

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ
**«Приднестровский государственный университет
имени Т.Г. Шевченко»**

Медицинский факультет

Кафедра фармакологии и фармацевтической химии

УТВЕРЖДАЮ:

Декан медицинского факультета,
к. фарм. н., доцент Самко Г.Н.
«26» 09 2024 г.

РАБОЧАЯ ПРОГРАММА

по дисциплине

**Б1.В.02 СОВРЕМЕННЫЕ МЕТОДЫ ОРГАНИЧЕСКОГО СИНТЕЗА
ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ**

на 2024/2025 учебный год

Специальность:

3.33.05.01 «Фармация»

Специализация

Фармация

Квалификация

Провизор

Форма обучения

Очная

Год набора **2022**

Тирасполь 2024 г.

Рабочая программа дисциплины «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ» разработана в соответствии с требованиями Государственного образовательного стандарта ВО по направлению подготовки (специальности) 33.05.01 «Фармация» и основной профессиональной образовательной программы (учебного плана) по профилю специализации «фармация».

Составитель рабочей программы:

Доцент кафедры фармакологии и
и фармацевтической химии, к.б.н


(подпись)

О.С. Анисимова

Рабочая программа утверждена на заседании кафедры фармакологии и фармацевтической химии

«28» августа 2024 г. протокол №1

Зав. кафедрой, отвечающий за реализацию дисциплины

«28» августа 2024 г.  / к.б.н, доцент Люленова В.В.

Зав. выпускающей кафедрой

«28» августа 2024 г.  / к.б.н, доцент Люленова В.В.

Курсовые проекты не предусмотрены

6. Учебно-методическое обеспечение дисциплины

6.1. Обеспеченность обучающихся учебниками, учебными пособиями

№ п/п	Наименование учебника, учебного пособия	Автор	Год издания	Ко-во экземпляров	Электронная версия	Место размещения электронной версии
Основная литература						
1	Синтез биологически активных веществ и лекарственных соединений	Бакибаев А.А., Ляпунова М.В., Мальков В.С., Паньшина С.Ю., Кущербаева В.Р.	2019	--	+	https://vital.lib.tsu.ru/vital/access/services/Download/vtls:000659752/SOURCE1 НИБЦ ГОУ ПГУ им. Т.Г. Шевченко
2	Лекарства. Прикладной тонкий органический синтез	Солдатенков А.Т., Ань Л.Т., Колядина Н.М., Ильин А.П., Хиеу Ч.Х.	2014	-	+	https://www.researchgate.net/publication/281492935_LEKARSTVA_PRIKLADNOJ_TONKIJ_ORGANI_CESKIJ_SINTEZ НИБЦ ГОУ ПГУ им. Т.Г. Шевченко
3	Синтез основных лекарственных средств	Вартанян Р.С.	2004	-	+	https://vk.com/wall-21268800_13117 НИБЦ ГОУ ПГУ им. Т.Г. Шевченко
4	Основы органической химии лекарственных веществ	Солдатенков А.Т., Колядина Н.М., Шендрик И.В.	2001	-	+	https://vk.com/wall-36914872_2172 НИБЦ ГОУ ПГУ им. Т.Г. Шевченко
Дополнительная литература						
1	Лекарства из растительных веществ	Толстикова Т.Г., Толстиков А.Г., Толстиков Г.А.	2010	-	+	https://med-books.by/farmakologiya/23851-lekarstva-iz-rastitelnyh-veschestv-tolstikova-tg-tolstikov-ag-tolstikov-ga-2010-god.html НИБЦ ГОУ ПГУ им. Т.Г. Шевченко

1. Цели и задачи освоения дисциплины

Целью освоения дисциплины «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ» является формирование представления об основных методах и этапах создания новых лекарственных веществ, принципах конструирования молекул органических соединений с заданными свойствами.

Задачи дисциплины «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ» являются:

- Создание углубленного представления о современном органическом синтезе и его месте среди других химических наук, в синтезе биологически активных веществ и лекарственных веществ
- Освоение теоретических основ органической химии, базовых принципов дизайна функциональных молекул и методах их исследования.
- Формирование глубокого понимания общих закономерностей органического синтеза.
- Обучение навыкам теоретического анализа результатов экспериментальных исследований в области химии, методам планирования эксперимента и обработки результатов, систематизирования и обобщения как уже имеющейся в литературе, так и самостоятельно полученной в ходе исследований информации.
- Формирование представлений о важнейших методах получения и модификации основных классов органических веществ,
- Приобретение навыков использования методов синтеза в решении практических задач по получению лекарственных веществ.

