Документ подписан простой электронной подписью Информация о владельце:

ФИО: Ястребов Олфедеральное государственное автономное образовательное учреждение Должность: Ректор дата подписания: 29.0 Вънсине го вобразования «Российский университет дружбы народов»

Уникальный программный ключ: ca953a012<u>0d891083f9396730 **Факультет физико-математических и естественных наук**</u>

(наименование основного учебного подразделения (ОУП)-разработчика ОП ВО)

## РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ

#### Основы дизайна лекарственных препаратов

(наименование дисциплины/модуля)

## Рекомендована МССН для направления подготовки/специальности:

04.04.01 «Химия»

(код и наименование направления подготовки/специальности)

Освоение дисциплины ведется в рамках реализации основной профессиональной образовательной программы высшего образования (ОП ВО):

«Фармацевтический анализ в производстве и контроле качества лекарственных средств»

(наименование (профиль/специализация) ОП ВО)

### 1. ЦЕЛЬ ОСВОЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ

Целью освоения дисциплины «Основы дизайна лекарственных препаратов» является ознакомить студентов с современной методологией дизайна лекарственных веществ, научить студента анализировать зависимость биологической активности органических молекул от их строения, раскрыть сущность основных концепций в стратегии синтеза новых веществ и предсказания потенциальной активности полученных молекулярных структур, научить студента применять логику тонкого органического синтеза по планированию и выбору тактических путей для целенаправленного получения потенциальных лекарственных веществ.

## 2. ТРЕБОВАНИЯ К РЕЗУЛЬТАТАМ ОСВОЕНИЯ ДИСЦИПЛИНЫ

Освоение дисциплины «Основы дизайна лекарственных препаратов» направлено на формирование у обучающихся следующих компетенций (части компетенций):

Таблица 2.1. Перечень компетенций, формируемых у обучающихся при освоении

дисциплины (результаты освоения дисциплины)

| Шифр  | Компетенция   | Индикаторы достижения компетенции  |  |  |  |
|-------|---|--|--|--|--|
| шифр  | Компетенция   | (в рамках данной дисциплины)   |  |  |  |
| УК-6  | Способен определить и реализовать приоритеты собственной деятельности и способы ее совершенствования на основе самооценки   | УК-6.1. Оценивает свои ресурсы и их пределы (личностные, ситуативные, временные), оптимально их использует для успешного выполнения порученного задания.  УК-6.2. Определяет приоритеты профессионального роста и способы совершенствования собственной деятельности на основе самооценки по выбранным критериям;  УК-6.3. Выстраивает гибкую профессиональную траекторию, используя инструменты непрерывного образования, с учетом накопленного опыта профессиональной деятельности и динамично изменяющихся требований рынка труда |  |  |  |
| ОПК-1 | Способен выполнять комплексные экспериментальные и расчетно-теоретические исследования в избранной области химии или смежных наук с использованием современных приборов, программного обеспечения и баз данных профессионального назначения | ОПК-1.1. Использует существующие и разрабатывает новые методики получения и характеризации веществ и материалов для решения задач в избранной области химии или смежных наук  ОПК-1.2. Использует современное оборудование, программное обеспечение и профессиональные базы данных для решения задач в избранной области химии или смежных наук  ОПК-1.3. Использует современные расчетнотеоретические методы химии для решения профессиональных задач   |  |  |  |

| Шифр         | Компетенция  | Индикаторы достижения компетенции (в рамках данной дисциплины)   |
|--------------|--|--|
| М-ПК-<br>1н  | Способен планировать работу и выбирать адекватные методы решения научно-исследовательских задач в выбранной области химии, химической технологии или смежных с химией науках | М-ПК-1-н-1. Составляет общий план исследования и детальные планы отдельных стадий,  М-ПК-1-н-2. Выбирает экспериментальные и расчетно-теоретические методы решения поставленной задачи исходя из имеющихся материальных и временных ресурсов |
| М-ПК-2-<br>н | Способен проводить патентно-<br>информационные исследования в выбранной области химии и/или смежных наук   | М-ПК-2-н-1. Проводит поиск специализированной информации в патентно-информационных базах данных М-ПК-2-н-2. Анализирует и обобщает результаты патентного поиска по тематике проекта в выбранной области химии (химической технологии)        |

## 3. МЕСТО ДИСЦИПЛИНЫ В СТРУКТУРЕ ОП ВО

Дисциплина «Основы дизайна лекарственных препаратов» относится к вариативной компоненте блока Б1 ОП ВО.

