

МИНИСТЕРСТВО НАУКИ И ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ РФ  
Федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение  
высшего образования  
«ДАГЕСТАНСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ»  
*Химический факультет*

## **РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ**

### **ОРГАНИЧЕСКАЯ ХИМИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ**

Кафедра физической и органической химии

Образовательная программа:

04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия

Профиль подготовки: «Органическая химия»

Уровень высшего образования: Специалитет

Форма обучения: Очная

Статус дисциплины: дисциплин по выбору

Махачкала, 2021 г.

Рабочая программа дисциплины “Органическая химия лекарственных веществ” составлена в 2021 году в соответствии с требованиями ФГОС ВО по специальности 04.05.01 «Фундаментальная и прикладная химия» (уровень специалитета) от 13 июля 2017 года № 652.

Разработчик: д.х.н., профессор кафедры физической и органической химии Абдуллаев М.Г.

Рабочая программа дисциплины одобрена:  
на заседании кафедры физической и органической химии  
от «28» 05 2021 г., протокол № 9

Зав. кафедрой И.М. Абдулагатов проф. Абдулагатов И.М.  
(подпись)

на заседании Методической комиссии химического факультета

от «18» 06 2021 г., протокол № 10.

Председатель У.Г. Гасангаджиева доц. Гасангаджиева У.Г.  
(подпись)

Рабочая программа дисциплины согласована с учебно-методическим

управлением «09» 07 2021 г. У.Г. Гасангаджиева  
(подпись)

## Аннотация рабочей программы дисциплины «Органическая химия лекарственных веществ»

Дисциплина «Органическая химия лекарственных веществ» входит в раздел дисциплин по выбору (Б1.В.01.ДВ.03.02) образовательной программы специалитета по специальности 04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия.

Дисциплина реализуется на химическом факультете кафедрой физической и органической химии.

Содержание дисциплины охватывает круг вопросов, связанных с подготовкой химика, способного применить теоретические знания и практические навыки, полученные в области органической химии лекарственных веществ, в разработке новых стратегических подходов, позволяющих планировать и осуществлять целенаправленный поиск молекулярных структур, новых, или путем модифицирования, уже известных, органических лекарственных веществ (целевой органический синтез), в том числе с применением современного арсенала методов компьютерного моделирования.

Дисциплина нацелена на формирование следующих компетенций выпускника: общепрофессиональных – ОПК-6, профессиональных - ПК-1-5.

Преподавание дисциплины предусматривает проведение следующих видов учебных занятий: лекции, практические занятия.

Рабочая программа дисциплины предусматривает проведение следующих видов контроля успеваемости в форме контрольных работ, тестирования, решения расчетных задач, отчеты по лабораторным работам и промежуточный контроль в форме зачета.

Объем дисциплины 3 зачетные единицы, в том числе 108 академических часа по видам учебных занятий:

Семестр	Учебные занятия							СРС, в том числе экзамен	Форма промежуточной аттестации (зачет, дифференцированный зачет, экзамен)
	в том числе								
	Контактная работа обучающихся с преподавателем								
	Всего	из них							
Лекции		Лабораторные занятия	Лаб.пр. подгот	Практические занятия	КСР	консультации			
8	108	20	38	20	-	-	-	50	зачет

### 1. Цели освоения дисциплины

Цель освоения дисциплины «Органическая химия лекарственных веществ» – подготовка студента, способного применить теоретические знания и практические навыки, полученные в области синтетической органической химии и компьютерной химии, в разработке новых стратегических подходов, позволяющих планировать и осуществлять целенаправленный поиск молекулярных структур, новых или путем модифицирования уже известных, органических лекарственных веществ (целевой органический синтез), в том числе с применением современного арсенала методов компьютерного моделирования биологической активности химических соединений.

### 2. Место дисциплины в структуре ОПОП специалитета

Дисциплина «Органическая химия лекарственных веществ» входит в раздел дисциплин по выбору (Б1.В.01.ДВ.03.02) образовательной программы специалитета по специальности 04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия.

В информационном и логическом планах дисциплина «Органическая химия лекарственных веществ» последовательно развивает дисциплину «Органическая химия», поэтому требует от студентов знаний из области органической химии, умений проведения лабораторных работ, интерпретации результатов, полученных при выполнении лабораторных работ, работать с компьютером и компьютерными химическими прикладными программами. Освоение данной дисциплины необходимо для выполнения курсовых и дипломных работ, а так же для закрепления углубленных профессиональных навыков.

### 3. Компетенции обучающегося, формируемые в результате освоения дисциплины (перечень планируемых результатов обучения)

