

Министерство науки и высшего образования Российской Федерации
НАЦИОНАЛЬНЫЙ ИССЛЕДОВАТЕЛЬСКИЙ
ТОМСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ (НИ ТГУ)

Химический факультет



УТВЕРЖДАЮ:

И.о. декана химического факультета


А.С. Князев

«26» августа 2022 г.

Рабочая программа дисциплины

Органический синтез

специальности

04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия

специализация:

Фундаментальная и прикладная химия

Форма обучения

Очная

Квалификация

Химик. Преподаватель химии

Год приема

2022

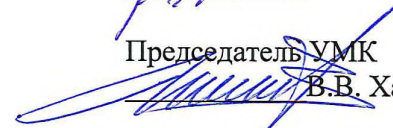
Код дисциплины в учебном плане: Б1.В.1.ДВ.01.04.01

СОГЛАСОВАНО:

Руководитель ОП


В.В. Шелковников

Председатель УМК


В.В. Хасанов

Томск – 2022

1. Цель и планируемые результаты освоения дисциплины

Целью освоения дисциплины является формирование следующих компетенций:

- ОПК-1. Способен анализировать, интерпретировать и обобщать результаты экспериментальных и расчетно-теоретических работ химической направленности;
- ОПК-2. Способен проводить химический эксперимент с использованием современного оборудования, соблюдая нормы техники безопасности;
- ОПК-6. Способен представлять результаты профессиональной деятельности в устной и письменной форме в соответствии с нормами и правилами, принятыми в профессиональном сообществе.
- ПК-1. Способен планировать работу и выбирать адекватные методы решения научно-исследовательских задач в выбранной области химии, химической технологии или смежных с химией науках.

Результатами освоения дисциплины являются следующие индикаторы достижения компетенций:

- ИОПК-1.1. Систематизирует и анализирует результаты химических экспериментов, наблюдений, измерений, а также результаты расчетов свойств веществ и материалов.
- ИОПК-1.2. Предлагает интерпретацию результатов собственных экспериментов и расчетно-теоретических работ с использованием теоретических основ традиционных и новых разделов химии.
- ИОПК-1.3. Формулирует заключения и выводы по результатам анализа литературных данных, собственных экспериментальных и расчетно-теоретических работ химической направленности.
- ИОПК-2.1. Работает с химическими веществами с соблюдением норм техники безопасности.
- ИОПК-2.2. Использует существующие и разрабатывает новые методики получения и характеристики веществ и материалов для решения задач профессиональной деятельности.
- ИОПК-2.3. Проводит исследования свойств веществ и материалов с использованием серийного научного оборудования.
- ИОПК-6.1. Представляет результаты работы в виде отчета по стандартной форме на русском языке.
- ИПК-1.1. Разрабатывает стратегию научных исследований, составляет общий план и детальные планы отдельных стадий.
- ИПК-1.2. Выбирает экспериментальные и расчетно-теоретические методы решения поставленной задачи, используя достижения современной химической науки, и исходя из имеющихся, материальных, информационных и временных ресурсов.

2. Задачи освоения дисциплины

- Освоить понятийный аппарат дисциплины
- Научиться применять изученные методы и подходы в решении научно-исследовательских задач в выбранной области химии, смежных с химией науках
- Уметь использовать полученные знания, навыки и умения для решения практических задач профессиональной деятельности

3. Место дисциплины в структуре образовательной программы

Дисциплина относится к части образовательной программы, формируемой участниками образовательных отношений, предлагается обучающимся на выбор. Дисциплина входит в модуль Органическая химия.

4. Семестр(ы) освоения и форма(ы) промежуточной аттестации по дисциплине

Седьмой семестр, экзамен

5. Входные требования для освоения дисциплины

Для успешного освоения курса «Органический синтез» студенты предварительно проходят подготовку по дисциплине «Органическая химия», где приобретают необходимые профессиональные компетенции по методам синтеза органических соединений, механизмам химических реакций, различным переходам от одних классов органических соединений к другим. Необходимо освоение курса «Физическая химия», где приобретаются необходимые знания по термодинамике и кинетике химических реакций, равновесным процессам.

6. Язык реализации

Русский

7. Объем дисциплины

Общая трудоемкость дисциплины составляет 5 з.е., 180 часов, из которых:

- лекции: 32 ч.

- лабораторные работы: 32 ч.

в том числе практическая подготовка: 32 ч.

Объем самостоятельной работы студента определен учебным планом.

