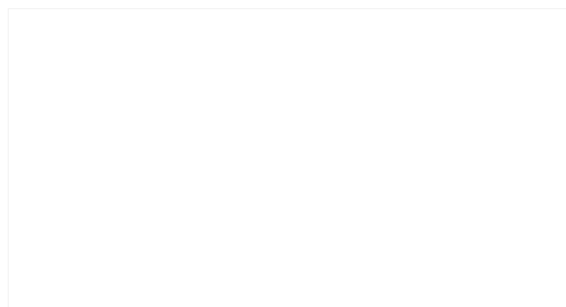


Федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение  
высшего образования «Санкт-Петербургский государственный химико-фармацевтический  
университет» Министерства здравоохранения Российской Федерации  
(ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России)



## **РАБОЧАЯ ПРОГРАММА**

ДИСЦИПЛИНЫ

2.1.3. Медицинская химия

Уровень высшего образования  
ПОДГОТОВКА КАДРОВ ВЫСШЕЙ КВАЛИФИКАЦИИ

Шифр и наименование научной специальности программы аспирантуры:

1.4.16 Медицинская химия

Форма обучения

Очная

Санкт-Петербург  
2022

Рабочая программа дисциплины *Медицинская химия* составлена в соответствии с федеральными государственными требованиями к структуре программ подготовки научных и научно-педагогических кадров в аспирантуре (адъюнктуре), условиями их реализации, срокам освоения этих программ с учетом различных форм обучения, образовательных технологий и особенностей отдельных категорий аспирантов (адъюнктов), утвержденных приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации от 20.10.2021 г. № 951.

**Разработчики рабочей программы дисциплины:**

№	Фамилия, имя, отчество	Степень, звание, должность, место работы
1	Куваева Елена Владимировна	Кандидат фармацевтических наук, доцент кафедры органической химии

**Рассмотрение и согласование рабочей программы дисциплины:**

№	Подразделение или коллегиальный орган	Ответственное лицо	ФИО	Виза	№ протокола дата
1	Кафедра органической химии	Заведующий кафедрой, руководитель подразделения, реализующий ОП	Яковлев Игорь Павлович	Рассмотрено	Протокол № 7 от 16.02.22
2	Кафедра органической химии	Ответственный за программу аспирантуры	Куваева Елена Владимировна	Согласовано	Протокол № 7 от 16.02.22

**Утверждение рабочей программы дисциплины:**

№	Подразделение или коллегиальный орган	Ответственное лицо	ФИО	Виза	№ протокола дата
1	Экспертный научно-технический совет	Председатель ЭНТС	Флисюк Елена Владимировна	Утверждено	Протокол №1 от 31.03.2022

## 1. Цели и задачи освоения дисциплины

**Цель (цели)** освоения дисциплины:

Формирование у обучающихся углубленных знаний и практических навыков, необходимых для осуществления высококвалифицированной профессиональной деятельности в области медицинской химии, а также решения профессиональных задач в области самостоятельной научно-исследовательской деятельности.

**Задачи:**

- изучение основ взаимодействия лекарств с мишенью;
- изучение классов мишеней и механизмов передачи биологического сигнала;
- рассмотрение основных структурных особенностей, влияющие на фармакокинетические свойства молекулы;
- формирование знаний об основных процессах метаболизма ксенобиотиков;
- изучение основных групп биоизостеров и основных токсикофорных фрагментов.

## 2. Место дисциплины в структуре программы аспирантуры

Дисциплина «Медицинская химия» реализуется во втором семестре. Дисциплина «Медицинская химия» развивает знания, умения и навыки, сформированные у обучающихся по результатам изучения следующих дисциплин: 2.1.1. Иностранный язык, 2.1.2 История и философия науки, 2.1.7.1 Основы публикационной активности и поиска научной информации, 2.1.7.2 Основы научно-исследовательской деятельности. Дисциплина Биологическая химия является базовой для освоения модуля 1.1. Научный компонент.

## 3. Требования к результатам освоения дисциплины

Процесс изучения дисциплины направлен на формирование следующих результатов обучения

Таблица 1

Планируемые результаты обучения по дисциплине, характеризующие этапы ее освоения (иметь представление, знать, уметь, владеть)	Формы организации занятий	
	Лекции	Самостоятельная работа
1. Знать теоретические основы взаимодействия лекарств с мишенью;	+	+
2. Знать основные классы мишеней и механизмы передачи биологического сигнала;	+	+
3. Знать основные понятия в ранней разработке лекарственных веществ;	+	+
4. Знать основные пути получения потенциальных хитов;	+	+
5. Знать основные структурные особенности, влияющие на фармакокинетические свойства молекулы;	+	+
6. Знать основные процессы метаболизма ксенобиотиков;	+	+
7. Знать основные группы биоизостеров;	+	+
8. Знать основные токсикофорные фрагменты;	+	+
9. Уметь определять тип ингибирования фермента лигандом;	+	+

10. Уметь предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации скорости всасывания;		+
11. Уметь предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации метаболизма;		+
12. Уметь предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью снижения токсичности;		+
13. Владеть навыками самостоятельной работы с литературой по медицинской химии, справочным пособиям;		+

#### 4. Структура и содержание дисциплины

##### 4.1 Структура дисциплины

Общая трудоемкость дисциплины составляет 3 зачетных единицы (108 акад. часов).

Дисциплина изучается на 1 курсе во 2 семестре.