Код и наименование компетенции из ОПОП	Код и наименование индикатора достижения компетенций (в соответствии с ОПОП)	Планируемые результаты обучения	Процедура освоения
<p><b>ОПК-6.</b> Способен представлять результаты профессиональной деятельности в устной и письменной форме в соответствии с нормами и правилами, принятыми в профессиональном сообществе</p>	<p><b>ОПК-6.1.</b> Грамотно составляет отчет о проделанной работе в письменной форме</p>	<p><b>Знает:</b> требования к рабочему журналу химика; правила составления протоколов отчетов химических опытов; требования к представлению результатов исследований в виде курсовых и квалификационных работ.  <b>Умеет:</b> представить результаты опытов и расчетных работ согласно требованиям в данной области химии; представить результаты химических исследований в соответствии с требованиями к квалификационным работам.  <b>Владеет:</b> опытом представления результатов экспериментальных и расчетно-теоретических работ в виде протоколов испытаний, отчетов, курсовых и квалификационных работ.</p>	<p>Устный опрос, письменный опрос</p>
	<p><b>ОПК-6.2.</b> Представляет результаты работы в виде научной публикации (тезисы доклада, статья, обзор) на русском и английском языке</p>	<p><b>Знает:</b> требования к тезисам и научным статьям химического профиля.  <b>Умеет:</b> составить тезисы доклада и отдельные разделы статьи на русском и английском языке.  <b>Владеет:</b> навыками представления результатов собственных научных изысканий в компьютерных сетях и информационной научно-образовательной среде</p>	<p>Устный опрос, письменный опрос</p>
	<p><b>ОПК-6.3.</b> Представляет результаты работы в устной форме на русском и английском языке</p>	<p><b>Знает:</b> грамматику, орфографию и орфоэпию русского и английского языка.  <b>Умеет:</b> представить результаты исследований в виде постера; формулировать вопросы к членам профессионального сообщества и отвечать на вопросы по теме проведенного исследования; грамотно и логично изложить результаты проделанной работы в устной форме на русском и английском языке.  <b>Владеет:</b> свободно русским и английским языком.</p>	<p>Устный опрос, письменный опрос</p>
<p><b>ПК-1.</b> Способен проводить сбор, анализ и обработку литературных данных для решения поставленной задачи в выбранной области химии, химической техноло-</p>	<p><b>ПК-1.1.</b> Собирает информацию по тематике научного проекта в выбранной области химии с использованием открытых источников информации и специализированных баз данных</p>	<p><b>Знает:</b> Знает перечень открытых источников информации и специализированных баз данных в области физической химии.  <b>Умеет:</b> Пользоваться электронными ресурсами и базами данных, а также периодическими изданиями в области физической химии.  <b>Владеет:</b> навыками сбора информации по тематике научного проекта в области физи-</p>	<p>Устный опрос, письменный опрос</p>

гии или смежных с химией науках		ческой химии с использованием открытых источников информации и специализированных баз данных, в том числе Scopus и WebofScience.	
	<b>ПК-1.2.</b> Анализирует и обрабатывает литературные данные по тематике исследования в выбранной области химии	<b>Знает:</b> знает методы систематизации и классификации литературных данных по тематике исследования в области физической химии. <b>Умеет:</b> систематизировать и классифицировать литературные данные по тематике исследования в области физической химии. <b>Владеет:</b> навыками систематизации и классификации литературных данных по тематике исследования в области физической химии.	Устный опрос, письменный опрос
<b>ПК-2.</b> Способен планировать работу и выбирать методы решения поставленных задач в выбранной области химии, химической технологии или смежных с химией науках	<b>ПК-2.1.</b> Составляет общий план исследования и детальные планы отдельных стадий	<b>Знает:</b> методы составления планов отдельных стадий и общего плана исследования в области физической химии. <b>Умеет:</b> составлять планы отдельных стадий и общий плана исследования в области физической химии. <b>Владеет:</b> навыками составления общего плана исследования в области физической химии и детальных планов отдельных стадий.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-2.2.</b> Выбирает экспериментальные и расчетно-теоретические методы решения поставленной задачи исходя из имеющихся материальных и временных ресурсов	<b>Знает:</b> экспериментальные и расчетно-теоретические методы решения поставленной задачи в области физической химии. <b>Умеет:</b> выбирать экспериментальные и расчетно-теоретические методы решения поставленной задачи в области физической химии исходя из имеющихся материальных и временных ресурсов. <b>Владеет:</b> навыками выбора экспериментальных и расчетно-теоретические методы решения поставленной задачи исходя в области физической химии из имеющихся материальных и временных ресурсов.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-2.3.</b> Планирование и проведение научно-исследовательских работ по разработке и внедрению нормативных документов по системам стандартизации, разработки и постановки продукции на производство	<b>Знает:</b> нормативные документы по системам стандартизации, разработки и постановки продукции на производство. <b>Умеет:</b> планировать и проводить научно-исследовательские работы по разработке и внедрению нормативных документов по системам стандартизации, разработки и постановки продукции на производство. <b>Владеет:</b> навыками планирования и проведения научно-исследовательских работ по разработке и внедрению нормативных документов по системам стандартизации, разработки и постановки продукции на производство.	Устный опрос, письменный опрос
<b>ПК-3.</b> Способен проводить экспериментальные и расчетно-теоретические работы по заданной теме в выбранной области химии, химической технологии или смежных с	<b>ПК-3.1.</b> Проводит экспериментальные исследования по заданной теме в выбранной области химии	<b>Знает:</b> методы проведения экспериментальных исследований по заданной теме в области физической химии. <b>Умеет:</b> проводить экспериментальные исследования по заданной теме в области физической химии. <b>Владеет:</b> навыками проведения экспериментальных исследований под руководством руководителя по заданной теме в области физической химии.	Устный опрос, письменный опрос

