

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

УТВЕРЖДАЮ  
Декан химического факультета,  
Чл.-корр. РАН, профессор



/С.Н. Калмыков/  
«31» августа 2021 г.

**РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)**

**Методы скрининга в медицинской химии**

**Уровень высшего образования:**

Специалитет

---

**Направление подготовки (специальность):**

04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия

**Направленность (профиль) ОПОП:**

Медицинская химия и тонкий органический синтез

**Форма обучения:**

очная

---

Рабочая программа рассмотрена и одобрена  
Учебно-методической комиссией факультета  
(протокол №7 от 07.07.2021)

Москва 2021

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 / специальности 04.05.01 «Фундаментальная и прикладная химия» (программа специалитета), утвержденного приказом МГУ от 29 декабря 2018 года № 1770 (с изменениями по приказу № 1109 от 11.09.2019).

Год (годы) приема на обучение 2019/2020, 2020/2021, 2021/2022

1. Место дисциплины (модуля) в структуре ООП: вариативная часть ООП, блок ПД.
2. Планируемые результаты обучения по дисциплине, соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы (компетенциями выпускников). Соответствие результатов обучения по данному элементу ОПОП результатам освоения ОПОП (в форме компетенция – индикатор - ЗУВ) указано в Общей характеристике ОПОП.

Компетенция	Индикатор достижения	Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю)
<p><b>СПК-1.С.</b> Способен применять основные принципы конструирования лекарственных веществ для оптимизации физиологической активности структурных прототипов лекарств и улучшения их фармакокинетических характеристик</p>	<p><b>СПК-1.С.1</b> предлагает способы оптимизации физиологической активности структурных прототипов лекарств и улучшения их фармакокинетических характеристик</p>	<p><b>Знать:</b> современную стратегию мишень-направленного поиска и тестирования прототипов лекарственных соединений и ее принципиальное отличие от традиционного поиска лекарственных средств.</p> <p><b>Уметь:</b> выдвигать концепции направленной структурной модификации соединения-лидера на основе знаний о взаимодействии химических соединений с конкретными биомишенями.</p> <p><b>Владеть:</b> методами оценки эффективности соединений-лидеров в биологических испытаниях на клеточных моделях и <i>in vivo</i>.</p>
<p><b>СПК-3.С.</b> Способен выбирать методы синтеза и определения физиологической активности веществ <i>in vivo</i> и <i>in vitro</i> и интерпретировать результаты биотестирования</p>	<p><b>СПК-3.С.1</b> проводит сравнительный анализ возможностей разных методов синтеза веществ <i>in vivo</i> и <i>in vitro</i>, предлагает оптимальные методы синтеза и определения физиологической активности</p>	<p><b>Знать:</b> основные методы тестирования биологической активности серий химических соединений, оценивать результаты этих испытаний совместно с биологами и намечать пути оптимизации соединений-лидеров.</p> <p><b>Уметь:</b> устанавливать взаимосвязь между химической структурой лекарственного препарата и его</p>

		биологической мишенью <b>Владеть:</b> основными теоретическими положениями о взаимосвязи структуры лекарства и его биологической мишени
--	--	--

3. Объем дисциплины 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 2 зачетных единицы, всего 72 часа, из которых 32 часов составляет контактная работа студента с преподавателем (14 часов занятия лекционного типа, 14 часа – занятия семинарского типа, 2 часа – групповые консультации, 2 часа – промежуточный контроль успеваемости), 40 часа составляет самостоятельная работа студента.*

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

Обучающийся должен

**Знать:** основные естественнонаучные дисциплины в рамках образовательной программы бакалавра; изучение дисциплин данного модуля опирается, главным образом, на теоретические знания в области органической химии, общей биологии и биохимии.

**Уметь:** пользоваться химической и биологической литературой и современными интернет-ресурсами.

**Владеть:** базовыми навыками работы с компьютерными программами.

5. 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 и т.п..	Всего
<b>Раздел 1.</b> Основные понятия: скрининг, биологические системы, методы в экспериментальной биологии. Связь с органической и неорганической медицинской химией, биохимией, цитологией, фармакологией.	<b>12</b>	2	2				<b>4</b>			<b>8</b>

<p><b>Раздел 2.</b> Системы, используемые в биологическом скрининге: линии животных клеток, первичные культуры, лабораторные животные. Принципы подбора адекватных моделей в зависимости от терапевтической направленности испытуемых химических соединений.</p>	<b>21</b>	4	4	1			<b>9</b>				<b>12</b>
<p><b>Раздел 3.</b> Понятие о внутриклеточных мишенях действия химических соединений. Уникальность и множественность мишеней. Специфичность соединений к мишени и подходы к оптимизации взаимодействия “соединение-мишень”.</p>	<b>18</b>	4	4				<b>8</b>				<b>10</b>

<b>Раздел 4.</b> Методы скрининга в культурах клеток и на моделях лабораторных животных. Критерии оценки результатов. Статистическая оценка и возможности интерпретации результатов. Лидерные химические соединения. Высокопроизводительный скрининг.	<b>10</b>	2	2	1			<b>5</b>			<b>5</b>
<b>Раздел 5.</b> Особенности скрининга важнейших терапевтических групп соединений: противоопухолевых, противомикробных, сердечно-сосудистых.	9	2	2				<b>4</b>			<b>5</b>
Промежуточная аттестация <u>зачет</u>	2					2	<b>2</b>			
<b>Итого</b>	<b>72</b>	<b>14</b>	<b>14</b>	<b>2</b>		<b>2</b>	<b>32</b>			<b>40</b>

*\* Текущий контроль проводится в рамках лекционных занятий*

#### **6. Образовательные технологии:**

- применение компьютерных симуляторов, обработка данных на компьютерах, использование компьютерных программ, управляющих приборами;
- использование средств дистанционного сопровождения учебного процесса;
- преподавание дисциплин в форме авторских курсов по программам, составленным на основе результатов исследований научных школ МГУ.