Таблица 2

№	Вид работы	Трудоемкость, академических часов
		2 семестр
1	Лекции/из них в интерактивной форме	16
2	Практические занятия/из них в интерактивной форме	-
3	Семинарские занятия/из них в интерактивной форме	-
4	Консультации	2
5	Самостоятельная работа	54
6	Консультация перед экзаменом	2
7	Форма промежуточной аттестации (экзамен (кандидатский экзамен), зачет, дифференцированный зачет)	Э,2
9	Всего часов	108

##### 4.2. Содержание дисциплины

Таблица 3

№ п/п	Наименование раздела дисциплины (дидактической единицы)	Аннотированное содержание раздела дисциплины
1	Введение, предмет и задачи медицинской	История научных подходов к поиску лекарств. Предмет и задачи дисциплины. Понятие о лекарственном веществе, требования к нему. Путь от идеи до госрегистрации. Междисциплинарный

	химии	характер медицинской химии.
2	Биологические мишени действия лекарств	Биомолекулы. Белок, фермент, рецептор. Варианты взаимодействия лиганд-мишень, типы ингибирования. Сигнальные каскады. Рецепторы, сопряженные с G-белком, рецепторные тирозинкиназы. Ионные каналы. Методы <i>in vitro</i> оценки функции рецептора. Нуклеиновые кислоты как мишени.
3.	Этапы и методы создания лекарственного вещества	Хит и лид, источники соединений. Высокопроизводительный скрининг. QSAR, фармакофор. Фармакокинетическая оптимизация лида (ADME): физико-химические свойства, всасывание, распределение, метаболизм, экскреция. Биоизостеры, пролекарства, пептидомиметики, смена хемотипа (scaffold hopping).

### 4.3. Содержание дисциплины по видам учебных занятий

Таблица 4

Темы лекций	Активные формы, час.	Часы	Ссылки на результаты обучения
1. Вводная лекция. Основные понятия и определения. Основные классы биоорганических соединений. Белковые мишени, ферменты, ферментативная кинетика и типы ингибирования.	1	2	1, 5
2. Рецепторы, классификация, типы взаимодействия. Ионные каналы. Методы оценки взаимодействия рецептора с лигандом. Основные рецепторные семейства, сигнальные каскады. Неферментативные и нерецепторные мишени. Нуклеиновые кислоты как мишени.	1	2	1, 2, 5
3. Понятие хита и лида. Источники хитов. Высокопроизводительный скрининг, QSAR, фармакофор.	1	2	1, 5
4. Фармакокинетическая оптимизация лида (ADME свойства). Физико-химические свойства, всасывание, распределение.	1	2	1, 4, 5
5. Метаболизм и экскреция. Биоизостерия	1	2	1, 5
6. Смена хемотипа, пролекарства. Пептидомиметики,	1	2	1, 5
7. Структурные фрагменты, ассоциированные с токсичностью.	1	2	1, 5
8. Современные методы и проблемы медицинской химии.	1	2	1, 5

Таблица 5

Темы семинаров / практических занятий	Активные формы,	Часы	Ссылки на результаты	Учебная деятельность
---------------------------------------	-----------------	------	----------------------	----------------------

	час.		обучения	
<i>Не предусмотрены</i>				

Таблица 6

Темы лабораторных занятий	Часы	Ссылки на результаты обучения	Учебная деятельность
<i>Не предусмотрены</i>			

#### 4.4 Самостоятельная работа обучающихся

Таблица 7

№	Виды самостоятельной работы	Ссылки на результаты обучения	Часы на выполнение	Часы на консультации
<i>Семестр: 2</i>				
1	Изучение теоретического материала по темам лекций	1, 2, 3, 4, 5	14	1
	Изучение теоретического материала по разделам дисциплины с использованием конспектов лекций, а также источников основной и дополнительной литературы. 1. Куваева Е.В. Медицинская химия [Электронный ресурс]: электронный учебно-методический комплекс / Е.В. Куваева; ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России. – Санкт-Петербург, [2022]. – Текст электронный // ЭИОС СПХФУ: [сайт]. – URL: <a href="https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773">https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773</a> – Режим доступа: для авторизир. пользователей.			
2	Подготовка реферата	1, 2, 3, 4, 5	8	1
	Пользуясь библиотечным фондом университета и интернетом подготовить реферат. 1. Куваева Е.В. Медицинская химия [Электронный ресурс]: электронный учебно-методический комплекс / Е.В. Куваева; ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России. – Санкт-Петербург, [2022]. – Текст электронный // ЭИОС СПХФУ: [сайт]. – URL: <a href="https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773">https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773</a> – Режим доступа: для авторизир. пользователей.			
3	Подготовка к промежуточной аттестации (экзамену)	1, 2, 3, 4, 5	32	2
	Изучение теоретического материала по всем разделам дисциплины. 1. Куваева Е.В. Медицинская химия [Электронный ресурс]: электронный учебно-методический комплекс / Е.В. Куваева; ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России. – Санкт-Петербург, [2022]. – Текст электронный // ЭИОС СПХФУ: [сайт]. – URL: <a href="https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773">https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773</a> – Режим доступа: для авторизир. пользователей.			

#### 5. Образовательные технологии

В ходе реализации учебного процесса по дисциплине проводятся лекционные занятия.

Темы, рассматриваемые на лекциях и изучаемые самостоятельно, а также по вопросам, вызывающим затруднения, проводятся консультации.

Для организации и контроля самостоятельной работы обучающихся, а также проведения консультаций применяются информационно-коммуникационные технологии (таблица 8).

Таблица 8.

