

Федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение высшего образования «Санкт-Петербургский государственный химико-фармацевтический университет» Министерства здравоохранения Российской Федерации

**Аннотация рабочей программы дисциплины
Б1.В.16 Методы органического синтеза**

Направление подготовки:	04.03.01 Химия
Профиль подготовки:	Синтез и анализ органических соединений
Форма обучения:	очная

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

Компетенции, индикаторы и результаты обучения

ПК-ПЗ Способен планировать и осуществлять направленный синтез органических соединений с полезными свойствами под руководством специалиста более высокой квалификации

ПК-ПЗ.1 Планирует синтез органических соединений, учитывая химические свойства функциональных групп и молекулы в целом

Знать:

ПК-ПЗ.1/Зн1 Знать теоретические основы органического синтеза.

ПК-ПЗ.1/Зн2 Знать методы получения функциональных групп.

ПК-ПЗ.1/Зн3 Знать методы преобразования функциональных групп.

Уметь:

ПК-ПЗ.1/Ум1 Уметь осуществлять сбор информации о методах синтеза конкретных органических веществ.

ПК-ПЗ.2 Выбирает рациональные условия проведения органического синтеза биологически активных веществ

Знать:

ПК-ПЗ.2/Зн1 Знать достоинства и недостатки различных методов органического синтеза друг перед другом

ПК-ПЗ.2/Зн2 Знать основные приемы и методы работы при осуществлении синтеза органических веществ, в том числе биологически активных

Уметь:

ПК-ПЗ.2/Ум1 Уметь находить взаимосвязь между условиями и эффективностью органического синтеза.

ПК-ПЗ.2/Ум2 Уметь осуществлять выбор между различными методами получения органического вещества.

ПК-ПЗ.3 Способен осуществлять направленный синтез органических соединений с заданным набором свойств в рамках поставленной задачи

Знать:

ПК-ПЗ.3/Зн1 Знать методы построения С-С связей.

ПК-ПЗ.3/Зн2 Знать методы построения гетероциклических систем.

ПК-ПЗ.3/Зн3 Знать принципы построения моделей в хемоинформатике

ПК-ПЗ.3/Зн4 Знать основные программные продукты для молекулярного моделирования

ПК-ПЗ.3/Зн5 Знать основные методы молекулярного моделирования

Уметь:

ПК-ПЗ.3/Ум1 Уметь осуществлять анализ информации о методах органического синтеза.

ПК-ПЗ.3/Ум2 Уметь выполнять прогнозирование свойств органических соединений

ПК-ПЗ.3/Ум3 Уметь выполнять виртуальный скрининг биологической активности

ПК-ПЗ.3/Ум4 Уметь решать типовые задачи молекулярного моделирования

Владеть:

ПК-ПЗ.3/Нв1 Владеть основными методами выделения и очистки органических веществ

ПК-ПЗ.3/Нв2 Владеть основными методами получения и превращения функциональных групп

ПК-ПЗ.4 Выполняет материальные расчёты при осуществлении органического синтеза биологически активных веществ

Знать:

ПК-ПЗ.4/Зн1 Знать показатели эффективности процесса органического синтеза

Уметь:

ПК-ПЗ.4/Ум1 Уметь определять показатели эффективности процесса органического синтеза

Владеть:

ПК-ПЗ.4/Нв1 Владеть навыками материального расчета при осуществлении органического синтеза

Место дисциплины в структуре ОП

Дисциплина (модуль) Б1.В.16 «Методы органического синтеза» относится к формируемой участниками образовательных отношений части образовательной программы и изучается в семестре(ах): 7, 8.

Последующие дисциплины (практики) по связям компетенций:

Б1.В.18 Основы компьютерного моделирования в органической химии;

Б3.01(Д) Подготовка к защите и защита выпускной квалификационной работы;

Б2.В.02(Пд) производственная практика (преддипломная практика);

В процессе изучения дисциплины студент готовится к видам профессиональной деятельности и решению профессиональных задач, предусмотренных ФГОС ВО и образовательной программой.

2. Содержание разделов, тем дисциплин

Раздел 1. Теоретические основы органического синтеза.

Тема 1.1. Вводная лекция. Теоретические основы органического синтеза.

Основная практическая задача химии. Цели и задачи органического синтеза. Понятия выхода, диссипационных, массообменных и химических потерь, степени конверсии и селективности. Хемо-, регио- и стереоселективность. Линейная и конвергентная схемы построения синтеза. Основные понятия ретросинтетического анализа.

Раздел 2. Методы получения и превращение функциональных групп.

Тема 2.1. Методы построения кратных связей и введения неуглеродных функциональных групп.