В рамках ОП ВО обучающиеся также осваивают другие дисциплины и/или практики, способствующие достижению запланированных результатов освоения дисциплины «Основы дизайна лекарственных препаратов».

Таблица 3.1. Перечень компонентов ОП ВО, способствующих достижению

запланированных результатов освоения дисциплины

| Шифр | Наименование<br>компетенции   | Предшествующие дисциплины/модули, практики*  | Последующие<br>дисциплины/модули,<br>практики* |
|------|---|--|--|
| УК-6 | Способен определить и реализовать приоритеты собственной деятельности и способы ее совершенствования на основе самооценки | Актуальные задачи современной химии Химия природных соединений Фармакопея и фармакопейный анализ лекарств Химические методы контроля качества лекарств в мировых фармакопеях Фармацевтическая химия Современные информационные технологии в фармации Методика работы с | Преддипломная практика                         |

| Шифр  | Наименование<br>компетенции | Предшествующие<br>дисциплины/модули, | Последующие<br>дисциплины/модули, |
|-------|-----------------------------|--------------------------------------|-----------------------------------|
|       |                             | практики*                            | практики*                         |
|       |                             | базами данных                        |                                   |
|       |                             | Методы элементного                   |                                   |
|       |                             | анализа в контроле                   |                                   |
|       |                             | качества лекарственных               |                                   |
|       |                             | средств                              |                                   |
|       |                             | Физико-химические                    |                                   |
|       |                             | основы контроля                      |                                   |
|       |                             | качества лекарственных               |                                   |
|       |                             | средств                              |                                   |
|       |                             | Оптические методы в                  |                                   |
|       |                             | фармацевтическом                     |                                   |
|       |                             | анализе                              |                                   |
|       |                             | Научно-                              |                                   |
|       |                             | исследовательская                    |                                   |
|       |                             | работа                               |                                   |
|       |                             | Экспериментальные                    |                                   |
|       |                             | методы исследования в                |                                   |
|       |                             | органической химии                   |                                   |
|       |                             | Экспериментальные                    |                                   |
|       |                             | методы исследования в                |                                   |
|       |                             | фармацевтическом                     |                                   |
|       |                             | анализе                              |                                   |
|       | Способен                    | Актуальные задачи                    | Преддипломная практика            |
|       | выполнять                   | современной химии                    |                                   |
|       | комплексные                 | Химия природных                      |                                   |
|       | экспериментальны            | соединений                           |                                   |
|       | е и расчетно-               | Фармакопея и                         |                                   |
|       | теоретические               | фармакопейный анализ                 |                                   |
|       | исследования в              | лекарств                             |                                   |
|       | избранной области           | Химические методы                    |                                   |
|       | химии или                   | контроля качества                    |                                   |
|       | смежных наук с              | лекарств в мировых                   |                                   |
|       | использованием              | фармакопеях                          |                                   |
|       | современных                 | Фармацевтическая                     |                                   |
| ОПК-1 | приборов,                   | химия                                |                                   |
| OHK-1 | программного                | Методы элементного                   |                                   |
|       | обеспечения и баз           | анализа в контроле                   |                                   |
|       | данных                      | качества лекарственных               |                                   |
|       | профессионального           | средств                              |                                   |
|       | назначения                  | Физико-химические                    |                                   |
|       |                             | основы контроля                      |                                   |
|       |                             | качества лекарственных               |                                   |
|       |                             | средств                              |                                   |
|       |                             | Оптические методы в                  |                                   |
|       |                             | фармацевтическом                     |                                   |
|       |                             | анализе                              |                                   |
|       |                             | Научно-                              |                                   |
|       |                             | исследовательская                    |                                   |

| Шифр     | Наименование<br>компетенции   | Предшествующие дисциплины/модули, практики*   | Последующие<br>дисциплины/модули,<br>практики* |
|----------|---|---|--|
| М-ПК-1-н | Способен планировать работу и выбирать адекватные методы решения научно- исследовательских задач в выбранной области химии, химической технологии или смежных с химией науках | Актуальные задачи современной химии Химия природных соединений Фармакопея и фармакопейный анализ лекарств Химические методы контроля качества лекарств в мировых фармакопеях Фармацевтическая химия Современные информационные технологии в фармации Методика работы с базами данных Методы элементного анализа в контроле качества лекарственных средств Физико-химические основы контроля качества лекарственных средств Оптические методы в фармацевтическом анализе Научно-исследовательская работа Экспериментальные методы исследования в органической химии Экспериментальные методы исследования в фармацевтическом анализе | Преддипломная практика                         |
| М-ПК-2-н | Способен проводить патентно- информационные исследования в выбранной области химии и/или смежных наук   | Актуальные задачи современной химии Химия природных соединений Фармакопея и фармакопейный анализ лекарств Химические методы   | Преддипломная практика                         |

