

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

УТВЕРЖДАЮ

Декан химического факультета,  
акад. РАН, профессор



/В.В. Лунин/

«30» мая 2014 г.

**РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)**  
**Методы скрининга биологически активных веществ**

**Уровень высшего образования:**  
Подготовка кадров высшей квалификации

---

**Направление подготовки (специальность):**  
04.06.01 Химические науки

**Направленность (профиль) ОПОП:**  
Медицинская химия

**Форма обучения:**  
очная

---

Рабочая программа рассмотрена и одобрена  
Учебно-методической комиссией факультета  
(протокол №4 от 29.05.2014)

Москва 2014

Рабочая программа дисциплины разработана в соответствии с самостоятельно установленным МГУ образовательным стандартом (ОС МГУ) для реализуемых основных профессиональных образовательных программ высшего образования по направлению подготовки 04.06.01 «Химические науки» на основе Образовательного стандарта, самостоятельно установленного МГУ имени М.В.Ломоносова (далее – ОС МГУ), утвержденного Приказом № 552 от 23.06.2014 г. по МГУ с учетом изменений в ОС МГУ, внесенных Приказом №831 по МГУ от 31.08.2015 г..

Год (годы) приема на обучение 2014/2015, 2015/2016, 2016/2017, 2017/2018,  
2018/2019, 2019/ 2020

1. Наименование дисциплины (модуля): **Методы скрининга биологически активных веществ**

Цели освоения дисциплины: формирование углубленных представлений об основных принципах исследования, методах и критериях оценки биологического действия химических соединений.

Задачи освоения дисциплины:

1) Формирование представлений об основных принципах исследования, методах и критериях оценки биологического действия химических соединений-прототипов лекарств с учетом взаимосвязи с органической и неорганической медицинской химией, биохимией, цитологией, фармакологией.

2) Формирование у студентов базовых знаний о биологических объектах, на которые направлено действие создаваемых химиками 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)

<b>Формируемые компетенции (код компетенции)</b>	<b>Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю)</b>
<b>СПК-1.</b> Способность анализировать эмпирические соотношения структура-активность и прогнозировать возможности взаимодействия определенных химических соединений с предполагаемой биологической мишенью	<b>Знать</b> основные методы и критерии оценки физиологической активности химических соединений <b>Уметь</b> выбирать и использовать методы оценки физиологической активности вещества в соответствии с классом химического соединения <b>Владеть</b> основными навыками применяемыми для установления механизма действия веществ на примере модельных процессов и реакций

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 70 часов составляет контактная работа студента с преподавателем (48 часов занятия лекционного типа, 18 часов занятия семинарского типа, 4 часа - мероприятий текущего контроля успеваемости и промежуточной аттестации), 38 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, неорганической химии, аналитической химии, химических основ биологических процессов  
 Уметь: применять знания по основным химическим и биохимическим дисциплинам для освоения методов скрининга биологически активных веществ

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
Основные понятия: скрининг, биологические системы, методы в экспериментальной биологии. Связь с органической и неорганической медицинской химией, биохимией, цитологией, фармаколо-	10	4	2				6			4

гией.										
Системы, используемые в биологическом скрининге: линии животных клеток, первичные культуры, лабораторные животные. Принципы подбора адекватных моделей в зависимости от терапевтической направленности испытуемых химических соединений.	<b>18</b>	10	4				14			4
Понятие о биологической мишени химических соединений. Многообразие мишеней. Специфичность мишеней и подходы к ее повышению. Эвристический и мишень-направленный скрининг.	<b>20</b>	12	4				16			4
. Методы биологического скрининга. Понятия об эффекте биологического действия и терапевтическом “окне” эффекта. Воспроизводимость результатов и погрешность при скрининге.	<b>18</b>	10	4				14			4
Особенности скрининга важнейших терапевтических групп соединений: противоопухолевых, противомикробных, сердечно-сосудистых.	<b>20</b>	12	4				16			4

Промежуточная аттестация, зачет	22					4				18
<b>Итого</b>	<b>108</b>	48	18			4	<b>70</b>			<b>38</b>

#### 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.

#### 10. Ресурсное обеспечение:

- Перечень основной и вспомогательной учебной литературы ко всему курсу

##### **Основная литература**

1. Конспект лекций.
2. Альбертс Б. и др. Молекулярная биология клетки. В 3 т. Пер. с англ. М., 2013.
3. Введение в молекулярную биологию. От клеток к атомам. Пер.с англ.под ред. Ю.С. Лазуркина и В.А.Ткачука. М., 2002.
4. Афанасьев Ю.И., Юрина Н.А., Котовский Е.Ф. Гистология, цитология и эмбриология. М., 2002.
5. Миронов А.Н., Бунатян Н.Д. и др. Руководство по проведению доклинических исследований лекарственных средств. М., 2012.

##### **Дополнительная литература**

1. Oxford Textbook of Oncology. Eds.: D. Kerr, D. Haller, C. J. H. van de Velde, M. Baumann. 3d edition; 2016.
2. Biotechnology of Bioactive Compounds: Sources and Applications. V. K. Gupta, M. G. Tuohy, A. O'Donovan, M.Lohani. 2015, Wiley-Blackwell, 736 p.
3. Bioactive natural products. Detection, isolation and structural determination. Colegate S.M., Molyneus R.J., Eds. 2008, CRC Press.

