

**МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ**

**Федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение  
высшего образования**

**«Российский национальный исследовательский медицинский университет  
имени Н.И. Пирогова» Министерства здравоохранения Российской Федерации  
(ФГБОУ ВО РНИМУ им. Н.И. Пирогова Минздрава России)**

«УТВЕРЖДАЮ»

И.о. декана медико-биологического факультета

Шимановский Н.Л. /  /

«29» августа 2016 г.



**АННОТАЦИЯ РАБОЧЕЙ ПРОГРАММЫ ДИСЦИПЛИНЫ**

**«МОЛЕКУЛЯРНЫЕ ОСНОВЫ ПОИСКА НОВЫХ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ»**

Направление подготовки (специальность): 30.05.02 Медицинская биофизика

Направленность образовательной программы (профиль) Медицинская биофизика

Форма обучения: очная

При разработке рабочей программы учебной дисциплины в основу положены:

- 1) ФГОС ВО по специальности 30.05.02 Медицинская биофизика, утвержденный Министерством образования и науки РФ «11» августа 2016 года № 1012
- 2) Учебный план по специальности 30.05.02 Медицинская биофизика

Составители:

Шимановский Н.Л., чл.-корр. РАН, зав. кафедрой / 

Духанин А.С., д.м.н., профессор

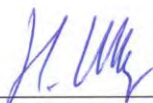
/  /

Ответственный рецензент:

Козлов И.Г., д.м.н., профессор, зав. кафедрой фармакологии  
педиатрического факультета  
ФГБОУ ВО РНИМУ им. Н.И. Пирогова Минздрава России

Рабочая программа дисциплины рассмотрена и одобрена на заседании кафедры молекулярной фармакологии и радиобиологии им. академика П.В.Сергеева, протокол № 1 от «29» августа 2016 г.

Заведующий кафедрой



/ Шимановский Н.Л./

Рабочая программа дисциплины рассмотрена и одобрена Советом Медико-биологического факультета, протокол № 1 от «29» августа 2016 г.

Председатель Совета факультета



/Шимановский Н.Л./

### 1. Целью изучения дисциплины является:

развитие у студентов способности использовать фундаментальные научные знания для разработки инновационных препаратов для лечения и профилактики заболеваний; способности к поиску и анализу научно-медицинской информации, отечественного и зарубежного опыта по тематике исследования; способности к освоению современных теоретических и экспериментальных методов исследования с целью создания новых перспективных средств, способности к организации работ по практическому использованию и внедрению результатов исследований.

### 2. Задачи, решаемые в ходе освоения программы дисциплины:

- приобретение студентами знаний о молекулярных механизмах действия разрабатываемых инновационных препаратов;
- сформировать знания о мишени действия лекарственного препарата как объекте исследования, видах мишеней и механизмов взаимодействия мишеней с лекарственным препаратом, отличиях мишеней в организме человека от мишеней в патогенных бактериях и вирусах;
- приобретение студентами знаний о перспективные направления разработок инновационных препаратов;
- приобретение студентами сведений о основные принципы и подходы для разработки инновационных препаратов;
- приобретение студентами умения определять, какие методы и подходы целесообразно использовать для разработки того или иного инновационных препаратов;
- развитие способности критически анализировать существующий опыт разработки и применения инновационных препаратов;
- обучение студентов навыкам работы с биомедицинской и патентной литературой и базами данных;
- обучение студентов приемам поиска, систематизации и анализа данных литературы относительно доклинической разработки и клинической оценки эффективности и безопасности инновационных препаратов в мире;
- формирование у студентов навыков изучения научной литературой, поискам научной информации в глобальных сетях;
- обучение студентов экспериментальными навыками оценки эффективности фармакологических препаратов *in vitro* и *in vivo*;
- обучение студентов навыками составления дорожной карты разработки инновационных препаратов;
- формирование у студентов навыков общения в коллективе, совместного решения поставленной задачи.

### 3. Место дисциплины в структуре ООП:

Учебная дисциплина «Молекулярные основы поиска новых лекарственных средств» изучается в 11 семестре.

