

Программа утверждена на заседании
Ученого Совета химического факультета
МГУ имени М.В.Ломоносова
Протокол № 3 от 24 апреля 2015 г.

Рабочая программа дисциплины (модуля)

1. Наименование дисциплины (модуля): **Методы функционализации природных соединений в рамках дизайна лекарств**

Цели освоения дисциплины: Формирование углубленных представлений о методах модификации основных классов природных лекарственных веществ.

Задачи освоения дисциплины:

- 1) Освоение навыков планирования путей синтеза потенциальных физиологически активных соединений, содержащих фрагменты, типичные для природных веществ.
- 2) Формирование представлений о современных методах синтеза и функционализации природных соединений.

2. Уровень высшего образования аспирантура.

3. Направление подготовки: 04.06.01 Химические науки, направленность (профиль) 02.00.16 Медицинская химия.

4. Место дисциплины (модуля) в структуре ООП: вариативная часть ООП, блок «Дисциплины (модули)»

5. Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю), соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы (компетенциями выпускников)

Формируемые компетенции (код компетенции)	Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю)
УК-1 способность к критическому анализу и оценке современных научных достижений, генерированию новых идей при решении исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях	З1 (УК-1) ЗНАТЬ: методы критического анализа и оценки современных научных достижений, а также методы генерирования новых идей при решении исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях. В2 (УК-1) ВЛАДЕТЬ: навыками критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению исследователь-

	ских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях.
УК-2 способность проектировать и осуществлять комплексные исследования, в том числе междисциплинарные, на основе целостного системного научного мировоззрения с использованием знаний в области истории и философии науки	31(УК-2) ЗНАТЬ: методы научно-исследовательской деятельности.
ОПК-1 способность самостоятельно осуществлять научно-исследовательскую деятельность в соответствующей профессиональной области с использованием современных методов исследования и информационно-коммуникационных технологий	У1 (ОПК-1) УМЕТЬ: выбирать и применять в профессиональной деятельности экспериментальные и расчетно- теоретические методы исследования.
ПК-14 способность к самостоятельному проведению научно-исследовательской работы и получению научных результатов, удовлетворяющих установленным требованиям к содержанию диссертаций на соискание ученой степени кандидата наук по направленности (научной специальности) 02.00.16 Медицинская химия	38 (ПК-14) Знать: базовые методы модификации основных типов природных соединений, используемых в качестве соединений-лидеров (структурных прототипов) в ходе дизайна лекарственных веществ; У61 (ПК-14) Уметь: планировать пути синтеза потенциальных физиологически активных соединений, содержащих фрагменты, типичные для природных веществ (содержащихся в организме животных и человека, а также выделенных из растительных источников) В6 (ПК-14) Владеть: современными методами синтеза и функционализации природных соединений и их аналогов.

6. Объем дисциплины (модуля) 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 3 зачетных единицы, всего 108 часов, из которых 68 часов составляет контактная работа студента с преподавателем (28 часов занятия лекционного типа, 28 часов занятия семинарского типа, 6 часов групповых и индивидуальных консультаций, 6 часов - мероприятий текущего контроля успеваемости и промежуточной аттестации), 40 часов составляет самостоятельная работа учащегося.

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

Для того чтобы формирование данной компетенции было возможно, обучающийся должен

Знать: общий курс органической химии, общий курс аналитической химии (с обязательным знанием раздела: физико-химические методы исследования структуры органических соединений), общий курс физической химии;

Уметь: реализовывать простейшие схемы синтеза органических соединений, проводить простейшие операции по очистке и выделению веществ, определять структуру вещества по данным спектроскопии ЯМР и других методов анализа;

Владеть: навыками чтения научной литературы на английском языке, начальными представлениями о химических основах биологических процессов и о подходах к дизайну лекарственных веществ (медицинская химия).

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

Наименование и краткое содержание разделов и тем дисциплины (модуля), форма промежуточной аттестации по дисциплине (модулю)	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	Всего	Выполнение домашних заданий	Подготовка рефератов.п.	Всего
Методы модификации стероидного скелета и функционализации стероидов	12	4	4				8			2
Основные пути модификации природных соединений с активностью по отношению к тубулину	36	12	12	2		2	28			10

Приемы функционализации углеводов и аминокислот для целей медицинской химии	12	4	4				8			4
Приемы функционализации и модификации некоторых алкалоидов для целей медицинской химии	28	8	8	2	2		20			8
Промежуточная аттестация, <i>зачет</i>	20					4	4			16
Итого	108	28	28	4	2	6	68			40

8. Образовательные технологии.

Занятия проводятся как с помощью традиционных образовательных технологий, так и с применением современных компьютерных программ.

9. Учебно-методические материалы для самостоятельной работы по дисциплине (модулю): презентации к лекционным занятиям.

Основная литература

1. Конспект лекций.
2. Drug Discovery from Natural Products, Royal Society of Chemistry, 2012.