Информирование	<a href="https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773">https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773</a>
Консультирование	<a href="https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773">https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773</a>
Контроль	<a href="https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773">https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773</a>
Размещение учебных материалов	<a href="https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773">https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773</a>

В ходе реализации учебного процесса по дисциплине применяются следующие интерактивные формы обучения, а именно лекция с обратной связью.

**Краткое описание применения:** на лекциях «История научных подходов к поиску лекарств. Предмет и задачи дисциплины. Понятие о лекарственном веществе, требования к нему. Путь от идеи до госрегистрации. Междисциплинарный характер медицинской химии. Биомолекулы. Белок, фермент, рецептор. Варианты взаимодействия лиганд-мишень, типы ингибирования. Сигнальные каскады. Рецепторы, сопряженные с G-белком, рецепторные тирозинкиназы. Ионные каналы. Методы *in vitro* оценки функции рецептора. Нуклеиновые кислоты как мишени. Хит и лид, источники соединений. Высокопроизводительный скрининг. QSAR, фармакофор. Фармакокинетическая оптимизация лида (ADME): физико-химические свойства, всасывание, распределение, метаболизм, экскреция. Биоизостеры, пролекарства, пептидомиметики, смена хемотипа (scaffold hopping).»

## 6. Правила аттестации обучающихся по дисциплине

### 6.1. Общая характеристика форм текущего контроля и промежуточной аттестации

По дисциплине «Медицинская химия» проводится текущий контроль и промежуточная аттестация (экзамен).

#### 6.1.1. Характеристика форм текущего контроля по дисциплине

**Текущий контроль** по дисциплине «Медицинская химия» проводится в форме сдачи рефератов. По результатам текущего контроля выставляются оценки «зачтено» или «не зачтено». Получение положительных оценок текущего контроля является основой проведения промежуточной аттестации по дисциплине.

Таблица 9

<i>Наименование или номер раздела</i>	<i>Наименование оценочного средства</i>
Введение, предмет и задачи медицинской химии	Реферат 1
Биологические мишени действия лекарств	Реферат 2
Этапы и методы создания лекарственного вещества	Реферат 3

#### 6.1.2. Характеристика промежуточной аттестации по дисциплине

**Промежуточная аттестация** (итоговая по дисциплине) проводится в виде кандидатского экзамена. Кандидатский экзамен проводится в виде собеседования по экзаменационным билетам. Промежуточная аттестация, кроме ответа на вопросы экзаменационного билета, включает собеседование по теме диссертационной работы (Таблица 10).

Таблица 10

№ семестра	Форма промежуточной аттестации	Наименование оценочного средства
2	Экзамен	Собеседование по билету

Требования к структуре и содержанию оценочных средств представлены в оценочных средствах по дисциплине (Приложение 1).

### 6.1.3. Соответствие форм аттестации по дисциплине планируемым результатам обучения

В таблице 11 представлено соответствие форм текущего контроля и промежуточной аттестации заявляемым планируемым к результатам обучения по дисциплине.

Таблица 11

<i>Планируемые результаты обучения по дисциплине, характеризующие этапы ее освоения (иметь представление, знать, уметь, владеть)</i>	<i>Реферат 1</i>	<i>Реферат 2</i>	<i>Реферат 3</i>
1. Знать теоретические основы взаимодействия лекарств с мишенью;	+		
2. Знать основные классы мишеней и механизмы передачи биологического сигнала;	+		
3. Знать основные понятия в ранней разработке лекарственных веществ;		+	
4. Знать основные пути получения потенциальных хитов;		+	
5. Знать основные структурные особенности, влияющие на фармакокинетические свойства молекулы;		+	
6. Знать основные процессы метаболизма ксенобиотиков;			+
7. Знать основные группы биоизостеров;			+
8. Знать основные токсикофорные фрагменты;			+
9. Уметь определять тип ингибирования фермента лигандом;	+	+	+
10. Уметь предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации скорости всасывания;	+	+	+



11. Уметь предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации метаболизма;	+	+	+
12. Уметь предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью снижения токсичности;	+	+	+
13. Владеть навыками самостоятельной работы с литературой по медицинской химии, справочным пособиям;	+	+	+

## 6.2. Порядок проведения текущего контроля и промежуточной аттестации по дисциплине

**Текущий контроль** проводится на основе подготовки реферата. Для подготовки реферата обучающиеся получают задание по теме лекции. Задание оценивается «зачтено – не зачтено». Задание считается выполненным и обучающемуся ставится «зачтено», если он полностью раскрыл заданную ему тему, правильно оформил реферат. Для получения «зачтено» обучающемуся достаточно подготовить два реферата.

Получение положительных оценок по всем видам текущего контроля является основанием проведения промежуточной аттестации по дисциплине.

**Промежуточная аттестация** проводится в виде экзамена. Экзамен проводится в форме устного опроса по билетам, с предварительной подготовкой в течение 40 минут. Уровень качества ответа обучающегося на экзамене определяется с использованием оценок «неудовлетворительно», «удовлетворительно», «хорошо», «отлично». Если по итогам проведенной промежуточной аттестации результаты обучающегося не соответствуют требованиям, предъявляемых к результатам обучения по дисциплине, обучающемуся выставляется оценка «не удовлетворительно». Оценка «удовлетворительно», «хорошо» или «отлично» означает успешное прохождение промежуточной аттестации.

### Порядок проведения экзамена:

1. Экзамен проводится в период экзаменационной сессии, предусмотренной учебным планом. Не допускается проведение экзамена на последних семинарских, либо лекционных занятиях.

