

Программа утверждена на заседании
Ученого Совета химического факультета
Протокол № 4 от 29 мая 2014 г.

Рабочая программа дисциплины (модуля)

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)

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

	<p>областях.</p> <p>В2 (УК-1) ВЛАДЕТЬ: навыками критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях.</p>
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	<p>35 (ПК-14) Знать основные методы и критерии оценки физиологической активности химических соединений</p> <p>У3 (ПК-14) Уметь выбирать и использовать методы оценки физиологической активности вещества в соответствии с классом химического соединения</p> <p>В3 (ПК-14) Владеть основными навыками применяемыми для установления механизма действия веществ на примере модельных процессов и реакций</p>

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, 8 часов - 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, фармакологией.	10	4	2			2	6			4
Системы, используемые в биологическом скрининге: линии животных клеток, первичные куль-	18	10	4			2	14			4

туры, лабораторные животные. Принципы подбора адекватных моделей в зависимости от терапевтической направленности испытуемых химических соединений.										
Понятие о биологической мишени химических соединений. Многообразие мишеней. Специфичность мишеней и подходы к ее повышению. Эвристический и мишень-направленный скрининг.	20	12	4				16			4
. Методы биологического скрининга. Понятия об эффекте биологического действия и терапевтическом "окне" эффекта. Воспроизводимость результатов и погрешность при скрининге.	18	10	4				14			4
Особенности скрининга важнейших терапевтических групп соединений: противоопухолевых, противoinфекционных, сердечно-сосудистых.	20	12	4				16			4
Промежуточная аттестация, зачет	22						4			14
Итого	108	48	18			8	74			34

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
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, телефон (495)-939-38-64

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 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». Ведомость приема зачета подписывается членами комиссии.

Приложение 1.

Оценочные средства для промежуточной аттестации по дисциплине «Методы синтеза физиологически активных веществ с гетероциклическими фрагментами» на основе карт компетенций выпускников

РЕЗУЛЬТАТ ОБУ- ЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)	КРИТЕРИИ ОЦЕНИВАНИЯ РЕЗУЛЬТАТА ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю) и ШКАЛА оценивания					ПРОЦЕДУРЫ ОЦЕНИВА- НИЯ*
	1	2	3	4	5	
31 (УК-1) ЗНАТЬ: методы критическо- го анализа и оценки современных науч- ных достижений, а также методы гене- рирования новых идей при решении исследовательских и практических задач, в том числе в меж- дисциплинарных областях	Отсутствие зна- ний о современ- ных достижен- иях медицинской химии	Фрагментар- ные знания о современных достижениях медицинской химии	Неполные знания о современных достижениях ме- дицинской химии	Сформированные, но содержащие отдельные пробелы знания о со- временных дос- тижениях меди- цинской химии	Сформирован- ные системати- ческие знания о современных достижениях медицинской химии.	Зачет в форме индивиду- ального собе- седования
В2 (УК-1) ВЛАДЕТЬ: навыками	Отсутствие на- выков	Фрагментар- ные навыки критического анализа и оценки совре- менных науч- ных достиже- ний и резуль- татов деятель- ности по реше- нию исследова-	Неполные навыки критического анализа и оценки современных на- учных достиже- ний и результатов деятельности по решению иссле- довательских и практических за- дач в области ме-	Сформированные, но содержащие Сформированные отдельные пробелы навыки	Сформирован- ные устойчивые навыки критиче- ского анализа и оценки совре- менных научных достижений и результатов дея- тельности по решению иссле- довательских и	Зачет в форме индивиду- ального собе- седования

		тельных и практических задач в области медицинской химии	дицинской химии.		практических задач в области медицинской химии	
31(УК-2) ЗНАТЬ: методы научно-исследовательской деятельности.	Отсутствие знаний о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии	Фрагментарные знания о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии.	Неполные знания о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии.	Сформированные, но содержащие отдельные пробелы знания о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии.	Сформированные систематические знания о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии.	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 области медицинской химии	В целом успешное, но не систематическое умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования в области медицинской химии	В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования в области медицинской химии	Успешное и систематическое умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования в области медицинской химии	Письменное решение задач
35 (ПК-14) Знать основные методы и критерии оценки физиологической активности химических соединений	Отсутствие знаний	Фрагментарные представления о методах и критериях оценки физиологической активности хи-	В целом успешные, но не систематические представления о методах и критериях оценки физиологической актив-	В целом успешные, но содержащие отдельные пробелы, представления о методах и критериях оценки физиоло-	Сформированные представления о методах и критериях оценки физиологической активности химических со-	Оценочные средства текущего контроля - контрольные работы. Оценочные сред-

		мических соединений	ности химических соединений	гической активности химических соединений	единений	ства промежуточного контроля - зачет по дисциплине.
УЗ (ПК-14) Уметь выбирать и использовать методы оценки физиологической активности вещества в соответствии с классом химического соединения	Отсутствие умений	Фрагментарное использование умения выбирать и использовать методы оценки физиологической активности вещества в соответствии с классом химического соединения	В целом успешное, но не систематическое умение выбирать и использовать методы оценки физиологической активности вещества в соответствии с классом химического соединения	В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы использование умения выбирать и использовать методы оценки физиологической активности вещества в соответствии с классом химического соединения	Сформированное умение выбирать и использовать методы оценки физиологической активности вещества в соответствии с классом химического соединения	Оценочные средства текущего контроля - контрольные работы. Оценочные средства промежуточного контроля - зачет по дисциплине.
ВЗ (ПК-14) Владеть основными навыками, применяемыми для установления механизма действия веществ на примере модельных процессов и реакций	Отсутствие навыков	Фрагментарное применение навыков работы с основными методами, применяемыми для установления механизма действия веществ на примере модельных процессов и реакций	В целом успешное, но не систематическое применение навыков работы с основными методами, применяемыми для установления механизма действия веществ на примере модельных процессов и реакций	В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы применение навыков работы с основными методами, применяемыми для установления механизма действия веществ на примере модельных процессов и реакций	Успешное и систематическое применение навыков работы с основными методами, применяемыми для установления механизма действия веществ на примере модельных процессов и реакций	Оценочные средства текущего контроля - контрольные работы. Оценочные средства промежуточного контроля - зачет по дисциплине.