химией наук	<b>ПК-3.2.</b> Проводит расчетно-теоретические исследования по заданной теме в выбранной области химии	<b>Знает:</b> методы расчетно-теоретических исследований по заданной теме в области физической химии. <b>Умеет:</b> проводить расчетно-теоретические исследования по заданной теме в области физической химии. <b>Владеет:</b> необходимыми навыками качественного проведения расчетно-теоретических исследований по заданной теме в области физической химии.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-3.3.</b> Управляет высокотехнологичным химическим оборудованием	<b>Знает:</b> технические характеристики высокотехнологического оборудования. <b>Умеет:</b> управлять высокотехнологичным оборудованием. <b>Владеет:</b> навыками управления и обслуживания высокотехнологичного оборудования.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-3.4.</b> Проводит испытания новых образцов продукции	<b>Знает:</b> методы проведения испытания новых образцов продукции. <b>Умеет:</b> проводить испытания новых образцов продукции. <b>Владеет:</b> навыками испытания новых образцов продукции.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-3.5.</b> Разрабатывает новые методики контроля сырья, прекурсоров и готовой продукции	<b>Знает:</b> методологию разработки новых методик контроля сырья, прекурсоров и готовой продукции. <b>Умеет:</b> проверять правильность новых методик контроля сырья, прекурсоров и готовой продукции. <b>Владеет:</b> навыками разработки новых методик контроля сырья, прекурсоров и готовой продукции и проверки их правильности.	Устный опрос, письменный опрос
<b>ПК-4.</b> Способен обрабатывать и интерпретировать результаты проведенных работ в выбранной области химии, химической технологии или смежных с химией науках с использованием различных методов и подходов	<b>ПК-4.1.</b> Обрабатывает полученные данные с использованием современных методов анализа информации	<b>Знает:</b> современные методы анализа информации. <b>Умеет:</b> применять современные методы анализа информации для обработки полученных данных. <b>Владеет:</b> навыками обработки полученных результатов анализа реальных объектов с использованием современных методов анализа информации.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-4.2.</b> Грамотно интерпретирует результаты исследований в выбранной области химии	<b>Знает:</b> методы интерпретации результатов исследований в области физической химии. <b>Умеет:</b> грамотно интерпретировать результаты исследований в области физической химии. <b>Владеет:</b> навыками интерпретации и наглядного представления результатов исследований в области физической химии.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-4.3.</b> Анализирует результаты испытаний сырья, прекурсоров, готовой продукции; оценивает степень их соответствия нормативным документам (стандартам и технологическим регламентам)	<b>Знает:</b> стандарты и технологические регламенты сырья, прекурсоров, готовой продукции. <b>Умеет:</b> анализировать результаты испытаний сырья, прекурсоров, готовой продукции. <b>Владеет:</b> навыками статистической обработки результатов испытаний сырья, прекурсоров, готовой продукции; оценки степени их соответствия стандартам и технологическим регламентам.	Устный опрос, письменный опрос
<b>ПК-5.</b> Способен проводить критический анализ полученных результатов	<b>ПК-5.1.</b> Критически анализирует полученные результаты исследований в выбранной	<b>Знает:</b> методы критического анализа полученных результатов исследований в области физической химии, способы выявления достоинств и недостатков.	Устный опрос, письменный опрос

и оценивать перспективы продолжения работ в выбранной области химии, химической технологии или смежных с химией науках	области химии, выявляет достоинства и недостатки	<b>Умеет:</b> критически анализировать полученные результаты научных исследований в области физической химии. <b>Владеет:</b> навыками критического анализа полученных результатов научных исследований в области физической химии.	
	<b>ПК-5.2.</b> Готовит отдельные разделы отчетов по результатам НИР и НИОКР в выбранной области химии	<b>Знает:</b> методологию подготовки отчетов по результатам НИР и НИОКР в области физической химии. <b>Умеет:</b> готовить отдельные разделы отчетов по результатам НИР и НИОКР в области физической химии. <b>Владеет:</b> навыками подготовки отдельных разделов отчетов по результатам НИР и НИОКР в области физической химии.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-5.3.</b> Формулирует рекомендации по продолжению исследования в выбранной области химии	<b>Знает:</b> способы подготовки рекомендаций по продолжению исследования в области физической химии. <b>Умеет:</b> формулировать рекомендации по продолжению исследования в области физической химии. <b>Владеет:</b> навыками формулировки рекомендаций по продолжению исследования в области физической химии.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-5.4.</b> Анализирует полученные результаты и формулирует предложения по оптимизации отдельных стадий технологического процесса	<b>Знает:</b> методы анализа полученных результатов и оптимизации отдельных стадий технологического процесса. <b>Умеет:</b> анализировать полученные результаты и формулировать предложения по оптимизации отдельных стадий технологического процесса. <b>Владеет:</b> навыками анализа полученных результатов и разработки предложений по оптимизации отдельных стадий технологического процесса.	Устный опрос, письменный опрос
	<b>ПК-5.5.</b> Разрабатывает техническую документацию и регламенты	<b>Знает:</b> виды технической документации и регламентов в области физической химии. <b>Умеет:</b> разрабатывать техническую документацию и регламенты в области физической химии. <b>Владеет:</b> навыками и практическим опытом разработки технической документации и регламентов в области физической химии.	Устный опрос, письменный опрос

#### 4. Объем, структура и содержание дисциплины.

4.1. Объем дисциплины составляет 3 зачетных ед., 108 академических часа.

4.2. Структура дисциплины.