2. Экзамен должен начинаться в указанное в расписании время и проводиться в отведенной для этого аудитории. Самостоятельный перенос экзаменатором времени и места проведения экзамена не допускается.

3. Преподаватель принимает экзамен только при наличии ведомости и надлежащим образом оформленной зачетной книжки.

4. Критерии оценки ответа обучающегося на экзамене, а также форма его проведения доводятся преподавателем до сведения обучающихся до начала экзамена на экзаменационной консультации.

5. Результат экзамена объявляется обучающемуся непосредственно после его сдачи, затем выставляется в экзаменационную ведомость и зачетную книжку. Положительные оценки заносятся в экзаменационную ведомость и зачетную книжку, неудовлетворительная оценка проставляется только в экзаменационной ведомости. В случае неявки обучающегося для сдачи экзамена в ведомости вместо оценки делается запись «не явился».

6. Для приема кандидатского экзамена создаётся экзаменационная комиссия, состав которой утверждается руководителем организации. Состав экзаменационной комиссии формируется из числа научно-педагогических работников (в том числе работающих по совместительству) организации, где осуществляется прием кандидатских экзаменов, в количестве не более 5 человек, и включает в себя председателя, заместителя председателя и членов экзаменационной комиссии. В состав экзаменационной комиссии могут включаться научно-педагогические работники других организаций.

Регламент работы экзаменационных комиссий определяется локальным актом организации. Экзаменационная комиссия по приему кандидатского экзамена по специальной дисциплине правомочна принимать кандидатский экзамен по специальной дисциплине, если в ее заседании участвуют не менее 3 специалистов, имеющих ученую степень кандидата или доктора наук по научной специальности, соответствующей специальной дисциплине, в том числе 1 доктор наук.

Решение экзаменационной комиссии оформляется протоколом, в котором указываются: код и наименование научной специальности, по которому сдавался кандидатский экзамен; шифр и наименование научной специальности, наименование отрасли науки, по которой подготавливается диссертация; оценка уровня знаний обучающегося по кандидатскому экзамену; фамилия, имя, отчество (последнее - при наличии), ученая степень (в случае ее отсутствия - уровень профессионального образования и квалификация) каждого члена экзаменационной комиссии.

Критерии выставления общей оценки по результатам промежуточной аттестации представлены в разделе 6.3.

### 6.3. Критерии оценки результатов освоения программы в рамках промежуточной аттестации

Таблица 12

Планируемые результаты обучения	Форма контроля (экзамен)	
	Не освоен	Освоен
<b>Семестр 2</b>		
1. Знать теоретические основы взаимодействия лекарств с мишенью;	Знания предметной области, владение понятийным аппаратом, глубина анализа отсутствуют или нуждаются в существенной корректировке	Демонстрирует глубокие знания теоретических основ взаимодействия лекарств с мишенью
2. Знать основные классы мишеней и механизмы передачи биологического сигнала;	Аспирант при ответе допускает грубые ошибки и демонстрирует поверхностные знания в области классификации мишеней и механизмов передачи биологического сигнала	Оценка соответствует высокому уровню знаний и навыков в области классификации мишеней и механизмов передачи биологического сигнала

3. Знать основные понятия в ранней разработке лекарственных веществ;	Аспирант не способен, объяснить основные понятия в ранней разработке лекарственных веществ	Способен грамотно, применяя собственные знания, объяснить основные понятия в ранней разработке лекарственных веществ
4. Знать основные пути получения потенциальных хитов;	Аспирант не способен, объяснить основные пути получения потенциальных хитов	Способен грамотно, применяя собственные знания, объяснить основные пути получения потенциальных хитов
5. Знать основные структурные особенности, влияющие на фармакокинетические свойства молекулы;	Аспирант не способен, объяснить основные понятия в ранней разработке лекарственных веществ	Способен грамотно, применяя собственные знания, объяснить основные понятия в ранней разработке лекарственных веществ
6. Знать основные процессы метаболизма ксенобиотиков;	Знает основные процессы метаболизма ксенобиотиков	Не знает основные процессы метаболизма ксенобиотиков
7. Знать основные группы биоизостеров;	Знает основные группы биоизостеров	Не знает основные группы биоизостеров
8. Знать основные токсикофорные фрагменты;	Знает основные токсикофорные фрагменты	Не знает основные токсикофорные фрагменты
9. Уметь определять тип ингибирования фермента лигандом;	Не умеет определять тип ингибирования фермента лигандом	Умеет определять тип ингибирования фермента лигандом
10. Уметь предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации скорости всасывания;	Не умеет предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации скорости всасывания	Умеет предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации скорости всасывания
11. Уметь предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации метаболизма;	Не умеет предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации метаболизма	Умеет предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью оптимизации метаболизма

12. Уметь предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью снижения токсичности;	Не умеет предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью снижения токсичности	Умеет предлагать обоснованные структурные модификации вещества с целью снижения токсичности
13. Владеть навыками самостоятельной работы с биохимической литературой, справочными пособиями;	Не способен самостоятельно работать с биохимической литературой, справочными материалами.	Умения и навыки позволяют самостоятельно работать с биохимической литературой, справочными материалами

#### 6.4. Критерии оценки результатов освоения дисциплины в рамках промежуточной аттестации по дисциплине.

Основанием проведения промежуточной аттестации по дисциплине является получение положительных оценок по видам текущего контроля.

