

МИНИСТЕРСТВО НАУКИ И ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
Федеральное государственное автономное образовательное учреждение высшего образования
"Казанский (Приволжский) федеральный университет"
Химический институт им. А.М. Бутлерова



УТВЕРЖДАЮ

Проректор по образовательной деятельности КФУ
проф. Таюрский Д.А.

"__" _____ 20__ г.

Программа дисциплины

Методы органического синтеза в медицинской химии

Направление подготовки: 04.04.01 - Химия

Профиль подготовки: Органическая, элементоорганическая и медицинская химия

Квалификация выпускника: магистр

Форма обучения: очное

Язык обучения: русский

Год начала обучения по образовательной программе: 2018

Содержание

1. Перечень планируемых результатов обучения по дисциплине (модулю), соотнесенных с планируемыми результатами освоения ОПОП ВО
2. Место дисциплины (модуля) в структуре ОПОП ВО
3. Объем дисциплины (модуля) в зачетных единицах с указанием количества часов, выделенных на контактную работу обучающихся с преподавателем (по видам учебных занятий) и на самостоятельную работу обучающихся
4. Содержание дисциплины (модуля), структурированное по темам (разделам) с указанием отведенного на них количества академических часов и видов учебных занятий
 - 4.1. Структура и тематический план контактной и самостоятельной работы по дисциплине (модулю)
 - 4.2. Содержание дисциплины (модуля)
5. Перечень учебно-методического обеспечения для самостоятельной работы обучающихся по дисциплине (модулю)
6. Фонд оценочных средств по дисциплине (модулю)
7. Перечень литературы, необходимой для освоения дисциплины (модуля)
8. Перечень ресурсов информационно-телекоммуникационной сети "Интернет", необходимых для освоения дисциплины (модуля)
9. Методические указания для обучающихся по освоению дисциплины (модуля)
10. Перечень информационных технологий, используемых при осуществлении образовательного процесса по дисциплине (модулю), включая перечень программного обеспечения и информационных справочных систем (при необходимости)
11. Описание материально-технической базы, необходимой для осуществления образовательного процесса по дисциплине (модулю)
12. Средства адаптации преподавания дисциплины (модуля) к потребностям обучающихся инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья
13. Приложение №1. Фонд оценочных средств
14. Приложение №2. Перечень литературы, необходимой для освоения дисциплины (модуля)
15. Приложение №3. Перечень информационных технологий, используемых для освоения дисциплины (модуля), включая перечень программного обеспечения и информационных справочных систем

Программу дисциплины разработал(а)(и) профессор, д.н. (профессор) Племенков В.В. (кафедра медицинской химии, Химический институт им. А.М. Бутлерова), VVPlemenkov@kpfu.ru

1. Перечень планируемых результатов обучения по дисциплине (модулю), соотнесенных с планируемыми результатами освоения ОПОП ВО

Обучающийся, освоивший дисциплину (модуль), должен обладать следующими компетенциями:

Шифр компетенции	Расшифровка приобретаемой компетенции
ПК-1	Способен использовать полученные знания теоретических основ современной химии и смежных наук при решении профессиональных задач
ПК-3	Способен анализировать новую научную проблематику, применять методы и средства планирования, организации и проведения научных исследований в выбранной области химии

Обучающийся, освоивший дисциплину (модуль):

Должен знать:

- Ключевые синтетические подходы, применяемые на этапах разработки лекарственных соединений;
- Ключевые подходы к выделению и очистке продуктов и полупродуктов, применяемые на этапах разработки лекарственных соединений;
- Особенности синтетических и производственных схем в производстве лекарственных субстанций;
- Тенденции в развитии современных технологий синтеза лекарственных субстанций и полупродуктов.

Должен уметь:

- Осуществлять типовые синтетические превращения, рассматриваемые в рамках курса;
- осуществлять типовые методы выделения и очистки соединений;
- анализировать тематическую литературу и базы данных с целью поиска оптимальных синтетических схем, ведущих к соединениям заданной структуры.

Должен владеть:

- Методами синтеза, выделения и очистки продуктов и полупродуктов, наиболее употребительными на этапах разработки лекарственных средств.