8. Содержание дисциплины, структурированное по темам

Тема 1. Введение в органический синтез

Термины и понятия в сфере органического синтеза. Основной и тонкий органический синтез. История органического синтеза. Известные органики-синтетики и их открытия. Региоселективность и региоспецифичность химических реакций. Типы селективности реакций. Линейная и конвергентная схемы синтеза.

Тема 2. Защитные группы в органическом синтезе

Понятие защитной группы в органическом синтезе. Требования к защитным группам. Важнейшие защитные группы для основных классов органических соединений. Установка и снятие защитных групп. Специфические свойства кремнийорганических защитных групп. Принцип модулированной лабильности и принцип ортогональной стабильности при установке и снятии защитных групп.

Тема 3. Реакции окисления и восстановления

Химия реакций окисления и восстановления в органической химии. Понятие степени окисления элементов в органических соединениях. Реакции, протекающие с и без изменения степени окисления. Механизмы ОВР в органической химии. Типы реакций окисления: отщепление водорода, окислительное расщепление С–С-связи, замещение водорода на кислород, присоединение кислорода, окислительное сочетание. Типы реакций восстановления: атака по атому углерода, восстановление кратной связи с гетероатомом, отщепление гетероатома, восстановительное расщепление, восстановительное сочетание, асимметрическое восстановление. Реагенты Джонса, Десса-Мартина. Окисление по Кори. Окисление по Сверну. Реакции Вагнера и Прилежаева. Окисление по Вудворду и Прево. Реакция Байера-Виллигера. Восстановление по Бартону. Реакция Мак-Мурри. Реакция Стефана.

Тема 4. Перегруппировки в органическом синтезе

Общие понятия о перегруппировках. Классификация перегруппировок. Нуклеофильные (аниотропные) перегруппировки. Системы со свободным электронным секстетом. Пинаколиновая перегруппировка. Перегруппировки Майнвальда, Демьянова, Вагнера-Меервейна, Фаворского, Вольфа, Небера, Гофмана, Курциуса, Шмидта, Бекмана. Сигматропные перегруппировки. Сигматропная миграция водорода. Супраповерхностная и антраповерхностная миграции. Перегруппировка Коупа. Окси-перегруппировка Коупа. Перегруппировка Кляйзена. Перегруппировка Фишера в синтезе индолов. [5,5']-перегруппировки. Реакция Фриса.

Тема 5. Ретросинтетический анализ

Понятие ретросинтетического анализа. Формальный подход в ретросинтетическом анализе. Стратегические подходы в органическом синтезе. Планирование органического синтеза. Ретросинтетический анализ – методические подходы. Работы С. Уоррена. Основные термины ретросинтетического анализа. Типы трансформов. Понятие синтонов в ретросинтетическом анализе. Принцип альтернирования зарядов. Логичные и нелогичные синтоны. Консонантные и диссонантные структуры. «Мощные» реакции в органическом синтезе. Стратегические связи и их значение в ретросинтетическом анализе. Стабилизация анионного синтона.

Тема 6. Ретронный подход в ретросинтетическом анализе

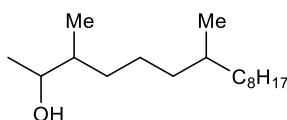
Понятие ретронов в ретросинтетическом анализе. Монофункциональные и бифункциональные ретроны. Монофункциональные ретроны на основе спиртов. Монофункциональные ретроны на основе карбонильных соединений. Бифункциональные ретроны. Внешнее и внутреннее расчленение бифункциональных ретронов. Нечётные и чётные бифункциональные ретроны. 1,1-юифункциональные ретроны. 1,3-бифункциональные ретроны. Трансформы конденсаций. 1,2-бифункциональные ретроны. Нелогичный синтон в чётных ретронах. Подходы к анализу нелогичного синтона. Принцип *Umrolung* и работы Д. Зеебаха. Превращение 1,2-ретрона в 1,1-ретрон. Анализ 1,4-ретрона. Нелогичный синтон в 1,4-ретроне. Реакции Нефа и Мак-Мурри. Расчленение 1,5-ретрона и акцептор Михаэля. Расчленение 1,6-ретрона.

Тема 7. Реакции циклизации

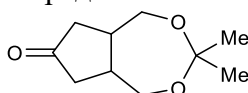
Перициклические реакции. Реакции [4+2]-циклоприсоединения. Трансформ Дильса-Альдера. Реакции Дильса-Альдера в анализе 1,6-ретронов. Подходы в реакциях Дильса-Альдера. Эндоселективность и стереоселективность в реакциях Дильса-Альдера. Метод граничных орбиталей Фукуи. Нормальные и обращённые электронные требования. Реакции [2+2] циклоприсоединения. Фотохимические и термические реакции [2+2]-циклоприсоединения. Кетены.