№ п/п	Разделы и темы дисциплины	Семестр	Неделя семестра	Виды учебной работы, включая самостоятельную работу студентов и трудоемкость (в часах)				Самостоятельная работа	Формы текущего контроля успеваемости (по неделям семестра) Форма промежуточной аттестации (по семестрам)
				Лек.	Практ. зан.	Лабораторные	Контакты		
	<b>Модуль 1. История и современное состояние предмета. Органическая химия лекарственных веществ алифатического ряда.. Органическая химия лекарственных веществ алициклического ряда</b>								
1	<b>Тема. 1</b> История предмета и современное состояние предмета. Стратегия	7	1,2	2		6		8	Устный опрос, письменный опрос, тестирование, коллоквиум, круглый

	создания синтетических лекарственных веществ.							стол, деловая игра, доклады и др.	
2	<b>Тема. 2</b> Синтез и свойства лекарственных веществ алифатического и алициклического ряда	7	3-6	4		6		10	Устный опрос, письменный опрос, тестирование, коллоквиум, круглый стол, деловая игра, доклады и др.
	<i>Итого по модулю 1:</i>			6		12		18	36 ч
<b>Модуль 2. Органическая химия лекарственных веществ ароматического ряда</b>									
3	<b>Тема 1.</b> Синтез производных ароматического ряда	7	7-9	4		6		6	Устный опрос, письменный опрос, тестирование, коллоквиум, круглый стол, деловая игра, доклады и др.
4	<b>Тема 2.</b> Свойства производных ароматического ряда	7	10-12	4		8		8	Устный опрос, письменный опрос, тестирование, коллоквиум, круглый стол, деловая игра, доклады и др.
	<i>Итого по модулю 2:</i>			8		14		14	36 ч
<b>Модуль 3. Органическая химия лекарственных веществ с базовым гетероциклическим фрагментом</b>									
5	<b>Тема 1.</b> Синтез производных с базовым гетероциклическим фрагментом	7	13-15	4		6		10	Устный опрос, письменный опрос, тестирование, коллоквиум, круглый стол, деловая игра, доклады и др.
6	<b>Тема 2.</b> Свойства производных с базовым гетероциклическим фрагментом	7	16-17	2		6		8	Устный опрос, письменный опрос, тестирование, коллоквиум, круглый стол, деловая игра, доклады и др.
	<i>Итого по модулю 3:</i>			6		12		18	36 ч
	<b>ВСЕГО</b>		108	20		38		50	зачет

### 4.3. Содержание дисциплины, структурированное по темам (разделам).

#### 4.3.1. Содержание лекционных занятий по дисциплине

Модуль 1. История и современное состояние предмета. Органическая химия лекарственных веществ алифатического ряда.. Органическая химия лекарственных веществ алициклического ряда

Тема.1 История предмета и современное состояние предмета. Эволюция органической химии лекарственных веществ. Современные требования к лекарственным веществам. Стадии биологического изучения лекарственного вещества. Связь структура-биологическая активность. Стратегия создания синтетических лекарственных веществ. Принципиальная схема разработки нового лекарственного вещества. Современная классификация лекарственных веществ, международные и отечественные стандарты. Основные болезни человека и ведущие группы лекарственных веществ на современном фармацевтическом рынке.

Тема. 2 Синтез и свойства лекарственных веществ алифатического и алициклического ряда. Алкилгалогениды для наркоза. Группа противораковых веществ с дихлордиэтиламинным фармакофором. Алканола, аминоалканола и их эфиры. Альдегиды и кетоны. Витамины алифатического ряда. Аминокислоты и их производные. Замещенные циклогексины. Стероиды и витамины циклического ряда. Камфора. Производные адамантана.

Модуль 2. Органическая химия лекарственных веществ ароматического ряда

Тема 1. Синтез производных ароматического ряда: Аминоалкилбензолы. Диарилметаны. Фенол и его производные. Аминофенолы. Бензойная кислота и его производные. Производные салициловой кислоты. Производные аминобензолсульфо кислот. Оксипроизводные нафталина.



Тема 2. Свойства производных ароматического ряда: Аминоалкилбензолы. Диарилметаны. Фенол и его производные. Аминофенолы. Бензойная кислота и его производные. Производные салициловой кислоты. Производные аминобензолсульфонокислоты. Оксопроизводные нафталина.

Модуль 3. Органическая химия лекарственных веществ с базовым гетероциклическим фрагментом

Тема 1. Синтез производных с базовым гетероциклическим фрагментом: Синтез веществ группы азиридина и оксирана. Гетероциклы содержащие четырехчленное азетединовое ядро. Синтез лекарственных веществ на основе пятичленных гетероциклов. Синтез лекарственных веществ на основе шестичленных гетероциклов. Синтез лекарственных веществ содержащих семичленный гетероцикл. Азабициклооктаны. Азабициклооктаноны.

Тема 2. Свойства производных с базовым гетероциклическим фрагментом: Свойства веществ группы азиридина и оксирана. Гетероциклы содержащие четырехчленное азетединовое ядро. Свойства лекарственных веществ на основе пятичленных гетероциклов. Свойства лекарственных веществ на основе шестичленных гетероциклов. Свойства лекарственных веществ содержащих семичленный гетероцикл. Азабициклооктаны. Азабициклооктаноны.

#### 4.3.2. Содержание лабораторно-практических занятий по дисциплине

Целью лабораторных работ является:

- ознакомить студентов с методами получения основных органических лекарственных веществ;
- ознакомить студентов с основными химическими и фармацевтическими свойствами органических лекарственных веществ, опираясь на фундаментальные закономерности органической химии, фармацевтической химии и биохимии;
- выполнение исследовательской работы по синтезу и изучению свойств основных органических лекарственных веществ.