Должен демонстрировать способность и готовность:

- Применять на практике знания и опыт в области синтеза, выделения и очистки полупродуктов и продуктов химических превращений, применяемых на исследовательских этапах разработки лекарственных средств;
- Теоретически анализировать и предлагать новые схемы синтеза целевых продуктов, в том числе многостадийные.

2. Место дисциплины (модуля) в структуре ОПОП ВО

Данная дисциплина (модуль) включена в раздел "Б1.В.ДВ.03.03 Дисциплины (модули)" основной профессиональной образовательной программы 04.04.01 "Химия (Органическая, элементоорганическая и медицинская химия)" и относится к дисциплинам по выбору.

Осваивается на 1 курсе в 2 семестре.

3. Объем дисциплины (модуля) в зачетных единицах с указанием количества часов, выделенных на контактную работу обучающихся с преподавателем (по видам учебных занятий) и на самостоятельную работу обучающихся

Общая трудоемкость дисциплины составляет 3 зачетных(ые) единиц(ы) на 108 часа(ов).

Контактная работа - 28 часа(ов), в том числе лекции - 12 часа(ов), практические занятия - 16 часа(ов), лабораторные работы - 0 часа(ов), контроль самостоятельной работы - 0 часа(ов).

Самостоятельная работа - 44 часа(ов).

Контроль (зачёт / экзамен) - 36 часа(ов).

Форма промежуточного контроля дисциплины: экзамен во 2 семестре.

4. Содержание дисциплины (модуля), структурированное по темам (разделам) с указанием отведенного на них количества академических часов и видов учебных занятий

4.1 Структура и тематический план контактной и самостоятельной работы по дисциплине (модулю)

N	Разделы дисциплины / модуля	Семестр	Виды и часы контактной работы, их трудоемкость (в часах)			Самостоятельная работа
			Лекции	Практические занятия	Лабораторные работы	
1.	Тема 1. Особенности методов органического синтеза в медицинской химии. Связь с современными технологиями разработки лекарственных средств	2	2	2	0	4
2.	Тема 2. Методы создания C-(O,N) связи	2	2	4	0	16
3.	Тема 3. Методы создания C-C связи	2	2	2	0	8
4.	Тема 4. Медицинско-химическая модификация сложной гетероциклической структуры на примере пиридоксина	2	2	4	0	12
5.	Тема 5. Методы выделения и очистки	2	2	2	0	4
6.	Тема 6. Передовые синтетические технологии в производстве лекарственных средств	2	2	2	0	0
Итого			12	16	0	44

4.2 Содержание дисциплины (модуля)**Тема 1. Особенности методов органического синтеза в медицинской химии. Связь с современными технологиями разработки лекарственных средств**

Лекарственные субстанции, их типические особенности в сравнении с другими классами химических соединений. Понятие лекарственного подобия (drug-likeness). Особенности методов органического синтеза в медицинской химии. Типовые синтетические превращения. Связь с современными технологиями разработки лекарственных средств. Комбинаторный синтез. Параллельный синтез. Комбинаторный твердофазный синтез. Комбинаторный синтез в растворе.

Тема 2. Методы создания C-(O,N) связи

Образование C-N связи: прямое аминирование, восстановительное аминирование, получение производных карбоновых кислот, получение производных сульфоновых кислот, другие методы. Образование C-O связи: образование простых эфиров (синтез Вильямсона/реакция Мицунобу), получение производных карбоновых кислот получение производных сульфоновых кислот, другие методы.

Тема 3. Методы создания C-C связи

Методы образования C-C связи: Процессы, катализируемые палладием (реакция Сузуки-Мияуры, реакция Хека-Соногаширы). Реакция Гриньяра: используемые реагенты и условия, примеры. Реакция Виттига: используемые реагенты и условия, стереохимические особенности протекания реакции, примеры. Другие методы создания C-C связи.

Тема 4. Медицинско-химическая модификация сложной гетероциклической структуры на примере пиридоксина

Пиридоксин как пример полифункциональной химической структуры с широкими возможностями структурной модификации. Модификация с участием ароматической гидроксигруппы. Реакции с участием алифатических гидроксигрупп. Реакции с участием эндоциклического атома азота. Модификация положения 6. Модификация 1-метильного заместителя. Смешанные модификации.