Критерии выставления оценок по результатам промежуточной аттестации по дисциплине представлены в таблице 13.

Таблица 13

<i>Оценка</i>	<i>Ответы на экзамене</i>
Отлично	Теоретические знания и умения превышают основные требования. Количество ошибок минимально, легко исправляются самостоятельно
Хорошо	Теоретические знания и умения соответствуют достаточно высокому уровню. Количество ошибок незначительно, исправляются практически во всех случаях самостоятельно
Удовлетворительно	Теоретические знания и умения соответствуют основным требованиям, но требуются небольшие доработки. Необходимы указания на допущенные ошибки, которые впоследствии устраняются самостоятельно
Неудовлетворительно	Теоретические знания и умения соответствуют начальному уровню, систематически проявляются ошибки, при исправлении которых испытываются существенные затруднения

Если по итогам проведенной промежуточной аттестации обучающийся демонстрирует знания, умения, навыки ниже уровня требований, предъявляемых к результатам обучения по дисциплине, обучающемуся выставляется оценка «не удовлетворительно».

## 7. Литература

### *Основная литература*

1. Граник В.Н. Основы медицинской химии: учебное пособие / В.Н.Граник. - М: Вузовская книга, 2001. – 384 с.

2. Биологическая химия : учебник / А. Д. Таганович, Э. И. Олецкий, Н. Ю. Коневалова, В. В. Лелевич ; под редакцией А. Д. Тагановича. — 2-е изд. — Минск : Вышэйшая школа, 2016. — 672 с. — ISBN 978-985-06-2703-2. — Текст : электронный // Электронно-библиотечная система IPR BOOKS : [сайт]. — URL: <http://www.iprbookshop.ru/90721.html> (дата обращения: 22.02.2022). — Режим доступа: для авторизир. пользователей

*Дополнительная, в т.ч. учебная:*

Не предусмотрено.

## **8. Учебно-методическое и программное обеспечение дисциплины**

### **8.1. Учебно-методическое обеспечение**

1. Куваева Е.В. Медицинская химия [Электронный ресурс]: электронный учебно-методический комплекс / Е.В. Куваева; ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России. – Санкт-Петербург, [2022]. – Текст электронный // ЭИОС СПХФУ: [сайт]. – URL: <https://edu-spcpu.ru/enrol/index.php?id=3773> – Режим доступа: для авторизир. пользователей.

2. Куваева Е.В. Научная деятельность, направленная на подготовку диссертации на соискание научной степени кандидата наук [Электронный ресурс]: электронный учебно-методический комплекс / Е.В. Куваева; ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России. – Санкт-Петербург, [2022]. – Текст электронный // ЭИОС СПХФУ: [сайт]. – URL: <https://edu-spcpu.ru/course/view.php?id=3764> – Режим доступа: для авторизир. пользователей.

3. Куваева Е.В. Подготовка публикаций и(или) заявок на патенты [Электронный ресурс]: электронный учебно-методический комплекс / Е.В. Куваева; ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России. – Санкт-Петербург, [2022]. – Текст электронный // ЭИОС СПХФУ: [сайт]. – URL: <https://edu-spcpu.ru/course/view.php?id=3765>. – Режим доступа: для авторизир. пользователей.

4. Куваева Е.В. Промежуточная аттестация по этапам выполнения научного исследования [Электронный ресурс]: электронный учебно-методический комплекс / Е.В. Куваева; ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России. – Санкт-Петербург, [2022]. – Текст электронный // ЭИОС СПХФУ: [сайт]. – URL: <https://edu-spcpu.ru/course/view.php?id=3767> – Режим доступа: для авторизир. пользователей.

### **8.2. Программное обеспечение**

Для обеспечения реализации дисциплины используется стандартный комплект программного обеспечения (ПО), включающий регулярно обновляемое, свободно распространяемое и лицензионное ПО, в т.ч. Windows и MS Office.

Перечень специализированного программного обеспечения для изучения дисциплины представлен в таблице 15.

*Специализированное программное обеспечение*

Таблица 15

№	Наименование ПО	Назначение	Место размещения
	Не требуется		

*Программное обеспечение для адаптации образовательных ресурсов для обучающихся из числа лиц с ограниченными возможностями здоровья*

Таблица 16

№	Наименование ПО	Назначение	Место размещения
1	Программа	Программа экранного доступа к системным и офисным	Компьютерный

экранный доступа Nvidia	приложениям, включая web-браузеры, почтовые клиенты, Интернет-мессенджеры и офисные пакеты. Встроенная поддержка речевого вывода на более чем 80 языках. Поддержка большого числа брайлевских дисплеев, включая возможность автоматического обнаружения многих из них, а также поддержка брайлевского ввода для дисплеев с брайлевской клавиатурой. Чтение элементов управления и текста при использовании жестов сенсорного экрана	класс для самостоятельной работы на кафедре высшей математики
----------------------------	---	---