Названия разделов и тем	Цель и содержание лабораторной работы	Результаты лабораторной работы	Часы
<b>Модуль 1. История и современное состояние предмета. Органическая химия лекарственных веществ алифатического ряда.. Органическая химия лекарственных веществ алициклического ряда</b> <b>Лабораторная работа № 1. Определение галогенов в лекарственных органических веществах. Определение подлинности лекарственных форм. Синтез катализаторов</b>			
<b>Опыт 1.</b> Определение ковалентно связанного галогена в папаверина гидрохлориде и пиридоксина гидрохлориде	Качественное определение галогенов в органических лекарственных веществах	Обнаружение неионогенного галогена	4
<b>Опыт 2.</b> Определение подлинности стрептоцида, фразолидона, фурацилина, анальгина, антипирина, амидопирина, амизила, бриллиантового зеленого, викасола, гликокол, глюкоза, дибазол, кислота аскорбиновая	Качественное определение лекарственных веществ	Доказательство подлинности лекарственных веществ	4
<b>Опыт 3.</b> Синтез металлокомплексных катализаторов. Синтез металлополимерных и гетерогенных катализаторов	Получение катализаторов для целенаправленного синтеза лекарственных органических веществ	Получение целевых катализаторов	4
<b>Модуль 2. Органическая химия лекарственных веществ ароматического ряда</b> <b>Лабораторная работа № 2. Синтез лекарственных органических веществ алифатического, алициклического и ароматического ряда.</b>			
<b>Опыт 1.</b> Синтез алкилгалогенидов, алканолов, аминоалканолов и их эфиров. Ацетилхолин. Синтез п-аминофенола как соединения «лидера». Синтез парацетамола и его пролекарства - фенаcetина.	Целенаправленный синтез этилгалогенидов и хлороформа. Целенаправленный синтез п-аминофенола и его производных	Получение целевых лекарственных веществ и соединения «лидера».	4

<b>Опыт 2.</b> Синтез бензойной кислоты. Синтез соединения «лидера» - п-аминобензойной кислоты (ПАБК). Синтез соединений «лидеров» 2,6-диметиланилина и их производных: лидокаин, мепивакаин, бупивакаин. Синтез соединений «лидеров» 2,4, 6-триметиланилина и их производных: тримекаин, пиромекаин	Целенаправленный синтез бензойной кислоты, 2,6-диметиланилина, 2,4, 6-триметиланилина и их производных	Получение целевых лекарственных веществ и соединения «лидера».	6
<b>Опыт 3.</b> Синтез производных салициловой кислоты: натрия салицилата, салициламида, аспирина. Синтез п-Аминосалициловой кислоты (ПАСК) и его производного - метоклопрамида. Синтез соединения «лидера» сульфаниловой кислоты	Целенаправленный синтез п-Аминосалициловой кислоты. Синтез сульфаниловой кислоты	Получение целевых лекарственных веществ. Получение соединения «лидера»	4
<b>Модуль 3. Органическая химия лекарственных веществ с базовым гетероциклическим фрагментом</b> <b>Лабораторная работа № 3. Синтез производных гетероциклического ряда - 5-нитрофурурола, пиридин-3-карбоновая и пиридин-4-карбоновая кислота и их производных</b>			
<b>Опыт 1.</b> Синтез соединения «лидера» 5-нитрофурурола. Синтез производных 5-нитрофурурола: фурацилин, фуразолидон, фуразолин, фурадонин, фурагин	Синтез 5-нитрофурурола и его производных	Получение целевых лекарственных веществ	4
<b>Опыт 2.</b> Синтез соединения «лидера» пиридин-3-карбоновая и пиридин-4-карбоновая кислота	Молекулярное и компьютерное моделирование синтеза пиридин-3-карбоновой (никатиновой) и пиридин-4-карбоновой кислот	Получение целевых лекарственных веществ, компьютерных и молекулярных моделей их оптимального пути синтеза	4
<b>Опыт 3.</b> Синтез производных пиридин-3-карбоновой и пиридин-4-карбоновой кислот: никотиновая кислота и никотинамид (витамин РР), изониазид, фтивазид, салюзид, метазид.	Молекулярное и компьютерное моделирование синтеза производных пиридин-3-карбоновой (никатиновой) и пиридин-4-карбоновой (изоникатиновой) кислот.	Получение целевых лекарственных веществ, компьютерных и молекулярных моделей их оптимального пути синтеза	4

## 5. Образовательные технологии

В курсе по направлению подготовки бакалавров широко используются в учебном процессе компьютерные программы, различные методики сочетания с внеаудиторной работой с целью формирования и развития профессиональных навыков обучающихся. В соответствии с требованиями ФГОС предусматривается использование при проведении занятий по предмету следующих активных методов обучения:

- выполнение лабораторных работ с элементами исследования;
- отчетные занятия по разделам;
- компьютерное молекулярное моделирование;
- решение задач.

## 6. Учебно-методическое обеспечение самостоятельной работы студентов.

### *Виды и порядок выполнения самостоятельной работы*

Студенты в процессе обучения обеспечены методическими и учебными пособиями, компьютерными программами.

Формы и виды самостоятельной работы студентов по дисциплине устанавливаются следующие:

- самостоятельное изучение дополнительных тем с последующим разбором на практическом занятии;
- подготовка к лабораторным занятиям;
- подготовка к промежуточному контролю;

- написание рефератов и подготовка к их защите;
- подготовка к экзамену.