Тема 5. Методы выделения и очистки

Требования к технологичности процессов, приводящих к лекарственным соединениям (экономическая эффективность производств, требования безопасности, доступность сырья и пр.). Колоночная хроматография. Перекристаллизация. Перегонка. Прочие методы. Особенности указанных методов, предпочтительные сферы применения, ограничения.

Тема 6. Передовые синтетические технологии в производстве лекарственных средств

Передовые синтетические технологии в лабораторном синтезе и промышленном производстве лекарственных средств. Биокаталитические технологии: типы возможных превращений, биореакторы, особенности процессов. Непрерывные технологические схемы синтеза и очистки: особенности процессов и их ограничения. Технологии синтеза с использованием мини-реакторов.

5. Перечень учебно-методического обеспечения для самостоятельной работы обучающихся по дисциплине (модулю)

Самостоятельная работа обучающихся выполняется по заданию и при методическом руководстве преподавателя, но без его непосредственного участия. Самостоятельная работа подразделяется на самостоятельную работу на аудиторных занятиях и на внеаудиторную самостоятельную работу. Самостоятельная работа обучающихся включает как полностью самостоятельное освоение отдельных тем (разделов) дисциплины, так и проработку тем (разделов), осваиваемых во время аудиторной работы. Во время самостоятельной работы обучающиеся читают и конспектируют учебную, научную и справочную литературу, выполняют задания, направленные на закрепление знаний и отработку умений и навыков, готовятся к текущему и промежуточному контролю по дисциплине.

Организация самостоятельной работы обучающихся регламентируется нормативными документами, учебно-методической литературой и электронными образовательными ресурсами, включая:

Порядок организации и осуществления образовательной деятельности по образовательным программам высшего образования - программам бакалавриата, программам специалитета, программам магистратуры (утвержден приказом Министерства образования и науки Российской Федерации от 5 апреля 2017 года №301)

Письмо Министерства образования Российской Федерации №14-55-996ин/15 от 27 ноября 2002 г. "Об активизации самостоятельной работы студентов высших учебных заведений"

Устав федерального государственного автономного образовательного учреждения "Казанский (Приволжский) федеральный университет"

Правила внутреннего распорядка федерального государственного автономного образовательного учреждения высшего профессионального образования "Казанский (Приволжский) федеральный университет"

Локальные нормативные акты Казанского (Приволжского) федерального университета

6. Фонд оценочных средств по дисциплине (модулю)

Фонд оценочных средств по дисциплине (модулю) включает оценочные материалы, направленные на проверку освоения компетенций, в том числе знаний, умений и навыков. Фонд оценочных средств включает оценочные средства текущего контроля и оценочные средства промежуточной аттестации.

В фонде оценочных средств содержится следующая информация:

- соответствие компетенций планируемым результатам обучения по дисциплине (модулю);
- критерии оценивания сформированности компетенций;
- механизм формирования оценки по дисциплине (модулю);
- описание порядка применения и процедуры оценивания для каждого оценочного средства;
- критерии оценивания для каждого оценочного средства;
- содержание оценочных средств, включая требования, предъявляемые к действиям обучающихся, демонстрируемым результатам, задания различных типов.

Фонд оценочных средств по дисциплине находится в Приложении 1 к программе дисциплины (модулю).

7. Перечень литературы, необходимой для освоения дисциплины (модуля)

Освоение дисциплины (модуля) предполагает изучение основной и дополнительной учебной литературы. Литература может быть доступна обучающимся в одном из двух вариантов (либо в обоих из них):

- в электронном виде - через электронные библиотечные системы на основании заключенных КФУ договоров с правообладателями;

- в печатном виде - в Научной библиотеке им. Н.И. Лобачевского. Обучающиеся получают учебную литературу на абонементе по читательским билетам в соответствии с правилами пользования Научной библиотекой.

