнал Органической Химии*. 2000, Т. 36, вып.9, С. 1273–1300.
3. О.Н. Зефирова, Н.С. Зефиров. Физиологически активные соединения, взаимодействующие с серотониновыми (5-гидрокситриптаминавыми) рецепторами. *Успехи химии*. 2001, т. 70, № 4, С. 382–407.

#### 11. Ресурсное обеспечение:

- Перечень основной и вспомогательной учебной литературы ко всему курсу

#### Основная литература

1. G. Patrick. An introduction to medicinal chemistry. 5<sup>th</sup> edition, Oxford, Oxford University Press, 2013, 789 pp.
2. K. Stromgaard, P. Krogsgaard-Larsen, U. Madsen. Textbook of Drug Design and Discovery, 4<sup>th</sup> edition, US: Boca Raton, FL, CRC Press/Taylor & Francis. 2010, 476 pp.
3. Journal of Medicinal Chemistry

#### Дополнительная литература

1. Th.L. Lemke, D.A. Williams. Foye's Principles of Medicinal Chemistry. 6<sup>th</sup> edition, 2007, US: Lippincott, Williams & Wilkins, 1400 pp.
2. Е.В. Румянцев, Е.В. Антипа, Ю.В. Чистяков. Химические основы жизни. М.: Химия, КолосС, 2007. 560 с.
3. С. Д. Варфоломеев, К. Г. Гуревич. Биокинетика. М.: ФАИР-ПРЕСС, 1999. 720 с.
4. М.Дж. Нил. Наглядная фармакология: пер. с англ. под ред. Р.Н. Аляутдина. М., ГЭОТАР-Медиа. 2008. 104 с.

12. Язык преподавания – русский

13. Преподаватели: проф. Зефирова Ольга Николаевна

### **Фонды оценочных средств, необходимые для оценки результатов обучения**

Образцы оценочных средств для текущего контроля усвоения материала и промежуточной аттестации - экзамена. На экзамене проверяется достижение компетенций (в части ЗУВ), перечисленных в п.5.

#### **Вопросы для экзамена:**

1. Основные стратегии поиска лекарственных веществ в современном мире. Эмпирические стратегии поиска соединения-лидера. Комбинаторные библиотеки.
2. «Рациональные» стратегии поиска соединения-лидера. Оценка качества соединения-лидера.
3. Мишени действия лекарственных веществ в организме. Подходы к созданию структур веществ, нарушающих целостность клеточных мембран.
4. Мишени действия лекарственных веществ в организме. Структурный дизайн лигандов ДНК
5. Общие представления о подходах к оптимизации соединения-лидера. SAR, QSAR, эмпирические подходы к структурной модификации, молекулярное моделирование.
6. Белки как мишени действия лекарственных веществ. Понятие фармакофора.
7. Подходы к созданию структур ингибиторов ферментов.
8. Подходы к созданию структур агонистов и антагонистов рецепторных белков
9. Методы модификации структур химических веществ для улучшения их фармакокинетических параметров.
10. Количественные характеристики биологической активности. Представление о способах биотестирования лекарственных веществ *in vitro* и *in vivo*.
11. Токсофорные группировки. Соединения, дающие ложноположительные результаты тестирования.

12. Подходы к созданию структур веществ, обладающих антибактериальной активностью.
13. Подходы к созданию структур веществ, обладающих противоопухолевой активностью.
14. Подходы к созданию структур веществ, обладающих антивирусной активностью.
15. Подходы к созданию структур веществ, обладающих анальгетической активностью.
16. Подходы к созданию структур гормоноподобных веществ.
17. Подходы к созданию структур веществ, обладающих другими типами активности.

### Методические материалы для проведения процедур оценивания результатов обучения

Шкала оценивания знаний, умений и навыков является единой для всех дисциплин (приведена в таблице ниже)

<b>ШКАЛА И КРИТЕРИИ ОЦЕНИВАНИЯ РЕЗУЛЬТАТА ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)</b>				
<b>Оценка</b>	<b>2</b>	<b>3</b>	<b>4</b>	<b>5</b>
<b>Результат</b>				
<b>Знания</b>	Отсутствие знаний	Фрагментарные знания	Общие, но не структурированные знания	Сформированные систематические знания
<b>Умения</b>	Отсутствие умений	В целом успешное, но не систематическое умение	В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы умение (допускает неточности непринципального характера)	Успешное и систематическое умение
<b>Навыки (владения)</b>	Отсутствие навыков	Наличие отдельных навыков	В целом, сформированные навыки, но не в активной форме	Сформированные навыки, применяемые при решении задач

<b>РЕЗУЛЬТАТ ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)</b>	<b>ФОРМА ОЦЕНИВАНИЯ</b>
<p><b>Знать:</b> базовую стратегию создания лекарственных веществ в современном мире и ее принципиальное отличие от традиционного поиска лекарственных средств</p> <p><b>Знать:</b> принципы получения аналогов соединений-лидеров с противовирусной, противораковой, противоопухолевой, анальгетической, антигистаминной, антибактериальной и гормоноподобной активностью</p> <p><b>Знать:</b> рациональные подходы к созданию лекарственных веществ, действующих как инги-</p>	мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене

<p>биторы ферментов, агонистов или антагонистов различных рецепторных систем, интеркаляторов в ДНК и ДНК-алкилирующих агентов</p>	
<p><b>Уметь</b> анализировать научную литературу с целью выбора направления и методов, применяемых в исследовании по теме выпускной квалификационной работы  <b>Уметь:</b> самостоятельно составлять план исследования  <b>Уметь:</b> выдвигать концепции направленной структурной модификации соединения-лидера  <b>Уметь:</b> ориентироваться в многообразии биологических мишеней  <b>Уметь:</b> интерпретировать качественные зависимости «структура – активность»</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>
<p><b>Владеть</b> навыками поиска, критического анализа, обобщения и систематизации научной информации, постановки целей исследования и выбора оптимальных путей и методов их достижения  <b>Владеть:</b> базовыми навыками дизайна структур лекарственных веществ  <b>Владеть:</b> навыками критического анализа статей из основных мировых журналов по медицинской химии  <b>Владеть:</b> навыками приблизительной оценки фармакокинетических и фармакодинамических свойств веществ</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>