##### **Периодическая литература**

1. Journal of Medicinal Chemistry
2. Journal of Medicinal Chemistry Letters
3. Bioorganic and Medicinal Chemistry
4. Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters
5. Chemical Reviews
6. Angewandte Chemie International Edition
7. Journal of Organic Chemistry
8. Chemistry - A European Journal
9. Chemical Communications
10. Chemical Science
11. Organic Letters
12. Nature Chemistry

Для всех перечисленных изданий открыт доступ с сервера химического факультета МГУ

- Перечень используемых информационных технологий, используемых при осуществлении образовательного процесса, включая программное обеспечение, информационные справочные системы (при необходимости):

#### **Интернет-ресурсы**

1. Potential Drug Target Database <http://www.dddc.ac.cn/pdtd/>
2. Therapeutic Target Database [https://en.wikipedia.org/wiki/Therapeutic\\_Targets\\_Database](https://en.wikipedia.org/wiki/Therapeutic_Targets_Database)
3. ChEMBL database <http://nar.oxfordjournals.org/content/40/D1/D1100.long>

- Описание материально-технической базы.

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

11. Язык преподавания – русский

12. Преподаватели:

Доктор биологических наук, Штиль Александр Альбертович, кафедра медицинской химии и тонкого органического синтеза химического факультета МГУ имени М.В.Ломоносова, e-mail: [shtilaa@yahoo.com](mailto:shtilaa@yahoo.com), телефон (495)-939-38-64

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

1. Планируемые результаты обучения приведены в п.5.
2. Материалы к текущей (контрольные работы, вопросы к коллоквиумам и пр.), промежуточной аттестации (вопросы к зачету)

### **1. Образец лекционной контрольной работы.**

1. Образец лекционной контрольной №1 работы по теме: «Системы, используемые в биологическом скрининге: линии животных клеток, первичные культуры, лабораторные животные. Принципы подбора адекватных моделей в зависимости от терапевтической направленности испытуемых химических соединений».

**Задание 1.** Приведите примеры линий клеток разного тканевого происхождения, используемые для скрининга химических соединений-кандидатов в противоопухолевые лекарства.

**Задание 2.** Приведите примеры различий эффекта одного и того же химического соединения для опухолевых и неопухолевых клеток. Каковы возможные молекулярные механизмы причины таких различий?

**Задание 3.** Дайте примеры линий лабораторных мышей, используемых для скрининга. Укажите не менее двух условий этического обращения с экспериментальными животными.

2. Образец лекционной контрольной работы №2 по теме: «Понятие о биологической мишени химических соединений. Многообразие мишеней. Специфичность мишеней и подходы к ее повышению. Эвристический и мишень-направленный скрининг».

**Задание 1.** Дайте определение внутриклеточной мишени действия испытуемого химического соединения (по выбору). Что такое аффинность соединения к мишени?

**Задание 2.** Приведите примеры высокой специфичности соединения к мишени и «вырожденности» (множественности) мишеней.

**Задание 3.** Укажите сходства и различия эвристического скрининга и мишень-направленного подхода?

**2.. Образец домашнего задания по разделу «Понятие о биологической мишени химических соединений. Многообразие мишеней. Специфичность мишеней и подходы к ее повышению. Эвристический и мишень-направленный скрининг».**



Аспирант готовит и представляет на семинаре доклад о создании конкретного лекарственного препарата, выпущенного на рынок в последние годы. В докладе особый акцент делается на биологическую мишень лекарственного препарата и методы скрининга полученного соединения.

#### **4. Вопросы для зачета.**

1. Цель биологического скрининга. Основные виды скрининга: эвристический, мишень-направленный. Высокопроизводительный скрининг, его особенности.
2. Понятие о биологическом эффекте химических соединений. Экспериментальные системы для оценки этих эффектов. Понятие о линиях опухолевых клеток и первичных культурах неопухолевых клеток. Примеры линий клеток разного тканевого происхождения для скрининга противоопухолевых соединений.
3. Лабораторные животные. Этические требования и законодательная база для работы с экспериментальными животными. Скрининг ин виво: результаты и интерпретация. Примеры моделей животных для скрининга соединений отдельных терапевтических групп.
4. Понятие о терапевтическом “окне” биологического эффекта химических соединений. Примеры различий эффекта одного и того же химического соединения для опухолевых и неопухолевых клеток.
5. Понятие о внутриклеточных мишенях действия химических соединений. Уникальность и множественность мишеней.
6. Специфичность химических соединений к внутриклеточной мишени и подходы к оптимизации взаимодействия “соединение-мишень”.
7. Методы скрининга в культурах клеток. Критерии оценки результатов. Статистическая оценка и возможности интерпретации результатов.
8. Алгоритм продвижения химического соединения от первичного скрининга к доклиническим испытаниям. Лидерные химические соединения.
9. Экспериментальные модели для скрининга противоопухолевых и противомикробных соединений: сходства и отличия требований, интерпретация результатов.
10. Экспериментальные модели для скрининга соединений-кандидатов в препараты для терапии сердечно-сосудистых болезней и диабета. Интерпретация результатов тестирования.

**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».

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

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