Методы построения кратных связей: элиминирование воды и галогеноводородов, син-элиминирование. Методы присоединения галогенов, галогеноводородов и воды по кратным связям.

Тема 2.2. Реакции нуклеофильного замещения в ароматическом и алифатическом ряду.

Электрофильное замещение в ряду аренов и карбонильных соединений: основные закономерности, методы сульфирования, нитрования, галогенирования, нитрозирования и азосочетания.

Нуклеофильное замещение в sp^3 -гибридного атома углерода: основные закономерности, методы замены ОН-групп на галогены, методы О-алкилирования воды, спиртов и фенолов, методы N-алкилирования аммиака и аминов, реакции с амбидентными нуклеофилами.

Нуклеофильное замещение в ароматическом ряду: основные закономерности, методы замены ОН-групп на галогены, методы замены галогена на О- и N-нуклеофилы, методы замены сульфо- и диазогрупп.

Тема 2.3. Реакции нуклеофильного присоединения и замещения у карбонильного атома углерода.

Нуклеофильное присоединение у карбонильного атома углерода и по активированным кратным связям: основные закономерности, методы присоединения воды, спиртов, аминов и др. азотистых соединений.

Нуклеофильное замещение у карбонильного атома углерода: основные закономерности, взаимопревращение ацилирующих агентов, методы О- и N-ацилирования.

Тема 2.4. Методы окисления и восстановления функциональных групп.

Методы восстановления функциональных групп: специфические методы восстановления нитрогрупп, карбонильных и сложноэфирных групп. Восстановление гидридами металлов. Каталитическое гидрирование. Восстановительное аминирование.

Методы окисления функциональных групп: окисление двойных связей с разрывом и без разрыва цепи, эпоксидирование. Окисление аренов и их боковых цепей. Окисление спиртов до карбонильных и карбоксильных соединений.

Тема 2.5. Методы получения и превращения функциональных групп.

Комплексное рассмотрение материала тем 2.1-2.4. Написание вопросов билета контрольной работы № 1 и устная защита билета.

Раздел 3. Методы построения С-С связей.

Тема 3.1. Методы С-ацилирования и С-алкилирования аренов и СН-кислотных соединений.

Методы С-ацилирования и С-алкилирования аренов: выбор ацилирующих и алкилирующих агентов, выбор катализатора. Формилирование и карбоксилирование аренов. Гидрокси-, amino- и галогенометиление аренов, реакция Манниха.

Методы С-ацилирования и С-алкилирования СН-кислотных соединений: синтезы на основе ацетоуксусного и малонового эфиров, алкилирование и ацилирование енаминов. Алкилирование ацетиленов и циановодорода.

Тема 3.2. Построение С-С связей с использованием реакций конденсации.

Реакции конденсации: механизм, выбор условий. Альдольно-кетоновая конденсация, реакция Анри. Присоединение к активированным двойным связям. Конденсации Кляйзена, Перкина и Кневенагеля. Бензоиновая конденсация и бензиловая перегруппировка. Использование фосфор- и металлорганических соединений. Олефинирование по Виттигу и Хорнеру. Магнийорганический синтез, реактивы Гриньяра: границы применения, выбор условий. Литий- и цинкорганический синтез. Металлопромотируемые процессы: реакции Хека, Сузуки и Соногаширы.

Тема 3.3. Построение С-С связей с использованием элементарных реагентов и перициклических реакций.

Построение С-С связей с использованием перициклических реакций.

Тема 3.4. Методы построения С-С связей.

Комплексное рассмотрение материалов тем 3.1-3.3. Написание вопросов билета контрольной работы № 2 и устная защита билета.

Раздел 4. Методы построения гетероциклических систем.

Тема 4.1. Построение пятичленных гетероциклических систем.

Основные схемы построения гетероциклических систем.

Синтезы пятичленных гетероциклов. Синтез Паалля-Кнорра, пирролов по Кнорру и Ганчу, фуранов по Файсту-Бенари, индолов по Фишеру. Синтез пиразолов и оксазолов по Кнорру, имидазолов по Дебу, тиазолов и оксазолов по Ганчу, бензимидазолов из о-фенилендиамин. Синтез тетразолов.

Тема 4.2. Построение шестичленных гетероциклических систем.

Синтезы шестичленных гетероциклов. Синтез пиридинов по Ганчу, хинолинов по Дебнеру-Миллеру и Скраупу, изохинолинов по Бишлеру-Напиральскому. Синтез кумаринов из салициловой кислоты, из фенолов по Пехману, хромонов из о-ацилфенолов. Синтезы пиримидинов посредством (3+3)-циклоконденсации. Синтез пуринов по Траубе. Синтезы шестичленных гетероциклов. Синтез пиридинов по Ганчу, хинолинов по Дебнеру-Миллеру и Скраупу, изохинолинов по Бишлеру-Напиральскому. Синтез кумаринов из салициловой кислоты, из фенолов по Пехману, хромонов из о-ацилфенолов. Синтезы пиримидинов посредством (3+3)-циклоконденсации. Синтез пуринов по Траубе.