2. Место дисциплины в структуре ОПОП:

Дисциплина Б1.В.02 «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ» относится к вариативной части ОПОП по специальности 3.33.05.01 «Фармация». Для ее изучения необходимы знания, умения и компетенция по органической химии, в объеме, предусмотренном государственным образовательным стандартом. Изучение дисциплины «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ» способствует дальнейшему освоению других разделов (биохимия, физколлоидная химия), освоению профильных дисциплин: фармацевтическая химия, фармацевтическая технология и реализуется в 5 семестре.

3. Требования к результатам обучения по дисциплине:

Изучение дисциплины направлено на формирование компетенций, приведенных в таблице ниже

Категория (группа) компетенций	Код и наименование компетенций	Код и наименование индикатора достижения универсальной компетенции
Универсальные компетенции и индикаторы их достижения		
Системное и критическое мышление	УК-1. Способен осуществлять критический анализ проблемных ситуаций на основе системного подхода, вырабатывать стратегию действий	ИД ук-1.1 Знает: принципы сбора, отбора и обобщения информации. ИД ук-1.2 Умеет: -анализировать проблемную ситуацию как систему, выявляя ее составляющие и связи между ними;

		- определять пробелы в информации, необходимой для решения проблемной ситуации, и проектирует процессы по их устранению; - критически оценивать надежность источников информации, работать с противоречивой информацией из разных источников; ИД ук-1.3 Владеет навыками: использования логико - методологического инструментария для критической оценки современных концепций философского социального характера в своей предметной области.
Общепрофессиональные компетенции и индикаторы их достижения		
Профессиональная методология	ОПК-1 Способен использовать основные биологические, физико- химические, методы для разработки, исследований и экспертизы лекарственных средств, изготовления лекарственных препаратов	ИД опк-1.1. Знает: - основные биологические методы анализа для разработки, исследований и экспертизы лекарственных средств и лекарственного растительного сырья. - основные методы физико-химического анализа в изготовлении лекарственных препаратов. ИД опк-1.2. Умеет: — применять основные физико-химические и химические анализа для разработки, исследований и экспертизы лекарственных лекарственного растительного сырья и биологических объектов. ИД опк-1.3. Владеет: — математическими методами обработки данных, полученных в ходе разработки лекарственных средств, а также исследований и экспертизы лекарственных средств, лекарственного растительного сырья и биологических объектов.
Обязательные профессиональные компетенции и индикаторы их достижения		
Мониторинг качества, эффективности и безопасности лекарственных средств	ПК - 4. Способен участвовать в мониторинге качества, эффективности и безопасности лекарственных средств лекарственного растительного сырья.	ИД ПК - 4.1. Знает: - методы фармацевтического анализа лекарственных субстанций, вспомогательных веществ и лекарственных препаратов для медицинского применения заводского производства в соответствии со стандартами качества.

4. Структура и содержание дисциплины

4.1. Распределение трудоемкости в з.е./часах по видам аудиторной и самостоятельной работы обучающихся по семестрам:

Общая трудоемкость дисциплины составляет 4 зачетных единицы (144 часа)

Семестр	Количество часов						Форма контроля
	Трудовое мкость, з.е./час ы	В том числе				Самост. работа (СР)	
		Аудиторных					
		Всего	Лекции (Л)	Практи- ческие занятия (ЛЗ)	Лаборат орные занятия (ПЗ)		
5	4/144	63	18	45	-	45	Экзамен (36 ч)
Итого:	4/144	63	18	45	-	45	Экзамен (36 ч)

4.2. Распределение видов учебной работы и их трудоемкости по разделам дисциплины.

№ раздела	Наименование разделов	Всего	Количество часов			
			Аудиторная работа			СР
			Л	ПЗ	ЛЗ	
1	Введение. Тактика и стратегия создания новых лекарственных веществ	14	4	4	-	6
2	Реакции электрофильного замещения в синтезе ЛВ	50	8	24	-	18
3	Реакции нуклеофильного замещения, конденсации, гетероциклизации, diazotирования, окисления, восстановления в синтезе ЛВ.	44	6	17	-	21
	Экзамен	36	-	-	-	36
ИТОГО:		144	18	45	-	81

4.3. Тематический план по видам учебной деятельности.