### 4. Перечень разделов и (или) тем дисциплины и их дидактическое содержание

№ п/п	№ компетенции	Наименование раздела (темы) дисциплины	Содержание раздела (темы) в дидактических единицах
1	2	3	4
1.	ОК-1, ОПК-2, ОПК-5, ПК-11, ПК-13	Молекулярные мишени лекарственных препаратов – классификация и механизмы действия	Понятие о мишени как о молекулярной структуре, взаимодействие которой с лекарственным соединением приводит к проявлению клинического эффекта. Анатомо-терапевтическо-химическая классификация ( <i>Anatomical Therapeutic Chemical</i> ). Пять уровней классификации АТС – анатомическая группа, терапевтическая группа, фармаколо-

			<p>гическая и химическая подгруппы, а также собственно химическая субстанция.</p> <p>Классификация мишеней на основании их молекулярной природы: ферменты, субстраты/метаболиты/белки, рецепторы, ионные каналы, транспортные белки, ДНК/РНК/рибосомы, мишени действия моноклональных антител. Классификация механизмов действия лекарственных препаратов низкомолекулярной природы на определенные типы мишеней: ингибиторы/активаторы ферментов, факторов транскрипции, ионных каналов; агонисты, антагонисты, модуляторы, аллостерические активаторы, сенсibilizatory рецепторов; ингибиторы транспортных белков и белок-белковых взаимодействий; соединения, ориентированные на взаимодействие с нуклеиновыми кислотами как мишенями. Биологические препараты как высокомолекулярные лекарственные средства и мишени их действия: модификаторы субстратов/кофакторов; антитела; рекомбинантные белки.</p>
2.	ОК-1, ОПК-5, ПК-11, ПК-12	Рецепция и внутриклеточная сигнализация: поиск новых молекулярных мишеней	<p>Передача сигнала от мембранных рецепторов. Каскадный принцип, структурная организация большинства сигнальных модулей. Передача сигнала путем нековалентных взаимодействий, на каких этапах каскад как правило реализуется: взаимодействие лиганд-рецептор, в мембране (рецептор-G-белок), на границе мембрана-цитозоль (с примерами белок-белковых и липид-белковых взаимодействий), в цитозоле (взаимодействия адаптерных белков и низкомолекулярных вторичных посредников с их мишенями). Понятие об адаптерных взаимодействиях и модульных белках, их обеспечивающих. Разнообразие адаптерных белков и их модульных доменов: домены узнавания модифицирующих групп, консенсусных белковых последовательностей, фосфолипидов, междоменные взаимодействия.</p> <p>Принципы рецептор-зависимой передачи сигнала внутрь клетки. Композиция и основные характеристики элементов сигнальных систем – сигнальных каскадов клетки. Рецепторный, мембранный, и цитоплазматический уровни, их общие черты и различия. Два основных молекулярных механизма передачи сигнала с участием ферментативных реакций и белок-белковых взаимодействий за счет адаптерных белков. Понятие о селективности и умножении при передаче сигнала, механизмы их реализации. Понятие о вторичных посредниках, их основные представители и разнообразие способов действия. Эволюционный консерва-</p>

			<p>тизм наиболее значимых сигнальных каскадов.</p> <p>Принцип перекрестных взаимовлияний сигнальных каскадов (cross-talk). Понятие о сигнальных цепях и сигнальных сетях. Использование общих сигнальных цепей разными рецепторами для достижения биологического эффекта. Принцип сходимости сигнальных каскадов.</p>
3.	ОК-1, ОПК-2, ОПК-5, ПК-13	Рецепторы и ферменты как молекулярные мишени лекарственных препаратов	<p>Ингибиторы/эффекторы действия ферментов и транспортных систем. Обратимое и необратимое ингибирование. Конкурентные, неконкурентные, бесконкурентные, аллостерические ингибиторы. Смешанные типы ингибирования. Взаимозависимые и взаимонезависимые ингибиторы. Агонисты/антагонисты рецепторов. Методы экспериментального изучения действия ингибиторов/эффекторов действия ферментов и транспортных систем, агонистов/антагонистов рецепторов. Типичные ошибки при проведении экспериментальных исследований и интерпретации экспериментальных данных. Анализ конкретных примеров (успехов и неудач) при создании лекарственных препаратов на основе ингибиторов ферментов.</p> <p>Лабораторные методы измерения связывания лиганда с рецептором в условиях <i>in vitro</i> и в клеточных системах. Преимущество и недостатки стандартных методов Скэтчарда и Лайнуивера-Берка при определении параметров связывания агониста. Специфическое и неспецифическое связывание. Измерение скоростей связывания и диссоциации лиганда. Определение кооперативности связывания лиганда.</p>

**5. Общая трудоемкость дисциплины: 2 зачетных единицы (72 часа).**