Тема 4.3. Методы построения гетероциклических систем.

Комплексное рассмотрение материалов тем 4.1-4.2. Написание вопросов билета контрольной работы № 3 и устная защита.

Раздел 5. Планирование и осуществление органического синтеза.

Тема 5.1. Техника безопасности и методы работы в лаборатории органического синтеза

Прохождение инструктажа по технике безопасности. Обсуждение основных приемов и методов работы при синтезе органических веществ

Тема 5.2. Методика выполнения расчетов в синтезе органических соединений

Обсуждение методики выполнения расчетов и заполнения отчета по лабораторной работе, а также параметров эффективности процесса синтеза.

Проведение тестирования по теме "Техника безопасности и методы расчета органического синтеза".

Тема 5.3. Электрофильное присоединение и замещение

Выполнение лабораторной работы по описанной методике.

Тема 5.4. Нуклеофильное замещение в ароматическом и алифатическом ряду.

Выполнение лабораторной работы по описанной методике.

Тема 5.5. Нуклеофильное присоединение и замещение в карбонильных соединениях.

Выполнение лабораторной работы по описанной методике.

Тема 5.6. Окисление и восстановление функциональных групп.

Выполнение лабораторной работы по описанной методике.

Тема 5.7. Образование C-C связей посредством реакций конденсации.

Выполнение лабораторной работы по описанной методике.

Тема 5.8. Планирование и осуществление органического синтеза.

Представление отчетов по лабораторным работам 7 семестра и их устная защита по вопросам преподавателя.

Тема 5.9. Индивидуальный проект 1 «Планирование многостадийного синтеза».

Выполнение и оформление индивидуального проекта 1 по теоретической разработке многостадийного синтеза органического соединения по темам, являющимся теоретической основой для дальнейшего выполнения индивидуального проекта 2 .

Тема 5.10. Методы получения оптически чистых веществ: энантиоселективный синтез и разделение антиподов.

Обсуждение существующих подходов и методов к синтезу и выделению оптически чистых веществ.

Тема 5.11. Методы пептидного синтеза.

Обсуждение существующих подходов и методов к пептидному синтезу и активации карбоксильных групп.

Тема 5.12. Методы введения защитных групп.

Обсуждение существующих методов введения защитных групп и их снятия.

Тема 5.13. Применение ретросинтетического анализа в планировании синтеза сложных органических веществ.

Обсуждение способов и методов ретросинтетического анализа и применения их в органическом синтезе.

Тема 5.14. Лабораторная работа 1.

Выполнение лабораторной работы в соответствии с индивидуальным заданием проекта 1+2.

Тема 5.15. Лабораторная работа 2.

Выполнение лабораторной работы 2 в соответствии с индивидуальным заданием проекта 1+2.

Тема 5.16. Лабораторная работа 3.

Выполнение лабораторной работы 3 в соответствии с индивидуальным заданием проекта 1+2.

Тема 5.17. Лабораторная работа 4.

Выполнение лабораторной работы 4 в соответствии с индивидуальным заданием 1+2.

Тема 5.18. «Выполнение многостадийного синтеза» (индивидуальный проект 2).

Представление и устная защита выполненного и оформленного индивидуального проекта 2.

Объем дисциплины и виды учебной работы

Период	Лекции (часы)	Семестровые экзамены (СЭ)	Лабораторная работа (всего)	Итого в период (часы)	Итого в период обучения (часы)	Свободные часы	Итого обучения (часы)	Итого занятия (часы)	Итого (часы)	Свободные занятия (часы)	Итого работа (часы)	Итого аттестация (часы)
--------	---------------	---------------------------	-----------------------------	-----------------------	--------------------------------	----------------	-----------------------	----------------------	--------------	--------------------------	---------------------	-------------------------

обучения	Общая гру (ча	Общая гру (ЗІ	Контактн (часы,	Консультац сессии	Консультац теоретического	Контакты на аттестацию в пер	Лабораторн (ча	Лекции	Практическ (ча	Самостоятел. студент	Промежуточн (ча
Седьмой семестр	216	6	140		32	8	32	32	36	76	Зачет
Восьмой семестр	180	5	96	2	30		36		28	59	Экзамен (25)
Всего	396	11	236	2	62	8	68	32	64	135	25

Разработчик(и)

Кафедра органической химии, кандидат химических наук, доцент Чернов Н. М.