8.1. Примеры задач практических занятий

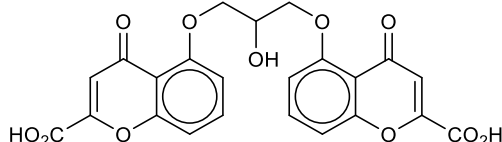
1. Провести анализ соединения – феромона соснового пилильщика и предложить способ его синтеза



2. В качестве исходного соединения для синтеза простагландинов E.J. Corey использовал бициклическое соединение. Предложите способ его синтеза



3. Предложить способ синтеза противоастматического препарата «Интал»



9. Текущий контроль по дисциплине

Текущий контроль по дисциплине проводится путем контроля посещаемости, выполнения практических задач, индивидуальных заданий и фиксируется в форме контрольной точки не менее одного раза в семестр.

10. Порядок проведения и критерии оценивания промежуточной аттестации

Экзамен в седьмом семестре проводится в письменной форме по билетам. Экзаменационный билет состоит из трех частей. Продолжительность экзамена 1,5 часа.

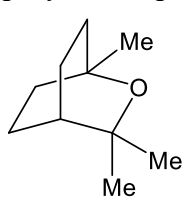
Первая часть представляет собой задание, проверяющее ИОПК-1.1., ИОПК-1.2., ИОПК-1.3. Предполагается решение задачи, краткая интерпретация полученных результатов.

Вторая часть представляет собой практическое задание, проверяющее ИОПК-2.1., ИОПК-2.2., ИОПК-2.3. Ответ предполагает решение практической задачи с пояснениями.

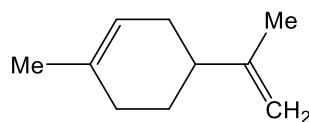
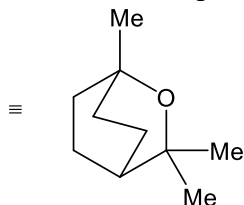
Третья часть содержит задание, проверяющее ИПК-1.1, ИПК-1.2, ИОПК-6.1 оно оформлено в виде практической задачи. Ответы на вопрос предполагают решение задачи, краткую интерпретацию полученных результатов с предложением выводов, пояснениями.

Примеры задач:

Задача 1. 1,8-цинеол является основным продуктом, содержащимся в масле эвкалиптового дерева. Он используется в качестве отхаркивающего средства, а также для лечения хронической обструктивной болезни лёгких и астмы. Проведите ретросинтетический анализ 1,8-цинеола и предложите способ его синтеза, если в результате ретросинтеза Вы придёте к лимонену (2 стадии).

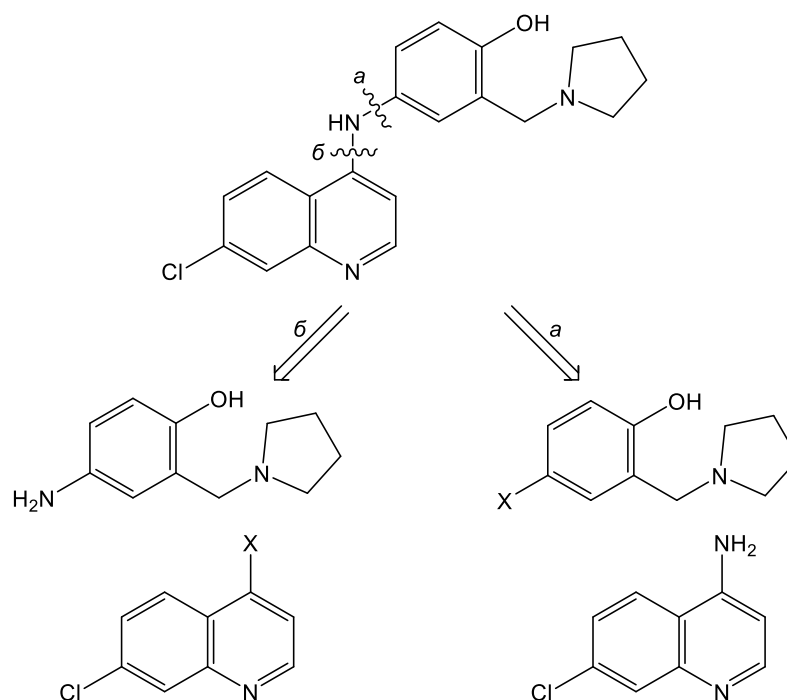


цинеол



лимонен

Задача 2. Ниже приведена формула препарата амопирохина, использующегося для лечения малярии. Начальный этап его расчленения предполагает два варианта – «а» и «б». Объясните, почему вариант ретросинтетического анализа по маршруту «а» непригоден и проведите дальнейший анализ по варианту «б», предполагая, что в итоге в качестве основных реагентов у Вас будут п-аминофенол и 3-хлоранилин.