№	Вид самостоятельной работы	Вид контроля	Учебно-методич. Обеспечение
1.	Изучение рекомендованной литературы.	Фронтальный опрос и составление опорных схем и таблиц	См. разделы 8, 9 данного документа.
2.	Подготовка к отчетам по лабораторным работам	Проверка выполнения расчетов, оформления работы в лабораторном журнале и проработки вопросов к текущей теме по рекомендованной литературе.	См. разделы 8, 9 данного документа.
3.	Решение задач	Проверка домашних задач.	См. разделы 8, 9 данного документа.
4.	Подготовка к коллоквиуму	Промежуточная аттестация в форме контрольной работы.	См. разделы 8, 9 данного документа.
5.	Поиск в Интернете дополнительного материала	Прием реферата и выступление с докладом	См. разделы 8, 9 данного документа.
6.	Подготовка к экзамену.	Компьютерное тестирование или опрос по экзаменационным билетам	См. разделы 8, 9 данного документа.

## **7. Фонд оценочных средств для проведения текущего контроля успеваемости, промежуточной аттестации по итогам освоения дисциплины.**

### **7.1. Типовые контрольные задания.**

#### **Перечень тем рефератов**

1. Международные и отечественные стандарты, обеспечивающие качество лекарственных средств.
2. Методы органической химии в синтезе лекарственных веществ.
3. Каталитические методы синтеза лекарственных веществ.
4. Метрология в фармацевтическом анализе. Валидация.
5. Методы молекулярного моделирования в дизайне лекарственных препаратов.
6. Использование химических баз данных в дизайне лекарственных препаратов.
7. Двумерный и трехмерный субструктурный поиск в дизайне лекарственных препаратов.
8. Молекулярные дескрипторы в дизайне лекарственных препаратов.
9. Количественные соотношения структура–активность в дизайне лекарственных препаратов.
10. Методы поиска новых соединений-«лидеров» в дизайне лекарственных препаратов.

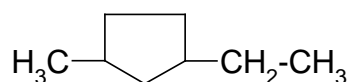
#### **Примерный перечень вопросов к зачету**

1. История предмета и современное состояние предмета. Эволюция органической химии лекарственных веществ.
2. Современные требования к лекарственным веществам. Стадии биологического изучения лекарственного вещества. Связь структура-биологическая активность.
3. Стратегия создания синтетических лекарственных веществ. Принципиальная схема разработки нового лекарственного вещества.
4. Современная классификация лекарственных веществ, международные и отечественные стандарты. Основные болезни человека и ведущие группы лекарственных веществ на современном фармацевтическом рынке.
5. Синтез и свойства лекарственных веществ алифатического и алициклического ряда. Алкилгалогениды для наркоза. Группа противораковых веществ с дихлордиэтиламинным фармакофором.
6. Алканолаы, аминоканолаы и их эфиры.

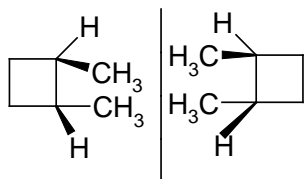
7. Альдегиды и кетоны. Витамины алифатического ряда.
8. Аминокислоты и их производные. Замещенные циклогексины.
9. Витамины циклического ряда. Камфора. Производные адамантана.
10. Производные ароматического ряда: Аминоалкилбензолы.
11. Диарилметаны.
12. Фенол и его производные. Аминофенолы.
13. Бензойная кислота и его производные. Производные салициловой кислоты.
14. Производные аминобензолсульфокислоты.
15. Оксопроизводные нафталина.
16. Производные с базовым гетероциклическим фрагментом: Синтез веществ группы пиазиридина и оксирана.
17. Гетероциклы содержащие четырехчленное азетединовое ядро.
18. Лекарственные вещества на основе пятичленных гетероциклов.
19. Лекарственные вещества на основе шестичленных гетероциклов.
20. Лекарственные вещества содержащие семичленный гетероцикл.
21. Азабициклооктаны.
22. Азабициклооктаноны.

### Примерные тестовые задания

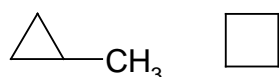
1. Какое название имеет соединение?



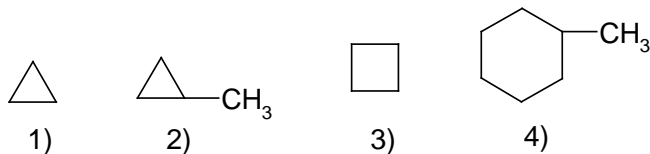
- 1) 1-метил-2-этилциклопентан
  - 2) 1-метил-3-этилциклопентан
  - 3) 1,2-диметилциклопентанон
  - 4) 1-метил-4-этилциклопентанон
2. Какой вид изомерии между соединениями:



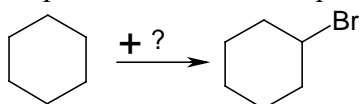
- 1) геометрические изомеры
  - 2) конформеры
  - 3) оптические изомеры
  - 4) структурные изомеры
12. Какой вид изомерии между соединениями?



- 1) геометрические изомеры
  - 2) конформеры
  - 3) оптические изомеры
  - 4) структурные изомеры
3. Укажите в ряду соединений наиболее устойчивый циклоалкан

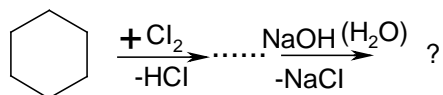


4. При действии какого реагента можно осуществить превращение:



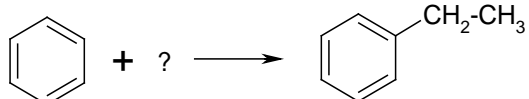
- 1)  $\text{CH}_3\text{Br}$
- 2)  $\text{HBr}$
- 3)  $\text{Br}_2$
- 4)  $\text{FeBr}_3$

5. Назовите конечный продукт, образующийся в ходе превращения:



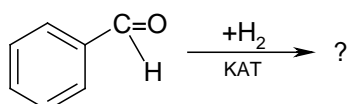
1) фенол 2) п-хлорфенол 3) циклогексанон 4) циклогексанол

6. Какой реагент необходим для получения этилбензола из бензола



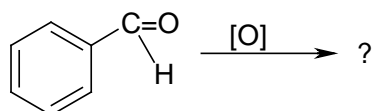
1)  $\text{C}_2\text{H}_5\text{Cl}$  ( $\text{AlCl}_3$ ) 2)  $\text{CH}_3\text{Cl}$  ( $\text{AlCl}_3$ ) 3)  $\text{CH}_3\text{-CHO}$  4)  $\text{CH}_3\text{COOH}$

7. Какое соединение образуется в реакции бензальдегида с водородом?



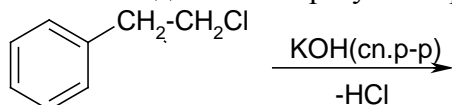
1) бензойная кислота 2) бензиловый спирт 3) бензол 4) толуол

8. Какое соединение образуется в реакции бензальдегида с кислородом?



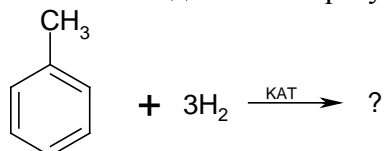
1) бензиловый спирт 2) бензол 3) бензойная кислота 4) надбензойная кислота

9. Какое соединение образуется при отщеплении  $\text{HCl}$  из соединения?



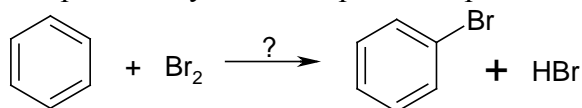
1) винилбензол 2) этилбензол 3) метилбензол 4) пропилбензол

10. Какое соединение образуется при реакции?



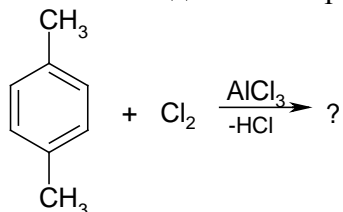
1) метилциклогексан 2) этилциклогексан 3) метилциклогексадиен 4) метилциклогексен

11. При каких условиях протекает реакция



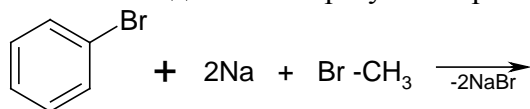
1) на свету 2) в присутствии  $\text{AlBr}_3$  3) водный раствор 4) на холоду

12. Какое соединение образуется при монохлорировании 1,4-диметилбензола?



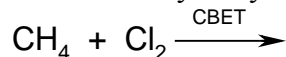
1) 1,4-диметил-2-хлорбензол 2) 1,4-диметил-3-хлорбензол 3) 1,4-диметил-2,3-дихлорбензол  
4) 1-хлорметил-4-метилбензол

13. Какое соединение образуется в реакции Вюрца



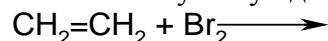
1) толуол 2) орто-бромтолуол 3) мета-бромтолуол 4) пара-бромтолуол

14. По какому типу идет реакция хлорирования метана на свету?



1) замещения 3) отщепления  
2) присоединения 4) разложения

15. По какому типу идет реакция бромирования этилена на свету?



1) замещения 3) отщепления  
2) присоединения 4) разложения

## 7.2. Методические материалы, определяющие процедуру оценивания знаний, умений, навыков и (или) опыта деятельности, характеризующих этапы формирования компетенций.

Формы контроля: текущий контроль (систематический учет знаний и активность студентов на занятиях), промежуточный контроль по модулю (рубежная контрольная работа по пройденному блоку тем) и итоговой контроль (экзамен). Текущий контроль осуществляется в виде устного опроса, тестирования, проведения коллоквиума, обсуждения реферата, проверки домашнего задания.

Оценка текущего контроля включает 70 баллов:

- допуск к выполнению лабораторных работ (10 баллов);
- выполнение и сдача лабораторных работ (20 баллов);
- тестирование (10 баллов);
- выполнение контрольной работы (с включением задач) – 20 баллов.

Промежуточный контроль (в виде контрольной работы или коллоквиума) оценивается в 30 баллов.

Итоговый контроль (100 баллов) проводится в виде устного собеседования или в виде письменного теста, содержащего вопросы по всем разделам курса “Каталитический синтез азотсодержащих соединений”, изучавшимся в процессе семестра. Среднее число баллов по всем модулям, которое дает право получения положительной оценки без итогового контроля знаний – 51 и выше.

## 8. Перечень основной и дополнительной учебной литературы, необходимой для освоения дисциплины.

### а) Основная литература:

1. Солдатенков А.Т., Колядина Н.М., Шендрик И.В. Основы органической химии лекарственных веществ. М.: Мир, 2003.
2. Клюев М.В., Абдуллаев М.Г. Каталитический синтез аминов. Иваново: Издательство ИвГУ. 2004.
3. Кулешова М.И., Гусева Л.Н., Сивицкая О.К. Анализ лекарственных форм. М.: Медицина 2015.

### б) Дополнительная литература:

1. Зефирова О. Н., Зефиров Н. С., Методологические основы создания лекарственных препаратов. Вестн. Моск. Ун-та. Сер. 2. Химия. 2000. Т. 41. № 2, с. 103-108.
2. Яхонтов Л.Н., Глушков Р.Г. Синтетические лекарственные средства. М.:1983.