| Шифр | Наименование<br>компетенции | Предшествующие<br>дисциплины/модули,<br>практики* | Последующие<br>дисциплины/модули,<br>практики* |
|------|-----------------------------|---|--|
|      |                             | контроля качества                                 |  |
|      |                             | лекарств в мировых                                |  |
|      |                             | фармакопеях                                       |  |
|      |                             | Фармацевтическая                                  |  |
|      |                             | химия   |  |
|      |                             | Современные                                       |  |
|      |                             | информационные                                    |  |
|      |                             | технологии в фармации                             |  |
|      |                             | Методика работы с                                 |  |
|      |                             | базами данных                                     |  |
|      |                             | Методы элементного                                |  |
|      |                             | анализа в контроле                                |  |
|      |                             | качества лекарственных                            |  |
|      |                             | средств   |  |
|      |                             | Физико-химические                                 |  |
|      |                             | основы контроля                                   |  |
|      |                             | качества лекарственных                            |  |
|      |                             | средств   |  |
|      |                             | Оптические методы в                               |  |
|      |                             | фармацевтическом                                  |  |
|      |                             | анализе   |  |
|      |                             | Научно-   |  |
|      |                             | исследовательская                                 |  |
|      |                             | работа  |  |
|      |                             | Экспериментальные                                 |  |
|      |                             | методы исследования в                             |  |
|      |                             | органической химии                                |  |
|      |                             | Экспериментальные                                 |  |
|      |                             | методы исследования в                             |  |
|      |                             | фармацевтическом                                  |  |
|      |                             | анализе   |  |

<sup>\* -</sup> заполняется в соответствии с матрицей компетенций и СУП ОП ВО

# 4. ОБЪЕМ ДИСЦИПЛИНЫ И ВИДЫ УЧЕБНОЙ РАБОТЫ

Общая трудоемкость дисциплины «Основы дизайна лекарственных препаратов» составляет 3 зачетных единицы.

Таблица 4.1. Виды учебной работы по периодам освоения ОП ВО для <u>**ОЧНОЙ**</u>

формы обучения

| Dur vuoduo ii nodomy                      | всего, | Семестр(-ы) |   |    |   |
|---|--------|-------------|---|----|---|
| Вид учебной работы                        | ак.ч.  | 1           | 2 | 3  | 4 |
| Контактная работа, ак.ч.                  | 36     |             |   | 36 |   |
|   |        |             |   |    |   |
| Лекции (ЛК)                               | 36     |             |   | 36 |   |
| Лабораторные работы (ЛР)                  |        |             |   |    |   |
| Практические/семинарские занятия (СЗ)     |        |             |   |    |   |
| Самостоятельная работа обучающихся, ак.ч. | 54     |             |   | 54 |   |

| Вид учебной работы                        |         | всего, |   | Семес | тр(-ы) |   |
|---|---------|--------|---|-------|--------|---|
|   |         | ак.ч.  | 1 | 2     | 3      | 4 |
| Контроль (экзамен/зачет с оценкой), ак.ч. |         | 18     |   |       | 18     |   |
| 06  | ак.ч.   | 108    |   |       | 108    |   |
| Общая трудоемкость дисциплины             | зач.ед. | 3      |   |       | 3      |   |