Лекции

№ п/п	Номер раздела дисциплины	Объем часов	Тема лекции	Учебно-наглядные пособия
Раздел 1. Введение. Тактика и стратегия создания новых лекарственных веществ				
1	1	2	Общие понятия о лекарственных веществах. Основные термины и понятия. Классификация ЛВ, современные требования к ЛВ. Основные этапы создания новых лекарственных средств.	Интерактивная доска, мультимедийная презентация, анимации и видео
2	1	2	Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ. Основные принципы создания новых ЛВ. Связь структура – биологическая активность	Интерактивная доска, мультимедийная презентация, анимации и видео
Итого по разделу часов		4		
Раздел 2. Реакции электрофильного замещения в синтезе ЛВ				
3	2	2	Реакции электрофильного замещения. Теоретические вопросы, механизм реакции, реагенты. Нитрование, нитрозирование. Нитрующие агенты, нитрующие смеси. Механизм реакции нитрования	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
4	2	2	Сульфирование. Сульфохлорирование. Сульфлирующие агенты. Механизм реакции сульфирования	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
5	2	2	Галогенирование. Прямое и не прямое галогенирование. Галогенирующие агенты. Механизм реакции галогенирования	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
6	2	2	Введение углеродных остатков в ароматическое и гетероциклическое ядро. Алкилирование. Алкилирующие агенты. Механизм реакции алкилирования	Схемы, таблицы, доска, цветной мел

Итого по разделу часов	8			
Раздел 3. Реакции нуклеофильного замещения, конденсации, гетероциклизации, диазотирования, окисления, восстановления в синтезе ЛВ.				
7	3	2	Реакции нуклеофильного замещения. Теоретические вопросы, механизм реакции, реагенты. Ацилирование. Ацилирующие агенты. Механизм реакции ацилирования	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
8	3	2	Реакции окисления, восстановления, аминирования, гидроксирования. Реагенты, особенности механизмов реакций	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
9	3	2	Реакции диазотирования, конденсации, гетероциклизации. Реагенты, особенности механизмов реакций.	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
Итого по разделу часов	6			
Итого	18			

Практические занятия

№ п/п	Номер раздела дисциплины	Объем часов	Тема практических занятий	Учебно-наглядные пособия
Раздел 1. Введение. Тактика и стратегия создания новых лекарственных веществ				
1	1	2	Входной контроль знаний <i>Тесты</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
			<u>Практическое занятие 1.</u> Номенклатура органических веществ, связь с названиями ЛВ. функциональные группы, присутствующие в ЛВ, фармакофорные группы. <i>Решение ситуационных задач</i>	
2	1	2	<u>Семинар 1.</u> Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ. Основные принципы создания новых ЛВ. <i>Заслушивание докладов. обсуждение</i>	Компьютер, проектор, экран

Итого по разделу часов		4		
Раздел 2. Реакции электрофильного замещения в синтезе ЛВ				
3	1	2	<u>Практическое занятие 2.</u> Выход, количество стадий, доступность реагентов, селективность реакций. Типы реакций в органической химии, типы реакционных частиц. <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
4	2	2	<u>Семинар 2.</u> Реакции нитрования как один из этапов синтеза ЛВ. <i>Заслушивание докладов. Решение ситуационных задач. Беседа.</i> <u>Практическое занятие 3.</u> Реакции нитрования. <i>Решение ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
5	2	2	<u>Практическое занятие 4</u> Реакции нитрования и нитрозирования. <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
6		2	<u>Семинар 3</u> Реакции сульфирования и сульфохлорирования как один из этапов синтеза ЛВ. <i>Заслушивание докладов. Решение ситуационных задач. Беседа.</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
7	2	2	<u>Практическое занятие 5</u> Реакции сульфирования и сульфохлорирования. <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
8	2	2	<u>Контрольная работа №1</u> по теме «Основные этапы создания новых лекарственных средств. Стратегия и тактика органического синтеза. Реакции электрофильного замещения: нитрование, нитрозирование, сульфирование»	Варианты заданий Схемы, таблицы, Таблица Менделеева
9	2	2	<u>Семинар 4.</u> Реакции галогенирования как один из этапов синтеза ЛВ. <i>Заслушивание докладов. Решение ситуационных задач. Беседа.</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева

10-11	2	4	<u>Практическое занятие 6-7.</u> Реакции галогенирования. <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
12	2	2	<u>Семинар 5.</u> Реакции алкилирования как один из этапов синтеза ЛВ. <i>Заслушивание докладов. Решение ситуационных задач. Беседа.</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
13	2	2	<u>Практическое занятие 8-9</u> Реакции алкилирования. <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
14	2	2	Контрольная работа №2 по теме «реакции электрофильного замещения: галогенирование, алкилирование»	Варианты заданий Схемы, таблицы, Таблица Менделеева
Итого по разделу часов		24		
Раздел 3. Реакции нуклеофильного замещения, конденсации, гетероциклизации, диазотирования, окисления, восстановления в синтезе ЛВ				
15	3	2	<u>Практическое занятие 10.</u> Реакции нуклеофильного замещения галогензамещенных алканов, ароматических соединений, нуклеофильное присоединение. <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
16	3	2	<u>Семинар 6.</u> Реакции ацилирования как один из этапов синтеза ЛВ. Реакция нуклеофильного замещения. Сравнение механизмов S _N 1 и S _N 2. Сравнение механизмов электрофильного и нуклеофильного замещения в бензольном кольце.	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
17	3	2	<u>Практическое занятие 11.</u> Реакции ацилирования. <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
18	3	2	<u>Практическое занятие 12.</u> Реакции окисления, восстановления, аминирования, гидроксирования <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева

19	3	2	<u>Практическое занятие 13.</u> Реакции diazotирования, конденсации <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
20	3	2	<u>Практическое занятие 14.</u> Реакции гетероциклизации <i>Решение расчетных и ситуационных задач</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел, Таблица Менделеева
21	3	2	<u>Семинар 7.</u> Реакции нуклеофильного замещения и присоединения, окисления, восстановления, аминирования, гидроксилирования, гетероциклизации как один из этапов синтеза ЛВ <i>Заслушивание докладов. Решение ситуационных задач. Беседа.</i>	Схемы, таблицы, доска, цветной мел,
22	3	2	<u>Контрольная работа №3</u> по теме «реакции нуклеофильного замещения. Реакции ацилирования, окисления, восстановления, аминирования, гидроксилирования, конденсации, гетероциклизации, diazotирования »	Варианты заданий Схемы, таблицы, Таблица Менделеева
23	3	1	<u>Итоговое занятие</u> Обобщение материала	Схемы, таблицы, доска, цветной мел
Итого по разделу часов		17		
Итого		45		

Лабораторные занятия не предусмотрены.
Самостоятельная работа обучающихся

Раздел дисциплины	№ п/п	Тема и вид самостоятельной работы обучающегося	Трудоемк ость, часов
Раздел 1	1	Введение. Тактика и стратегия создания новых лекарственных веществ. Вид работы: ИДЛ	3
	2	Тактика и стратегия создания новых лекарственных веществ. Вид работы: ИДЛ, ПР, РФ	3
Итого по разделу часов			6

Раздел 2	1	Выход, количество стадий, доступность реагентов, селективность реакций. Типы реакций в органической химии, типы реакционных частиц. Вид работы: ИДЛ, ДЗ	3
	2	Реакции нитрования как один из этапов синтеза ЛВ. Вид работы: ИДЛ, ПР, РФ	3
	3	Реакции нитрования, сульфирование и сульфохлорирования. Вид работы: ИДЛ, ДЗ	3
	4	Реакции сульфирования и сульфохлорирования как один из этапов синтеза ЛВ. Вид работы: ИДЛ, ПР, РФ	3
	5	Реакции галогенирования. Вид работы: ИДЛ, ДЗ	3
	6	Реакции галогенирования как один из этапов синтеза ЛВ. Вид работы: ИДЛ, ПР, РФ	3
Итого по разделу часов			18
Раздел 3	1	Реакции алкилирования и ацилирования. Вид работы: ИДЛ, ДЗ	3
	2	Реакции алкилирования и ацилирования как один из этапов синтеза ЛВ. Вид работы: ИДЛ, ПР, РФ	3
	3	Реакции нуклеофильного замещения. Сравнение механизмов S_N1 и S_N2 . Сравнение механизмов электрофильного и нуклеофильного замещения в бензольном кольце. Вид работы: ИДЛ, ПР, РФ	3
	4	Реакции нуклеофильного замещения, конденсации, гетероциклизации, диазотирования, окисления, восстановления в синтезе ЛВ. Вид работы: ИДЛ, ПР, РФ	3
	5	Нуклеофильное замещение галогензамещенных алканов, ароматических соединений, нуклеофильное присоединение. Вид работы: ИДЛ, ДЗ	3
	6	Реакции нуклеофильного замещения и присоединения, конденсации, гетероциклизации, диазотирования, окисления, восстановления как один из этапов синтеза ЛВ. Вид работы: ИДЛ, ПР, РФ	3
	7	Реакции конденсации, гетероциклизации, диазотирования, восстановления, окисления. Вид работы: ИДЛ, ДЗ	3
Итого по разделу часов			21
ИТОГО			45