Дополнительная литература

1. Н.А. Зефирова, О.Н. Зефирова. 2-Метоксиэстрадиол и его аналоги: синтез и соотношения «структура – антипролиферативная активность». Журнал органической химии. 2015, 51, № 9, 1231–1240.
2. Yi-Min Liu, Hsiao-Ling Chen, Hsueh-Yun Lee & Jing-Ping Liou. Tubulin inhibitors: a patent review. *Expert Opin. Ther. Patents*. 2014. 24, 69–88.

Периодическая литература

1. Journal of Natural Products
2. Journal of Organic and Biomolecular Chemistry
3. Journal of Medicinal Chemistry
4. Bioorganic and Medicinal Chemistry

10. Ресурсное обеспечение:

а) Для рекомендуемых периодических изданий открыт доступ с сервера химического факультета МГУ

б) Интернет-ресурсы.

Сайт с презентациями лекций и семинаров ведущих ученых «Henry Stewart Talks Online Collections».

с) Занятия проводятся в учебной аудитории, оборудованной доской, компьютером, проектором. Домашние задания выполняются с использованием персональных компьютеров студентов.

11. Язык преподавания – русский

12. Преподаватель:

М.н.с. Зефилов Николай Алексеевич, кафедра медицинской химии и тонкого органического синтеза МГУ имени М.В.Ломоносова,
e-mail: kolaz92@med.chem.msu.ru, телефон (495)-939-12-43

Фонды оценочных средств, необходимые для оценки результатов обучения

1. Планируемые результаты обучения для формирования компетенций п.5 и соответствующие им критерии оценивания приведены в Приложении 1.
2. Материалы к текущей (контрольные работы, вопросы к коллоквиумам и пр.), промежуточной аттестации (вопросы к зачету)

1. Образец домашнего задания по разделу «Основные пути модификации природных соединений с активностью по отношению к тубулину».

Аспирант готовит и представляет на семинаре синтетическую схему получения данного преподавателем аналога вещества с активностью по отношению к тубулину. В задании требуется объяснить выбор конкретного синтетического подхода, оценить его рациональность, предложить альтернативные варианты. Требуется объяснить необходимость использования определенных условий на каждой стадии синтеза.

2. Образец домашнего задания по всему разделу курса.

Задание 1. Аспирант готовит и представляет на семинаре доклад из ведущего мирового научного журнала по медицинской химии о модификации природного соединения. В докладе особый акцент делается на объяснение рациональности использованной синтетической схемы.

Задание 2. Аспирант готовит и представляет на семинаре синтетическую схему получения данного преподавателем аналога природного вещества с заданной физиологической активностью. В задании требуется объяснить выбор данного подхода, оценить его рациональность, предложить альтернативные варианты. Требуется объяснить необходимость использования определенных условий на каждой стадии синтеза.

3. Вопросы для зачета.

1. Приемы функционализации углеводов для целей медицинской химии.
2. Приемы функционализации аминокислот и пептидных фрагментов для целей медицинской химии.
3. Приемы модификации и функционализации стероидного скелета в ходе создания гормональных препаратов.
4. Приемы модификации и функционализации стероидного скелета в ходе создания соединений с противоопухолевой активностью.
5. Подходы к функционализации подофиллотоксина.
6. Подходы к функционализации и модификации основного скелета комбретастина А-4.
7. Подходы к функционализации и модификации основного скелета колхицина.
8. Подходы к функционализации и модификации основного скелета таксола.
9. Подходы к функционализации и модификации основного скелета винбластина и лигандов винбластинного домена.
10. Модификация и функционализация морфинового скелета.
11. Модификация и функционализация алкалоидов, содержащих мостиковые группировки (эпibatидина, кокаина, атропина и др.).

Методические материалы для проведения процедур оценивания результатов обучения

Зачет проводится по билетам. В ходе сдачи зачета проверяется, в первую очередь, формирование «знаниевой» компоненты компетенций, перечисленных в п.5, а также сформированность перечисленных в п.5 умений. Уровень знаний аспиранта по каждому вопросу оценивается на «отлично», «хорошо», «удовлетворительно», «неудовлетворительно». В случае, если на все вопросы был дан ответ, оцененный не ниже чем «удовлетворительно», аспирант получает общую оценку «зачтено». Ведомость приема зачета подписывается членами комиссии.

Приложение 1.