3. Машковский М.Д. Лекарственные средства. В 2 т. М.:Новая волна, 2002.
4. Регистр лекарственных средств России – энциклопедия лекарств./Гл. ред. Крылов Ю.Ф./, М.: РАС – 2000-2011 гг.
5. Коваленко С.Н., Друшляк А.Г., Черных В.П. Основы комбинаторной органической химии. Харьков: НФАУ «Золотые страницы», 2003.
6. Колхаун М., Холтон Д, Томпсон Д., Твигг М. Новые пути органического синтеза. Практическое использование переходных металлов. Пер. с англ. М.: Химия. 1989.
7. Граник В.Г. Лекарства. Фармакологический, биохимический и химический аспекты. М.: Вузовская книга, 2015.
8. Руководство к лабораторным занятиям по фармацевтической химии. Под ред. Арзамасцева А.П. М.: Медицина 2016.

#### **9. Перечень ресурсов информационно-телекоммуникационной сети «Интернет», необходимых для освоения дисциплины**

1. Электронные образовательные ресурсы образовательного сервера ДГУ elib.dgu.ru.
2. Главная страница по фармацевтической химии <http://farmchem.ru/>
3. Регистр лекарственных средств России
4. <http://slovari.yandex.ru/~книги/Регистр%20лекарств>
5. Справочник по лекарственным препаратам <http://himed000.narod.ru/farm/>

#### **10. Методические указания для обучающихся по освоению дисциплины.**

Методические указания студентам должны раскрывать рекомендуемый режим и характер учебной работы по изучению теоретического курса (или его раздела/части), практических и/или семинарских занятий, лабораторных работ (практикумов), и практическому применению изученного материала, по выполнению заданий для самостоятельной работы, по использованию информационных технологий и т.д. Методические указания должны мотивировать студента к самостоятельной работе и не подменять учебную литературу.

Указывается перечень учебно-методических изданий, рекомендуемых студентам для подготовки к занятиям и выполнения самостоятельной работы, а также методические материалы на бумажных и/или электронных носителях, выпущенные кафедрой своими силами и предоставляемые студентам во время занятий:

- рабочие тетради студентов;
- наглядные пособия;
- гlossарий (словарь терминов по тематике дисциплины);
- тезисы лекций,
- раздаточный материал и др.

Самостоятельная работа студентов, предусмотренная учебным планом в объеме не менее 50-70% общего количества часов, должна соответствовать более глубокому усвоению изучаемого курса, формировать навыки исследовательской работы и ориентировать студентов на умение применять теоретические знания на практике.

Задания для самостоятельной работы составляются по разделам и темам, по которым не предусмотрены аудиторские занятия, либо требуется дополнительно проработать и проанализировать рассматриваемый преподавателем материал в объеме запланированных часов.

Задания по самостоятельной работе могут быть оформлены в виде таблицы с указанием конкретного вида самостоятельной работы:

- конспектирование первоисточников и другой учебной литературы;
- проработка учебного материала (по конспектам лекций учебной и научной литературе) и подготовка докладов на семинарах и практических занятиях, к участию в тематических дискуссиях и деловых играх;
- работа с нормативными документами и законодательной базой;

- поиск и обзор научных публикаций и электронных источников информации, подготовка заключения по обзору;
- выполнение контрольных работ, творческих (проектных) заданий, курсовых работ (проектов);
- решение задач, упражнений;
- написание рефератов (эссе);
- работа с тестами и вопросами для самопроверки;
- выполнение переводов на иностранные языки/с иностранных языков;
- моделирование и/или анализ конкретных проблемных ситуаций ситуации;
- обработка статистических данных, нормативных материалов;
- анализ статистических и фактических материалов, составление выводов на основе проведенного анализа и т.д.

Самостоятельная работа должна носить систематический характер, быть интересной и привлекательной для студента.

Результаты самостоятельной работы контролируются преподавателем и учитываются при аттестации студента (зачет, экзамен). При этом проводятся: тестирование, экспресс-опрос на семинарских и практических занятиях, заслушивание докладов, проверка письменных работ и т.д.

#### **11. Перечень информационных технологий, используемых при осуществлении образовательного процесса по дисциплине, включая перечень программного обеспечения и информационных справочных систем**

При осуществлении образовательного процесса по дисциплине используются информационно-коммуникационные технологии с выходом в Интернет, разработки ЦОР (видеоопыты и др), аудитория оснащенная компьютером и видеопроектором, программное обеспечение программное обеспечение (программы 3D Viever, MDL ISIS, 7.0 Origin, HyperChem 7.5, Gaussian 98, 03 и 09 и др).

#### **12. Описание материально-технической базы, необходимой для осуществления образовательного процесса по дисциплине**

В соответствии с требованиями ФГОС ВО кафедра имеет специально оборудованные лаборатории для проведения лабораторных работ и учебные аудитории для проведения лекционных занятий по потокам студентов. Лекционные помещения укомплектованы техническими средствами обучения для проведения интерактивных занятий, в том числе и с доступом в интернет (экран настенный с электроприводом и дистанционным управлением, мультимедиа проектор с ноутбуком, проводной и дистанционный интернет).

Обеспечение дисциплины осуществляется кафедрой физической и органической химии химического факультета и включает в себя приборы для физико-химического анализа (спектрофотометрия, кондуктометрия, газо-жидкостная хроматография и пр., вычислительная техника, химическое программное обеспечение.