## 7. Учебно-методические материалы для самостоятельной работы по дисциплине (модулю):

1. И. Бертини, Г. Грей, Э. Стифель, Дж. Валентине. Биологическая неорганическая химия: структура и реакционная способность: в 2 т.; пер. с англ. – М.: Бином. Лаборатория знаний, 2013. 1057 с.

## 8. Ресурсное обеспечение:

- Перечень основной и вспомогательной учебной литературы ко всему курсу

### *Основная литература:*

1. Вергейчик Т. Х. Токсикологическая химия. Под редакцией проф. Е. Н. Вергейчика. Москва, “МЕДпресс-информ” 2012. 3-е изд., переработанное и дополненное.
2. Гаврилов А.С. Фармацевтическая технология: изготовление лекарственных препаратов: учебник. Москва: ГЭОТАР-Медиа, 2010. - 618 с.
3. Аллен Л.В., Гаврилов А. С. Изготовление лекарственных препаратов: учеб. пособие. Москва : ГЭОТАР-Медиа, 2014. - 512 с.
4. Галкина И. В. Основы химии биологически активных веществ: учебное пособие. Изд-во Казанского государственного университета, 2009. - 151 с.
5. Коваленко Л. В. Биохимические основы химии биологически активных веществ. М., “Бином. Лаборатория знаний”, 2010. 228 с.
6. Миронов А.Н., Бунатян Н.Д. и др. Руководство по проведению доклинических исследований лекарственных средств. Москва, 2012.
7. О. А. Реутов, А. Л. Курц, К. П. Бутин. Органическая химия. В 4-х томах. Москва. Бином. Лаборатория знаний. 2021.

### *Дополнительная литература:*

1. Альбертс Б. и др. Молекулярная биология клетки. В 3 т. Пер. с англ. М., 2013.
2. Введение в молекулярную биологию. От клеток к атомам. Пер.с англ.под ред. Ю.С. Лазуркина и В.А.Ткачука. М., 2002.
3. Афанасьев Ю.И., Юрина Н.А., Котовский Е.Ф. Гистология, цитология и эмбриология. М., 2002.
4. *Oxford Textbook of Oncology*. Eds.: D. Kerr, D. Haller, C. J. H. van de Velde, M. Baumann. 3d edition; 2016.
5. *Biotechnology of Bioactive Compounds: Sources and Applications*. [V. K. Gupta](#), [M. G. Tuohy](#), [A. O'Donovan](#), [M.Lohani](#). 2015, Wiley-Blackwell, 736 p.
6. *Bioactive natural products. Detection, isolation and structural determination*. Colegate S.M., Molyneus R.J., Eds. 2008, CRC Press.

### *Периодическая литература:*



1. Nature Reviews in Cancer
2. Science Translational Medicine
3. Journal of Medicinal Chemistry
4. Bioorganic and Medicinal Chemistry
5. Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters
6. European Journal of Medicinal Chemistry
7. Journal of Organometallic Chemistry
8. Organometallics
9. Oncogene
10. Oncotarget
11. Acta Naturae

*Интернет-ресурсы:*

Potential Drug Target Database <http://www.dddc.ac.cn/pdtd/>

Therapeutic Target Database [https://en.wikipedia.org/wiki/Therapeutic\\_Targets\\_Database](https://en.wikipedia.org/wiki/Therapeutic_Targets_Database)

ChEMBL database <http://nar.oxfordjournals.org/content/40/D1/D1100.long>

Материально-техническое обеспечение: специальных требований нет, занятия проводятся в обычной аудитории, оснащенной доской и мелом (маркерами)

**9. Язык преподавания** – русский

**10. Преподаватель:** д.м.н., с.н.с. Штиль Александр Альбертович.

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

Образцы оценочных средств для текущего контроля усвоения материала и промежуточной аттестации - зачета. На зачете проверяется достижение компетенций (в части ЗУВ) , перечисленных в п.5.

**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.

Понятие о внутриклеточных мишенях действия химических соединений. Уникальность и множественность мишеней.

5. Специфичность химических соединений к внутриклеточной мишени и подходы к оптимизации взаимодействия “соединение-мишень”.

6. Методы скрининга в культурах клеток. Критерии оценки результатов. Статистическая оценка и возможности интерпретации результатов.

7. Алгоритм продвижения химического соединения от первичного скрининга к доклиническим испытаниям. Лидерные химические соединения.

8. Экспериментальные модели для скрининга противоопухолевых и противомикробных соединений: сходства и отличия требований, интерпретация результатов.

9. 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

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	2	3	4	5
Результат				
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 неприципиального 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

РЕЗУЛЬТАТ ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)	ФОРМА ОЦЕНИВАНИЯ
<p><b>Знать:</b> основы современной стратегии создания лекарственных соединений и ее принципиальное отличие от традиционного поиска лекарственных средств</p> <p><b>Знать:</b> основные приемы анализа закономерностей «структура – активность» в рядах аналогов соединения-лидера</p>	мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на зачете
<p><b>Уметь:</b> выдвигать концепции направленной структурной модификации соединения-лидера</p> <p><b>Уметь:</b> устанавливать взаимосвязь между химической структурой лекарственного препарата и его биологической мишенью</p>	мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на зачете
<p><b>Владеть:</b> подходами и методами модификации соединения-лидера для синтеза мишень-направленных соединений</p> <p><b>Владеть:</b> навыками интерпретации результатов биотестирования из научных статей</p> <p><b>Владеть:</b> основными теоретическими положениями о взаимосвязи структуры лекарства и его биологической мишени</p>	мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на зачете