# 5. СОДЕРЖАНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

Таблица 5.1. Содержание дисциплины (модуля) по видам учебной работы

| Наименование раздела<br>дисциплины   | Содержание раздела (темы)   | Вид учебной<br>работы* |
|--|---|------------------------|
| дисцииния  | Тема 1.1. Науки, связанные с созданием и изучением лекарств. Классификация лекарств.  | puoli                  |
| Раздел 1. Введение.  | Фармакокинетика и фармакодинамика. Активность и селективность. Всасывание, распределение, метаболизм и выведение лекарства.   | ЛК                     |
| Методологические основы создания лекарственных препаратов.                                       | Тема 1.2. Стадии создания лекарственного средства. Преклинические разработки и клинические испытания. Общая схема создания лекарства на основе сплошного биоскрининга. Фрагментно-ориентированный дизайн. Лигандно- и структурно-ориентированный дизайн. Виртуальный биоскрининг. "De novo" дизайн.   | ЛК                     |
|  | Тема 2.1. Основные типы биомолекул — мишеней действия ЛВ. Общие представления о пространственной структуре белка и нуклеиновых кислот. Трёхмерные модели белковых молекул. База данных <i>Protein Data Bank</i> . Типы взаимодействия биомишень — лиганд. Фармакофор. Липофильность.  | ЛК                     |
| Раздел 2. Мишени действия лекарственных веществ. Приемы модификации структуры соединения-лидера. | Тема 2.2. Модификация функциональных групп. Гомологизация. Ограничение конформационной подвижности и циклоцепные трансформации. Изостеры и биоизостеры. Привилегированные структуры. Пептидомиметики. Структурные модификации с целью повышения оральной биодоступности. Правило Липинского. Принцип пролекарств. Обратная связь в регуляции биосинтеза. Принцип антиметаболитов в умозрительном дизайне ЛВ. Сульфаниламидные антибиотики. Антифолаты в противораковой терапии. | ЛК                     |
| Раздел 3. Дизайн лекарственных веществ, действующих на   | Тема 3.1. Структура биологических мембран. Детергенты, ионофоры, каналообразующие соединения в качестве антимикробных препаратов и антисептиков   | ЛК                     |

| Наименование раздела<br>дисциплины | Содержание раздела (темы)                  | Вид учебной<br>работы* |
|------------------------------------|--|------------------------|
| биологические                      | Тема 3.2. Механизм проведения нервного     |                        |
| мембраны.                          | импульса. Средства для наркоза. Анестетики | ЛК                     |
|                                    | местного действия.                         |                        |
|                                    | Тема 4.1. Лекарственные вещества –         |                        |
|                                    | ингибиторы ферментов. Пенициллины –        |                        |
|                                    | ингибиторы бактериальной транспептидазы.   |                        |
|                                    | Ингибиторы β-лактамазы.                    | ЛК                     |
| Валия 4 Пота бол                   | Фосфорорганические соединения –            | JIK                    |
| Раздел 4. Дизайн                   | нервнопаралитические яды и реактиваторы    |                        |
| лекарственных веществ,             | ацетилхолинэстеразы. Ингибиторы протеазы   |                        |
| действующих на                     | вич.                                       |                        |
| белковые молекулы.                 | Тема 4.2. Рецепторы. Классификация         |                        |
|                                    | рецепторов. Агонисты, частичные агонисты и |                        |
|                                    | антагонисты. Аффинность. Приёмы создания   | ЛК                     |
|                                    | агонистов и антагонистов. Ацетилхолиновые  | JIK                    |
|                                    | рецепторы. Аминокислоты и биогенные        |                        |
|                                    | амины как лиганды рецепторов.              |                        |

<sup>\* -</sup> заполняется только по  $\underline{\mathbf{OYHOЙ}}$  форме обучения: JK – лекции; JP – лабораторные работы; C3 – семинарские занятия.

## 6. МАТЕРИАЛЬНО-ТЕХНИЧЕСКОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

Таблица 6.1. Материально-техническое обеспечение дисциплины

| Тип аудитории                          | Оснащение аудитории  | Специализированное учебное/лабораторное оборудование, ПО и материалы для освоения дисциплины (при необходимости) |
|--|--|--|
| Лекционная                             | Аудитория для проведения занятий лекционного типа, оснащенная комплектом специализированной мебели; доской (экраном) и техническими средствами мультимедиа презентаций.                                      |  |
| Для самостоятельной работы обучающихся | Аудитория для самостоятельной работы обучающихся (может использоваться для проведения семинарских занятий и консультаций), оснащенная комплектом специализированной мебели и компьютерами с доступом в ЭИОС. |  |

## 7. УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ И ИНФОРМАЦИОННОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ

Основная литература:

1. Основы дизайна и химии лекарств и их наноформ / А.Т. Солдатенков. - Ханой : Знания, 2014. - 281 с.

2. Химические основы жизнеспособности и здоровья человека: Научно-учебное издание / А.Т. Солдатенков. - Ханой: Изд-во Знание, 2013. - 432 с.