## 9. Профессиональные базы данных и информационные справочные системы

1. ЭБС IPR BOOKS: [сайт] : электронная библиотечная система / ООО Компания «Ай Пи Ар Медиа», гл.ред. Е. А. Богатырева. — [Саратов]. — Электронные данные. - Режим доступа: <http://www.iprbookshop.ru>. — Загл. с экрана.
2. КонсультантПлюс: [справочно-правовая система] / ЗАО "КонсультантПлюс". - [Москва]. - Загл. титул. экрана - Програмный продукт.
3. Korean Journal Database: [база данных]: [сайт] / Web of Science. - [США]. - URL: <http://apps.webofknowledge.com>. - Режим доступа: для зарегистрир. пользователей. - Текст: электронный
4. MEDLINE: [база данных]: [сайт] / Web of Science. - [США]. - URL: <http://apps.webofknowledge.com>. - Режим доступа: для зарегистрир. пользователей. - Текст: электронный
5. SciELO Citation Index: [база данных]: [сайт] / Web of Science. - [США]. - URL: <http://apps.webofknowledge.com> - Режим доступа: для зарегистрир. пользователей. - Текст: электронный
6. Science Citation Index Expanded: [база данных]: [сайт] / Web of Science. - [США]. - URL: <http://apps.webofknowledge.com>. - Режим доступа: для зарегистрир. пользователей. - Текст: электронный
7. Social Sciences Citation Index: [база данных] : [сайт] / Web of Science. - [США]. - URL: <http://apps.webofknowledge.com>. - Режим доступа: для зарегистрир. пользователей. - Текст: электронный
8. ЭБС Юрайт: [сайт] / издательство Юрайт. — URL: <https://biblio-online.ru/bcode/433109> (дата обращения: 10.02.2022). - Текст: электронный
9. Elsevier: [издатель научно-технической, медицинской литературы] / Elsevier Science and Technology (S&T). - URL: <http://www.elsevierscience.ru> (дата обращения: 21.02.2022). - Текст: электронный
10. Springer Nature [международное издательство]: [сайт] / Springer Nature Group - [Хайдельберг], [Лондон] - URL: <https://www.springernature.com/gr> (дата обращения: 21.02.2022). - Текст: электронный

## 10. Материально-техническое обеспечение

*Оборудование общего назначения*

Таблица 17

№	Наименование	Назначение
---	--------------	------------

1	Презентационное оборудование (мультимедиа-проектор, экран, компьютер для управления)	Проведение лекционных и семинарских занятий
2	Компьютерный класс (с выходом в Internet)	Организация самостоятельной работы обучающихся

*Специализированное оборудование*

Таблица 18

№	Наименование оборудования	Назначение	Место размещения
1	Не требуется		

*Оборудование, обеспечивающее адаптацию электронных и печатных образовательных ресурсов для обучающихся из числа лиц с ограниченными возможностями здоровья*

Таблица 19

№	Наименование оборудования	Назначение	Место размещения
1	Устройство портативное для увеличения DIONOPTICVISION	Предназначено для обучающихся с нарушением зрения с целью увеличения текста и подбора контрастных схем изображения	Учебно-методический отдел, устанавливается по месту проведения занятий (при необходимости)
2	Электронный ручной видеоувеличитель BiggerD2.5-43 TV	Предназначено для обучающихся с нарушением зрения для увеличения и чтения плоскочечатного текста	Учебно-методический отдел, устанавливается по месту проведения занятий (при необходимости)
3	Радиокласс (радиомикрофон) «Сонет-PCM» РМ-6-1 (заушный индуктор)	Портативная звуковая FM-система для обучающихся с нарушением слуха, улучшающая восприятие голосовой информации	Учебно-методический отдел, устанавливается в мультимедийной аудитории по месту проведения занятий (при необходимости)

*Перечень наборов демонстрационного оборудования и учебно-наглядных пособий*

Таблица 20

№	Наименование	Назначение	Место размещения
1	Презентационные материалы, слайд-конспекты лекций	Иллюстративные материалы для проведения лекционных занятий	ЭУМК по дисциплине

**ОЦЕНОЧНЫЕ СРЕДСТВА ПО ДИСЦИПЛИНЕ**

**1. Общая характеристика оценочных средств текущего контроля и промежуточной аттестации по дисциплине**

Перечень и характеристика оценочных средств текущего контроля и промежуточной аттестации по дисциплине представлены в таблице 1.

Таблица 1

№ п/п	Наименование оценочного средства	Краткая характеристика оценочного средства	Представление оценочного средства в фонде
<b>Семестр 2</b>			
<b>Текущий контроль</b>			
1.	Реферат 1	Продукт самостоятельной работы обучающегося, где автор раскрывает суть исследуемой проблемы, приводит различные точки зрения, а также собственные взгляды на нее, представляющий собой публичное выступление по представлению полученных результатов решения определенной учебно-практической, учебно-исследовательской или научной темы	Темы рефератов, требования к оформлению реферата, доклада, презентации
2.	Реферат 2	Продукт самостоятельной работы обучающегося, где автор раскрывает суть исследуемой проблемы, приводит различные точки зрения, а также собственные взгляды на нее, представляющий собой публичное выступление по представлению полученных результатов решения определенной учебно-практической, учебно-исследовательской или научной темы	Темы рефератов, требования к оформлению реферата, доклада, презентации
3.	Реферат 3	Продукт самостоятельной работы обучающегося, где автор раскрывает суть исследуемой проблемы, приводит различные точки зрения, а также собственные взгляды на нее, представляющий собой публичное выступление по представлению полученных результатов решения определенной учебно-практической,	Темы рефератов, требования к оформлению реферата, доклада, презентации



		учебно-исследовательской или научной темы	
<b>Промежуточная аттестация</b>			
1.	Экзамен	Средство комплексной проверки усвоения учебного материала по дисциплине, проверка умений и знаний, навыков	Комплект экзаменационных билетов