Электронные издания доступны дистанционно из любой точки при введении обучающимся своего логина и пароля от личного кабинета в системе "Электронный университет". При использовании печатных изданий библиотечный фонд должен быть укомплектован ими из расчета не менее 0,5 экземпляра (для обучающихся по ФГОС 3++ - не менее 0,25 экземпляра) каждого из изданий основной литературы и не менее 0,25 экземпляра дополнительной литературы на каждого обучающегося из числа лиц, одновременно осваивающих данную дисциплину.

Перечень основной и дополнительной учебной литературы, необходимой для освоения дисциплины (модуля), находится в Приложении 2 к рабочей программе дисциплины. Он подлежит обновлению при изменении условий договоров КФУ с правообладателями электронных изданий и при изменении комплектования фондов Научной библиотеки КФУ.

8. Перечень ресурсов информационно-телекоммуникационной сети "Интернет", необходимых для освоения дисциплины (модуля)

База данных по биомедицинской литературе (Medline, США) - <http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed>

Научная электронная библиотека ELibrary - <http://elibrary.ru/>

Поисковая библиографическая система ScienceDirect - <http://www.sciencedirect.com/>

Поисковая система по научной литературе Google Scholar - <https://scholar.google.ru/>

Учебные материалы по курсу органической химии - <http://www.chem.msu.ru/rus/teaching/org.html>

9. Методические указания для обучающихся по освоению дисциплины (модуля)

Вид работ	Методические рекомендации
лекции	Просмотрите конспект сразу после занятий и отметьте материал, который вызывает затруднения для понимания. Попытайтесь найти ответы на затруднительные вопросы, используя рекомендуемую литературу. Если самостоятельно не удалось разобраться в материале, сформулируйте вопросы и обратитесь за помощью к преподавателю на консультации или ближайшей лекции.
практические занятия	Перед посещением практического занятия изучите теорию вопроса, предполагаемого к изучению, ознакомьтесь с руководством по соответствующей теме. Также рекомендуется прорешать типовые задания, предложенные преподавателем ранее на лекции. Выпишите вопросы, вызвавшие затруднения, и обратитесь за помощью к преподавателю.
самостоятельная работа	Самостоятельная работа проводится с целью углубления знаний по дисциплине и предусматривает: - чтение студентами рекомендованной литературы и усвоение теоретического материала дисциплины; - подготовку к практическим занятиям, устным опросам, тестированиям и контрольной работе; - работу с Интернет-источниками; - подготовку к сдаче практических работ, защите практической работы, сдаче экзамена. Планирование времени на самостоятельную работу, необходимого на изучение настоящей дисциплины, студентам лучше всего осуществлять на весь семестр, предусматривая при этом регулярное повторение пройденного материала. Материал, законспектированный на лекциях, необходимо регулярно дополнять сведениями из литературных источников, представленных в рабочей программе дисциплины 'Методы органического синтеза в медицинской химии', а также из иных источников, рекомендованных преподавателем. По каждой из тем для самостоятельного изучения, приведенных в рабочей программе дисциплины, следует сначала прочитать рекомендованную литературу и при необходимости составить краткий конспект основных положений, терминов, сведений, требующих запоминания и являющихся основополагающими в этой теме и для освоения последующих разделов курса.
экзамен	Экзамен может проводиться в письменной и устной формах. Подготовка проводится по лекционному материалу, также используется основная и дополнительная литература. Рекомендуется дополнительно просмотреть материалы семинарских занятий. На экзамене необходимо продумать план ответа и четко изложить материал, дать определение основных понятий, дать краткое описание явлений, привести примеры.

10. Перечень информационных технологий, используемых при осуществлении образовательного процесса по дисциплине (модулю), включая перечень программного обеспечения и информационных справочных систем (при необходимости)

Перечень информационных технологий, используемых при осуществлении образовательного процесса по дисциплине (модулю), включая перечень программного обеспечения и информационных справочных систем, представлен в Приложении 3 к рабочей программе дисциплины (модуля).