Результаты экзамена определяются оценками «отлично», «хорошо», «удовлетворительно», «неудовлетворительно».

Для допуска к сдаче экзамена необходимо выполнение индивидуальных заданий, предусмотренных практическими занятиями. Также необходимо посещение не менее 80% практических и лекционных занятий. В результате посещения занятий, решения практических задач и индивидуальных заданий - каждый студент получает оценку: «отлично», «хорошо», «удовлетворительно», «неудовлетворительно», которая составляет 40% итоговой оценки на промежуточной аттестации.

При подготовке к экзамену следует просмотреть весь материал по сдаваемой дисциплине, отметить для себя трудные вопросы. Обязательно в них разобраться. Владеть навыками, полученными на семинарских (практических) занятиях.

Критерии оценивания для экзамена

Оценка	Характеристика ответа
«Отлично»	Работа выполнена полностью. Студент владеет теоретическим и практическим материалом, способен детально описать ход решения задачи.
«Хорошо»	Работа выполнена полностью. Студент владеет теоретическим и практическим материалом, может объяснить ход решения задачи, допущены незначительные ошибки.
«Удовлетворительно»	Работа выполнена не полностью. Студент слабо владеет теоретическим и практическим материалом.
«Неудовлетворительно»	Работа не выполнена.

11. Учебно-методическое обеспечение

а) Электронный учебный курс по дисциплине в электронном университете «Moodle» - <https://moodle.tsu.ru/enrol/index.php?id=28537>

б) Оценочные материалы текущего контроля и промежуточной аттестации по дисциплине.

в) Методические указания по проведению лабораторных работ.

г) Методические указания по организации самостоятельной работы студентов.

12. Перечень учебной литературы и ресурсов сети Интернет

а) основная литература:

- Warren S. G. Organic synthesis: The disconnection approach / S. G. Warren. – Chichester, United Kingdom: John Wiley and Sons, 2008. – 330 с.
- Wyatt P. Organic Synthesis: Strategy and Control / P. Wyatt, S. G. Warren. – Chichester, United Kingdom: John Wiley and Sons, 2007. – 910 с.
- Wuts P. G. M. Greene's protective group in organic synthesis / P. G. M. Wuts. – New Jersey: John Wiley and Sons, 2014. – 1361 с.
- Смит М. Б. Органическая химия Марча: в 4 т. / М. Б. Смит. – М. : Лаборатория знаний, 2013. – Т. 1–4.

б) дополнительная литература:

- Ласло П. Логика органического синтеза: в 2 т. / П. Ласло. – М. : Мир, 1998. – Т. 1–2.
- Corey E.J. The logic of chemical synthesis / E. J. Corey, X.-M. Cheng. – Chichester, United Kingdom: John Wiley and Sons, 1995. – 455 с.

13. Перечень информационных технологий

а) лицензионное и свободно распространяемое программное обеспечение:

- Microsoft Office Standart 2013 Russian: пакет программ. Включает приложения: MS Office Word, MS Office Excel, MS Office PowerPoint, MS Office OneNote, MS Office Publisher, MS Outlook, MS Office Web Apps (Word Excel MS PowerPoint Outlook);
- публично доступные облачные технологии (Google Docs, Яндекс диск и т.п.).
- ChemDraw Professional 2020: пакет программ.

б) информационные справочные системы:

- Электронный каталог Научной библиотеки ТГУ – <http://chamo.lib.tsu.ru/search/query?locale=ru&theme=system>
- Электронная библиотека (репозиторий) ТГУ – <http://vital.lib.tsu.ru/vital/access/manager/Index>
- ЭБС Лань – <http://e.lanbook.com/>

14. Материально-техническое обеспечение

Аудитории для проведения занятий лекционного типа.

Аудитории для проведения занятий семинарского типа, индивидуальных и групповых консультаций, текущего контроля и промежуточной аттестации.

Помещения для самостоятельной работы, оснащенные компьютерной техникой и доступом к сети Интернет, в электронную информационно-образовательную среду и к информационным справочным системам.

Аудитории для проведения занятий лекционного и семинарского типа индивидуальных и групповых консультаций, текущего контроля и промежуточной аттестации в смешанном формате («Актру»).

15. Информация о разработчиках

Мальков Виктор Сергеевич, канд. хим. наук, кафедра органической химии Национального исследовательского Томского государственного университета, доцент