## **2. Требования к структуре и содержанию оценочных средств текущего контроля и промежуточной аттестации**

### **2.1. Требования к структуре и содержанию оценочных средств текущего контроля**

#### **2.1.1 Реферат 1**

##### **Примерные темы реферата:**

1. Понятие мишени для лекарственного вещества. Виды, примеры.
2. Ферментативные мишени, механизм действия гидролаз, кинетические исследования.
3. Дизайн ингибиторов ферментов. Типы ингибирования, кинетические исследования.
4. Рецепторные мишени. Понятие о сигнальном каскаде.
5. Дизайн антагонистов рецепторов, типы антагонистов.
6. Дизайн агонистов рецепторов, типы агонистов.
7. Фармакологическое воздействие на нуклеиновые кислоты. Особенности и ограничения.
8. Ион-канальные системы, примеры, регуляция.
9. Рецепторы семейства GPCR, структура и механизм функционирования. Аденилат-циклазный сигнальный каскад.
10. Структура и механизм функционирования рецепторов семейства GPCR. Фосфолипазный каскад.
11. Рецепторные тирозинкиназы, структура и механизм функционирования, сигнальный каскад.
12. Структура и механизм функционирования рецепторов стероидных гормонов.

**Требования к оформлению рефератов:** объем реферата: 5-10 страниц печатного текста, шрифт Times New Roman 14 пт; реферат должен содержать обзор не менее пяти источников информации и содержать следующие разделы: постановка проблемы, анализ текущего состояния (проблемы, выводы).

#### **2.1.2 Реферат 2**

##### **Примерные темы реферата:**

1. Путь создания лекарства от идеи до регистрации
2. Источники хитов. Виртуальный скрининг в разработке лекарств. Связь с методами комбинаторного синтеза и биологического скрининга.
3. Базы данных химической и биологической информации, примеры, особенности, проблемные аспекты.
4. Построение фармакофорных моделей, применение в скрининге.
5. Методы моделирования взаимодействия лигандов и рецепторов.
6. Понятие о QSAR-моделировании, 2D, 3D.
7. Молекулярные скэффолды с точки зрения медицинской химии.

**Требования к оформлению рефератов:** объем реферата: 5-10 страниц печатного текста, шрифт Times New Roman 14 пт; реферат должен содержать обзор не менее пяти источников информации и содержать следующие разделы: постановка проблемы, анализ текущего состояния (проблемы, выводы).

#### **2.1.3 Реферат 3**

##### **Примерные темы реферата:**

1. Понятие "лид-хоппинга", смена ядра в структуре соединений-лидеров.
2. Биоизостеризм. Классические биоизостерные замены.
3. Биоизостеризм. Неклассические биоизостерные замены.
4. Методы ригидификации и деригидификации структур веществ.
5. Хит-ту-лид оптимизация, принципы получения валидированных соединений-лидеров.

6. Ключевые ADME-параметры, подлежащие оценке и оптимизации на ранних этапах разработки лекарств.

7. Метаболизм лекарств, роль в дизайне.

8. Токсичность лекарств, оптимизация соединений для повышения безопасности.

**Требования к оформлению рефератов:** объем реферата: 5-10 страниц печатного текста, шрифт Times New Roman 14 пт; реферат должен содержать обзор не менее пяти источников информации и содержать следующие разделы: постановка проблемы, анализ текущего состояния (проблемы, выводы).

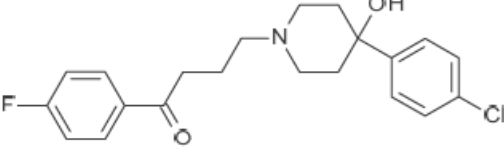
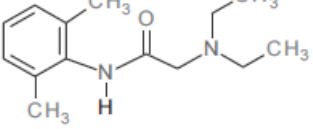
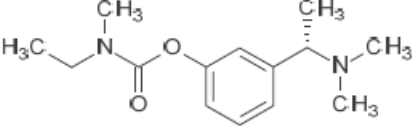
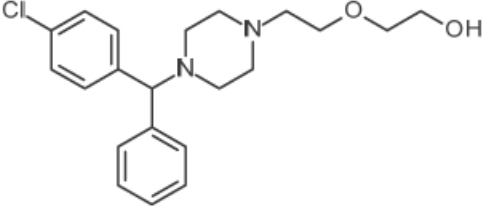
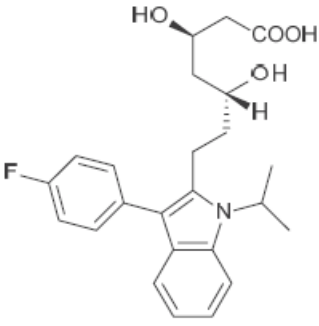
## 2.2. Требования к структуре и содержанию оценочных средств промежуточной аттестации

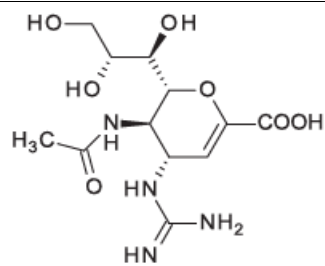
### Семестр 2

Перечень вопросов экзамена, структурированный по «Планируемым результатам освоения дисциплины», представлен в таблице 2.

