

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)
Тактика органического синтеза 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)
СПК-2.С. Способен выдвигать концепции направленной структурной модификации соединения-лидера в зависимости от наличия информации о его молекулярной мишени в организме	СПК-2.С.1 оценивает возможность структурной модификации соединения-лидера на основании имеющейся информации	Знать: основные понятия ретросинтетического анализа, типы стратегий синтеза и важнейшие ретроны. Уметь: выбирать подходящие защитные группы для осуществления запланированного синтеза. Владеть: навыками использования различных ретронов для осуществления ретросинтетического анализа целевой молекулы

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 4 зачетных единицы, всего 144 часа, из которых 84 часа составляет контактная работа студента с преподавателем (36 часов - занятия лекционного типа, 36 часов - занятия семинарского типа, 8 часов – групповые консультации, 4 часа - мероприятия промежуточной аттестации), 60 часов составляет самостоятельная работа учащегося.

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

Обучающийся должен

Знать: основные естественнонаучные дисциплины в рамках образовательной программы бакалавра, главным образом, органическую химию

Уметь: пользоваться химической литературой и современными Интернет-ресурсами

Владеть: базовыми навыками синтеза и анализа органических веществ, 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
Раздел 1. Использование защитных групп.	14	6	6				12	2		2
Раздел 2. Анализ монофункциональных ретронов	18	6	6				12	2	4	6

Раздел 3. Анализ 1,1-, 1,2- и 1,3-бифункциональных ретронов ретронов	20	6	6	2			14	2	4	6
Раздел 4. Анализ 1,4-, 1,5- и 1,6-бифункциональных ретронов ретронов	18	6	6	2			14	2	2	4
Раздел 5. Планирование многостадийных синтезов	18	6	6	2			14		4	4
Раздел 5. Планирование одностадийных синтезов	20	6	6	2			14	2	4	6
Промежуточная аттестация <i>экзамен</i>	36					4	4	32		32
Итого	144	36	36	8		4	84	42	18	60

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):

- Дядченко В. П., Андресюк А. Н., Белоглазкина Е. К., Брусова Г. П. Планирование многостадийных синтезов.

8. Ресурсное обеспечение:

- Перечень основной и вспомогательной учебной литературы ко всему курсу

Основная литература

- В.А. Смит, А. Д. Дильман. Основы современного органического синтеза. Москва. «БИНОМ». 2009.
- Ф. Кери, Р. Сандберг. Углубленный курс органической химии. В 2-х томах. Москва. «Химия». 1981.
- О. А. Реутов, А. Л. Курц, К. П. Бутин. Органическая химия. В 4-х томах. Москва. Бинум. Лаборатория знаний. 2021.
- Дж. Марч. Органическая химия. Реакции, механизмы и структура. В 4-х томах. Москва. «Мир». 1987.
- В. М. Потапов. Стереохимия. Москва. «Химия». 1988.
- Chemical Review, Journal of Organic Chemistry, Tetrahedron, Tetrahedron Letters, Journal of Chemical Society, Journal of Medicinal Chemistry

Дополнительная литература

1. P.G.M. Wuts. Greene's Protective Groups in Organic Synthesis, 5th Edition. John Wiley & Sons. 2014.
2. P. Wyatt, S. Warren. Organic synthesis. Strategy and control. Wiley. 2007.
3. K. C. Nicolaou, E. J. Sorensen. Classics in Total Synthesis. Weinheim, Germany: VCH. 1996.

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

9. Язык преподавания – русский

10. Преподаватели: доцент, к.х.н. Сосонюк Сергей Евгеньевич, доцент, к.х.н. Лозинская Наталья Александровна.

Фонды оценочных средств, необходимые для оценки результатов обучения

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

Вопросы для экзамена:

- Защитные группы. Защита ОН-группы, NH₂-группы, С-Н связей в алкинах, карбонильной и карбоксильной группы. Способы удаления защитных групп. Принципы ортогональной стабильности и модулированной лабильности.
- Анализ одноатомных спиртов: С1-, С2- и С3-ретроны. Подходы к созданию этих ретронов.
- 1,2-Ретрон в β-аминоспиртах и в α-аминокислотах. Анализ этого ретрона путем перехода к 1,1-ретрону на основе эпоксидов, реакций Анри, Штреккера, циангидринного синтеза.

- Внешнее расчленение С3- монокарбонильного ретрона: трансформ Михаэля. Внутреннее расчленение 1,3-ретрона: реакции конденсации.
- Анализ внутреннего расчленения 1,4- и 1,5-ретронов. Сведение 1,4-дикарбонильного ретрона к производным фурана.
- Тактика анализа 1,6-дикарбонильного ретрона на базе енолятов и алкил-3-бромпропилкетонов (синтез этих бромкетонов из β -кетозэфиров). Анализ 6-членных алициклов на базе трансформов “сочленение” (R) и озонлиза.
- Ретросинтетический анализ циклов. Расчленения по стратегическим связям. Кинетические и термодинамические факторы, способствующие реакциям циклизации. Тактика анализа трехчленных циклов на базе диазоалканов и илидов серы. Создание спирановых карбоциклических систем на основе пинаколиновой перегруппировки и перегруппировки спиро-эпоксидов в циклобутаноны.
- Планирование многостадийного синтеза: линейная и конвергентная схемы. Целевая молекула (ТМ), трансформ, синтон, ретрон. Соответствие синтонов и реагентов. Ретроны частичные и полные. Примеры ретронов. Концепция формального альтернирования зарядов в насыщенной алкильной цепи, содержащей на одном из концов акцепторный заместитель (Д. Зеебах). Синтоны “логичные”

Методические материалы для проведения процедур оценивания результатов обучения

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

ШКАЛА И КРИТЕРИИ ОЦЕНИВАНИЯ РЕЗУЛЬТАТА ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)				
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 не принципиального 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>Знать: основные понятия ретросинтетического анализа, типы стратегий синтеза и важнейшие ретроны.</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>
<p>Уметь: анализировать научную литературу с целью выбора направления и методов, применяемых в исследовании по теме выпускной квалификационной работы Уметь: самостоятельно составлять план исследования Уметь: выбирать подходящие защитные группы для осуществления запланированного синтеза.</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>
<p>Владеть навыками поиска, критического анализа, обобщения и систематизации научной информации, постановки целей исследования и выбора оптимальных путей и методов их достижения Владеть: навыками использования различных ретронов для осуществления ретросинтетического анализа целевой молекулы.</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>