11. Описание материально-технической базы, необходимой для осуществления образовательного процесса по дисциплине (модулю)

Материально-техническое обеспечение образовательного процесса по дисциплине (модулю) включает в себя следующие компоненты:

Помещения для самостоятельной работы обучающихся, укомплектованные специализированной мебелью (столы и стулья) и оснащенные компьютерной техникой с возможностью подключения к сети "Интернет" и обеспечением доступа в электронную информационно-образовательную среду КФУ.

Учебные аудитории для контактной работы с преподавателем, укомплектованные специализированной мебелью (столы и стулья).

Компьютер и принтер для распечатки раздаточных материалов.

Мультимедийная аудитория.

12. Средства адаптации преподавания дисциплины к потребностям обучающихся инвалидов и лиц с ограниченными возможностями здоровья

При необходимости в образовательном процессе применяются следующие методы и технологии, облегчающие восприятие информации обучающимися инвалидами и лицами с ограниченными возможностями здоровья:

- создание текстовой версии любого нетекстового контента для его возможного преобразования в альтернативные формы, удобные для различных пользователей;
- создание контента, который можно представить в различных видах без потери данных или структуры, предусмотреть возможность масштабирования текста и изображений без потери качества, предусмотреть доступность управления контентом с клавиатуры;
- создание возможностей для обучающихся воспринимать одну и ту же информацию из разных источников - например, так, чтобы лица с нарушениями слуха получали информацию визуально, с нарушениями зрения - аудиально;
- применение программных средств, обеспечивающих возможность освоения навыков и умений, формируемых дисциплиной, за счёт альтернативных способов, в том числе виртуальных лабораторий и симуляционных технологий;
- применение дистанционных образовательных технологий для передачи информации, организации различных форм интерактивной контактной работы обучающегося с преподавателем, в том числе вебинаров, которые могут быть использованы для проведения виртуальных лекций с возможностью взаимодействия всех участников дистанционного обучения, проведения семинаров, выступления с докладами и защиты выполненных работ, проведения тренингов, организации коллективной работы;
- применение дистанционных образовательных технологий для организации форм текущего и промежуточного контроля;
- увеличение продолжительности сдачи обучающимся инвалидом или лицом с ограниченными возможностями здоровья форм промежуточной аттестации по отношению к установленной продолжительности их сдачи:
- продолжительности сдачи зачёта или экзамена, проводимого в письменной форме, - не более чем на 90 минут;
- продолжительности подготовки обучающегося к ответу на зачёте или экзамене, проводимом в устной форме, - не более чем на 20 минут;
- продолжительности выступления обучающегося при защите курсовой работы - не более чем на 15 минут.

Программа составлена в соответствии с требованиями ФГОС ВО и учебным планом по направлению 04.04.01 "Химия" и магистерской программе "Органическая, элементоорганическая и медицинская химия".

Приложение 2
к рабочей программе дисциплины (модуля)
Б1.В.ДВ.03.03 Методы органического синтеза в медицинской
химии

Перечень литературы, необходимой для освоения дисциплины (модуля)

Направление подготовки: 04.04.01 - Химия

Профиль подготовки: Органическая, элементоорганическая и медицинская химия

Квалификация выпускника: магистр

Форма обучения: очное

Язык обучения: русский

Год начала обучения по образовательной программе: 2018

Основная литература:

1. Реутов, О.А. Органическая химия. В 4 ч. Часть 1 [Электронный ресурс] : учеб. / О.А. Реутов, А.Л. Курц, К.П. Бутин. - Электрон. дан. - Москва : Издательство 'Лаборатория знаний', 2017. - 570 с. - Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/94167>
2. Реутов, О.А. Органическая химия. В 4 ч. Часть 2 [Электронный ресурс] : учеб. / О.А. Реутов, А.Л. Курц, К.П. Бутин. - Электрон. дан. - Москва : Издательство 'Лаборатория знаний', 2017. - 626 с. - Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/94168>
3. Реутов, О.А. Органическая химия. В 4 ч. Часть 3 [Электронный ресурс] : учеб. / О.А. Реутов, А.Л. Курц, К.П. Бутин. - Электрон. дан. - Москва : Издательство 'Лаборатория знаний', 2017. - 547 с. - Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/94166>
4. Арзамасцев А.П., Фармацевтическая химия [Электронный ресурс] : учебное пособие / Под ред. А.П. Арзамасцева. - 2-е изд., испр. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2008. - 640 с. - ISBN 978-5-9704-0744-8 - Режим доступа: <http://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970407448.html>