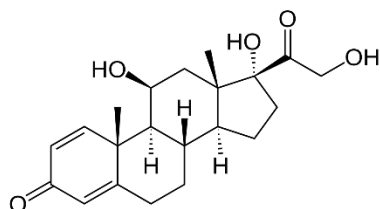
Таблица 2

<i>Категории планируемых результатов освоения дисциплины</i>	<i>Формулировка вопроса</i>
Планируемые результаты освоения дисциплины № 1, 5	Биомишень для действия лекарства. Общие понятия. Примеры.
	Ферменты как биомишени. Особенности действия.
	Принципы дизайна антагонистов ферментов. Типы антагонистов.
	Рецепторы как биомишени. Особенности действия.
	Принципы дизайна антагонистов рецепторов. Типы антагонистов.
	Принципы дизайна агонистов рецепторов. Типы агонистов.
	Нуклеиновые кислоты как биомишени. Особенности и ограничения.
	Структура и механизм функционирования ион-канальной рецепторной системы.
	Структура и механизм функционирования рецепторов семейства GPCR. Аденилат-циклазный каскад.
	Структура и механизм функционирования рецепторов семейства GPCR. Липазный каскад.
	Структура и механизм функционирования рецепторных тирозинкиназ.
Структура и механизм функционирования рецепторов стероидных гормонов	
Планируемые результаты освоения дисциплины № 1,2,5	Этапы создания лекарства от идеи до регистрации
	Виртуальный скрининг в разработке лекарств. Ключевые методы и подходы. Связь с методами комбинаторного синтеза и биологического скрининга.
	Базы данных химической и биологической информации, примеры, особенности, проблемные аспекты.
	Построение фармакофорных моделей.
	Моделирование взаимодействия лигандов и рецепторов.
	Понятие о QSAR-моделировании.
	Молекулярные скэффолды с точки зрения медицинской химии.
	Понятие "лид-хоппинга", или трансформации структур соединений-лидеров.
Классические биоизостерные замены.	

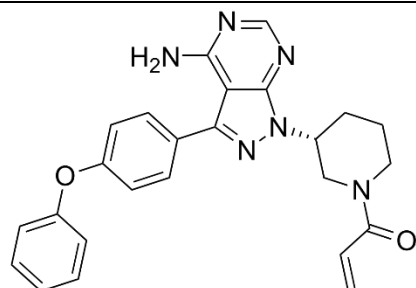
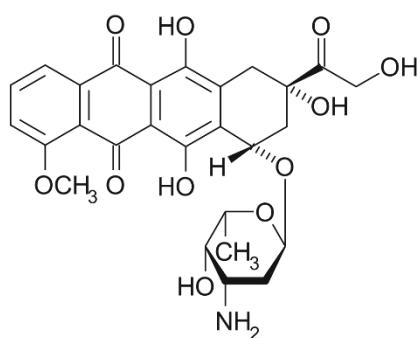
	<p>Неклассические биоизостерные замены.</p> <p>Методы ригидификации и деригидификации молекулярных скэффолдов.</p> <p>Принципы оптимизации первоначальных соединений-хитов в валидированные соединения-лидеры ("хит-ту-лид" оптимизация).</p> <p>Ключевые ADME-параметры, подлежащие оценке и оптимизации на ранних этапах разработки лекарств.</p> <p>Метаболизм лекарств, роль и применение в дизайне соединений.</p> <p>Токсичность лекарств, методы ее оценки и дизайна соединений с оптимизированным профилем токсичности.</p>
<p>Планируемые результаты освоения дисциплины № 4, 5</p>	<p>Для нижеприведенной структуры предположите фармакологический класс, охарактеризуйте мишень, молекулярный механизм. Определите фрагменты, которые могут участвовать в связывании с мишенью, и типы связи. Какие возможны метаболиты?</p>
	 <p>Как изменится фармакокинетика у О-миристинового эфира?</p>
	 <p>Как можно снизить токсичность со стороны ЦНС?</p>
	 <p>Как изменится активность у пара-изомера?</p>
	 <p>Как повлияет на эффекты со стороны ЦНС модификация CH<sub>2</sub>OH в COOH?</p>
 <p>Что произойдет с активностью у оптического изомера?</p>	



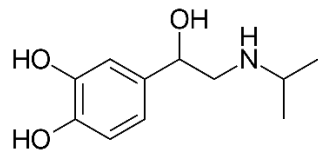
Что произойдет с активностью у оптического изомера?



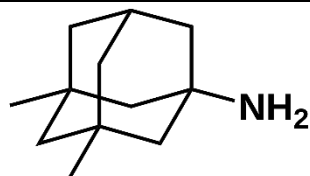
Предложите пролекарства, которые увеличат стабильность и биодоступность вещества



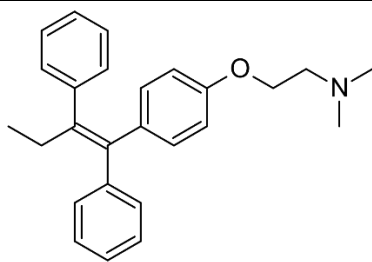
Какие изменения в активности можно ожидать при насыщении ацильного остатка?



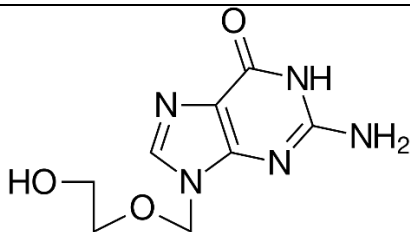
Какие изменения в активности можно ожидать при замене фенольных гидроксильных атомов на атомы хлора?



Какие изменения в активности можно ожидать при ацилировании данного соединения глицином?



У какого метаболита активность выше, чем у исходного соединения?



Как может измениться биодоступность препарата у O-валильного производного?

Собеседование по теме диссертационной работы № 1, 2, 3, 4, 5

Обучающийся готовит презентацию их 5-7 слайдов по теме диссертационной работы.