## Дополнительная литература:

- 1. Ленинджер Альберт Л. Основы биохимии : В 3-х т. Т. 1 / А.Л. Ленинджер ; Пер. с англ. В.В.Борисова и др.; Под ред. В.А.Энгельгардта, Я.М.Варшавского. М. : Мир, 1985. 365 с.
- 2. Ленинджер Альберт Л. Основы биохимии : В 3-х т. Т. 2 / А.Л. Ленинджер ; Пер. с англ. М.Г.Дуниной и др.; Под ред. В.А.Энгельгардта, Я.М.Варшавского. М. : Мир, 1985. 355 с.
- 3. Ленинджер Альберт Л. Основы биохимии : В 3-х т. Т. 3 / А.Л. Ленинджер ; Пер. с англ. В.Г.Горбулева и др.; Под ред. В.А.Энгельгардта, Я.М.Варшавского. М. : Мир, 1985. 324 с.

Ресурсы информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

- 1. ЭБС РУДН и сторонние ЭБС, к которым студенты университета имеют доступ на основании заключенных договоров:
- Электронно-библиотечная система РУДН ЭБС РУДН http://lib.rudn.ru/MegaPro/Web
  - ЭБС «Университетская библиотека онлайн» <a href="http://www.biblioclub.ru">http://www.biblioclub.ru</a>
  - ЭБС Юрайт http://www.biblio-online.ru
  - ЭБС «Консультант студента» www.studentlibrary.ru
  - ЭБС «Лань» http://e.lanbook.com/
  - ЭБС «Троицкий мост»
  - Журнал "Nature Biotechnology": https://www.nature.com/nbt/
- научно-популярный сайт, посвящённый молекулярным основам современ-ной биологии и практическим применениям научных достижений в медицине и биотехнологии: https://biochemistrymoscow.com/ru/biomolecula/
  - 2. Базы данных и поисковые системы:
- электронный фонд правовой и нормативно-технической документации <a href="http://docs.cntd.ru/">http://docs.cntd.ru/</a>
  - поисковая система Яндекс https://www.yandex.ru/
  - поисковая система Google <a href="https://www.google.ru/">https://www.google.ru/</a>
  - реферативная база данных SCOPUS

http://www.elsevierscience.ru/products/scopus/

- База данных по органическим, природным и физиологически активным соединениям: <a href="https://www.reaxys.com/">https://www.reaxys.com/</a>
  - Научные журналы американского химического общества: http://pubs.acs.org/
- база данных Scifinder по органическим, природным и физиологически активным соединениям: <a href="https://scifinder-n.cas.org/">https://scifinder-n.cas.org/</a>
  - база данных 3D структур биомакромолекул: <a href="https://www.rcsb.org/">https://www.rcsb.org/</a>

Учебно-методические материалы для самостоятельной работы обучающихся при освоении дисциплины/модуля\*:

- 1. Курс лекций по дисциплине «Основы дизайна лекарственных препаратов».
- 2. Методические указания по выполнению и оформлению реферата по дисциплине «Основы дизайна лекарственных препаратов».
- \* все учебно-методические материалы для самостоятельной работы обучающихся размещаются в соответствии с действующим порядком на странице дисциплины в ТУИС!

# 8. ОЦЕНОЧНЫЕ МАТЕРИАЛЫ И БАЛЛЬНО-РЕЙТИНГОВАЯ СИСТЕМА ОЦЕНИВАНИЯ УРОВНЯ СФОРМИРОВАННОСТИ КОМПЕТЕНЦИЙ ПО ДИСЦИПЛИНЕ

Оценочные материалы и балльно-рейтинговая система\* оценивания уровня сформированности компетенций (части компетенций) по итогам освоения дисциплины «Основы дизайна лекарственных препаратов» представлены в Приложении к настоящей Рабочей программе дисциплины.

\* - ОМ и БРС формируются на основании требований соответствующего локального нормативного акта РУДН (положения/порядка).

РАЗРАБОТЧИКИ:

## Доцент кафедры Голанцов Н.Е. органической химии Должность, БУП Подпись Фамилия И.О. РУКОВОДИТЕЛЬ БУП: Кафедра органической химии Воскресенский Л.Г. Наименование БУП Фамилия И.О. Подпись РУКОВОДИТЕЛЬ ОП ВО: Декан ФФМиЕН, Воскресенский Л.Г. заведующий кафедрой органической химии Должность, БУП Фамилия И.О. Подпись