Дополнительная литература:

1. Биоорганическая химия: учебник / И.В. Романовский, В.В. Болтроев, Л.Г. Гидранович и др. - М.: НИЦ ИНФРА-М, Нов. знание, 2015. - 505 с. - (Высшее образование) ISBN 978-5-16-010819-3 Режим доступа: <http://znanium.com/catalog.php?bookinfo=502950>
2. Биоорганическая химия : учебник / Н. А. Тюкавкина, Ю. И. Бауков, С. Э. Зурабян. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2015. - 416 с. : ил. Режим доступа: <http://www.studmedlib.ru/ru/book/ISBN9785970431887.html>
3. Травень, Ф.В. Органическая химия : учебное пособие для вузов. Т.2 [Электронный ресурс] : учебное пособие. - Электрон. дан. - М. : 'Лаборатория знаний'. - 2013. - 517 с. - Режим доступа: http://e.lanbook.com/books/element.php?pl1_id=8693

Приложение 3
к рабочей программе дисциплины (модуля)
Б1.В.ДВ.03.03 Методы органического синтеза в медицинской
химии

Перечень информационных технологий, используемых для освоения дисциплины (модуля), включая перечень программного обеспечения и информационных справочных систем

Направление подготовки: 04.04.01 - Химия

Профиль подготовки: Органическая, элементоорганическая и медицинская химия

Квалификация выпускника: магистр

Форма обучения: очное

Язык обучения: русский

Год начала обучения по образовательной программе: 2018

Освоение дисциплины (модуля) предполагает использование следующего программного обеспечения и информационно-справочных систем:

Операционная система Microsoft Windows 7 Профессиональная или Windows XP (Volume License)

Пакет офисного программного обеспечения Microsoft Office 365 или Microsoft Office Professional plus 2010

Браузер Mozilla Firefox

Браузер Google Chrome

Adobe Reader XI или Adobe Acrobat Reader DC

Kaspersky Endpoint Security для Windows

Учебно-методическая литература для данной дисциплины имеется в наличии в электронно-библиотечной системе "ZNANIUM.COM", доступ к которой предоставлен обучающимся. ЭБС "ZNANIUM.COM" содержит произведения крупнейших российских учёных, руководителей государственных органов, преподавателей ведущих вузов страны, высококвалифицированных специалистов в различных сферах бизнеса. Фонд библиотеки сформирован с учетом всех изменений образовательных стандартов и включает учебники, учебные пособия, учебно-методические комплексы, монографии, авторефераты, диссертации, энциклопедии, словари и справочники, законодательно-нормативные документы, специальные периодические издания и издания, выпускаемые издательствами вузов. В настоящее время ЭБС ZNANIUM.COM соответствует всем требованиям федеральных государственных образовательных стандартов высшего образования (ФГОС ВО) нового поколения.

Учебно-методическая литература для данной дисциплины имеется в наличии в электронно-библиотечной системе Издательства "Лань", доступ к которой предоставлен обучающимся. ЭБС Издательства "Лань" включает в себя электронные версии книг издательства "Лань" и других ведущих издательств учебной литературы, а также электронные версии периодических изданий по естественным, техническим и гуманитарным наукам. ЭБС Издательства "Лань" обеспечивает доступ к научной, учебной литературе и научным периодическим изданиям по максимальному количеству профильных направлений с соблюдением всех авторских и смежных прав.

Учебно-методическая литература для данной дисциплины имеется в наличии в электронно-библиотечной системе "Консультант студента", доступ к которой предоставлен обучающимся. Многопрофильный образовательный ресурс "Консультант студента" является электронной библиотечной системой (ЭБС), предоставляющей доступ через сеть Интернет к учебной литературе и дополнительным материалам, приобретенным на основании прямых договоров с правообладателями. Полностью соответствует требованиям федеральных государственных образовательных стандартов высшего образования к комплектованию библиотек, в том числе электронных, в части формирования фондов основной и дополнительной литературы.