Оценочные средства для промежуточной аттестации по дисциплине «Методы функционализации природных соединений в рамках дизайна лекарств» на основе карт компетенций выпускников

РЕЗУЛЬТАТ ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)	КРИТЕРИИ ОЦЕНИВАНИЯ РЕЗУЛЬТАТА ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю) и ШКАЛА оценивания					ПРОЦЕДУРЫ ОЦЕНИВАНИЯ*
	1	2	3	4	5	
З1 (УК-1) ЗНАТЬ: методы критического анализа и оценки современных научных достижений, а также методы генерирования новых идей при решении исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях	Отсутствие знаний в области теоретического описания и предсказания скоростей химических реакций в жидкой и твердой фазе.	Фрагментарные знания в области теоретического описания и предсказания скоростей химических реакций в жидкой и твердой фазе.	Неполные знания в области теоретического описания и предсказания скоростей химических реакций в жидкой и твердой фазе.	Сформированные, но содержащие отдельные пробелы знания в области теоретического описания и предсказания скоростей химических реакций в жидкой и твердой фазе.	Сформированные систематические знания в области теоретического описания и предсказания скоростей химических реакций в жидкой и твердой фазе.	Зачет в форме индивидуального собеседования
В2 (УК-1) ВЛАДЕТЬ: навыками	Отсутствие навыков	Фрагментарные навыки критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по реше-	Неполные навыки критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению исследовательских и практиче-	Сформированные, но содержащие отдельные пробелы навыки	Сформированные устойчивые навыки критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению иссле-	Зачет в форме индивидуального собеседования

		нию исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях.	ских задач, в том числе в междисциплинарных областях.		довательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях.	
31(УК-2) ЗНАТЬ: методы научно-исследовательской деятельности.	Отсутствие знаний о методах научно-исследовательской деятельности.	Фрагментарные знания о методах научно-исследовательской деятельности.	Неполные знания о методах научно-исследовательской деятельности.	Сформированные, но содержащие отдельные пробелы знания о методах научно-исследовательской деятельности.	Сформированные систематические знания о методах научно-исследовательской деятельности.	Зачет в форме индивидуального собеседования
У1 (ОПК-1) УМЕТЬ: выбирать и применять в профессиональной деятельности экспериментальные и расчетно-теоретические методы исследования.	Отсутствие умений	Частично освоенное умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования	В целом успешное, но не систематическое умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования	В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования	Успешное и систематическое умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования	Письменное решение задач
38 (ПК-14) ЗНАТЬ: базовые методы модификации основных типов природных соединений, используемых в качестве соединений-лидеров	Отсутствие знаний базовых методов модификации основных типов природных соединений, используемых в качестве соеди-	Частично освоенное знание базовые методы модификации основных типов природных соединений, использу-	В целом успешное, но не систематическое знание базовые методы модификации основных типов природных соединений, ис-	В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы знание базовые методы модификации основных типов природных со-	Успешное и систематическое знание базовые методы модификации основных типов природных соединений, используемых в	Зачет в форме индивидуального собеседования

(структурных прототипов) в ходе дизайна лекарственных веществ	нений-лидеров (структурных прототипов) в ходе дизайна лекарственных веществ	емых в качестве соединений-лидеров (структурных прототипов) в ходе дизайна лекарственных веществ	пользуемых в качестве соединений-лидеров (структурных прототипов) в ходе дизайна лекарственных веществ	единений, используемых в качестве соединений-лидеров (структурных прототипов) в ходе дизайна лекарственных веществ	качестве соединений-лидеров (структурных прототипов) в ходе дизайна лекарственных веществ	
У6 (ПК-14) УМЕТЬ: планировать пути синтеза потенциальных физиологически активных соединений, содержащих фрагменты, типичные для природных веществ (содержащихся в организме животных и человека, а также выделенных из растительных источников)	Отсутствие умения планировать пути синтеза потенциальных физиологически активных соединений, содержащих фрагменты, типичные для природных веществ (содержащихся в организме животных и человека, а также выделенных из растительных источников)	Частично освоенное умение планировать пути синтеза потенциальных физиологически активных соединений, содержащих фрагменты, типичные для природных веществ (содержащихся в организме животных и человека, а также выделенных из растительных источников)	В целом успешное, но не систематическое умение планировать пути синтеза потенциально физиологически активных соединений, содержащих фрагменты, типичные для природных веществ (содержащихся в организме животных и человека, а также выделенных из растительных источников)	В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы умение планировать пути синтеза потенциально физиологически активных соединений, содержащих фрагменты, типичные для природных веществ (содержащихся в организме животных и человека, а также выделенных из растительных источников)	Успешное и систематическое умение планировать пути синтеза потенциально физиологически активных соединений, содержащих фрагменты, типичные для природных веществ (содержащихся в организме животных и человека, а также выделенных из растительных источников)	Выполнение домашних заданий
В6 (ПК-14) ВЛАДЕТЬ: современными методами синтеза и функционализации природ-	Отсутствие навыков использовать современные методы синтеза и функ-	Частично освоенные навыки использовать современные методы синтеза	В целом успешное, но не систематические навыки использовать современные мето-	В целом успешные, но содержащее отдельные пробелы навыки использовать со-	Успешные и систематические навыки использовать современные методы	Выполнение домашних заданий, собеседование в ходе зачета

ных соединений и их аналогов.	ционализации природных соединений и их аналогов.	и функционализации природных соединений и их аналогов.	ды синтеза и функционализации природных соединений и их аналогов.	временные методы синтеза и функционализации природных соединений и их аналогов.	синтеза и функционализации природных соединений и их аналогов.	
-------------------------------	--	--	---	---	--	--