Примечания: ДЗ – выполнение домашнего задания; ИДЛ – изучение дополнительной литературы; ПР – презентация; РФ - реферат

5. Примерная тематика курсовых проектов (работ)

2	Практикум по органической химии	Гитис С.С. Глаз. А.И. Иванов А.В.	1991	-	+	https://vk.com/wall-29290148_55180 НИБЦ ГОУ ПГУ им. Т.Г. Шевченко
3	Органический синтез: учебное пособие	Великородов А.В.	2016	-	+	https://obuchalka.org/2016061889740/orga-nicheski-sintez-velikorodov-a-v-2016.html НИБЦ ГОУ ПГУ им. Т.Г. Шевченко
4	Основные принципы конструирования лекарств. Монография	Жунгиету Г.И., Граник В.Г.	2000	-	+	https://vk.com/wall-66567433_42630 НИБЦ ГОУ ПГУ им. Т.Г. Шевченко
Итого по дисциплине: 100 % электронных изданий 0% печатных						

6.2. Программное обеспечение и Интернет-ресурсы

1. Remedium.ru: Профессиоанально о медицине и фармации [Электронный ресурс]. – Режим доступа <http://www.remedium.ru>
2. Новости GMP – Стандарт GMP – Фармацевтические производства и технологии [Электронный ресурс]. – Режим доступа <http://www.gmpnews.ru>
3. Ассоциация Российских фармацевтических производителей [Электронный ресурс]. – Режим доступа <http://www.arfp.ru>
4. www.elibrary.ru
5. www.rusbiotech.ru
6. www.pushgu.ru
7. www.microbiologu.ru
8. www.library.krasu.ru
9. www.zges.ru
10. www.activestudy.info
11. <http://moodle.spsu.ru/course/view.php?id=3153>

6.3. Методические указания и материалы по видам занятий

В разработке

7. Материально-техническое обеспечение дисциплины

Занятия по дисциплине «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ» проходят учебной аудитории кафедры фармакологии и фармацевтической химии в корпусе медицинского факультета. Аудитории оборудованы оборудованием, перечисленным ниже.

Медиа-оборудование

1. компьютер/ноутбук;
2. мультимедийный проектор;
3. экран

8. Методические рекомендации по организации изучения дисциплины:

В учебном процессе дисциплины положен подход к отбору методов обучения, согласно которому основным критерием успешности новых образовательных технологий является обучение обучающихся самостоятельности, что предполагает формирование критического мышления, инициативности, умения видеть проблему, умения задавать

вопросы, умения перерабатывать информацию, разрешать проблемные ситуации, эрудированности, умения прогнозировать, творческого мышления.

Чтение курса обеспечивает внедрение системы управления качеством обучения за счет создания методических материалов нового поколения, выполняющих функцию управления познавательной деятельностью обучающихся; реализации новой парадигмы образования («я учусь» вместо «меня учат»).

Лекционный материал сформирован главным образом в виде лекций-дискуссий (с использованием ТСО, IT-технологий). Комплексное применение технических средств обучения представляется одним из наиболее важных путей совершенствования преподавания. Обучающиеся по окончании занятия могут получить файл с его записью, который можно дома просмотреть на персональном компьютере в пошаговом режиме. При этом становятся доступны предлагаемые преподавателем иллюстрации и записи по конкретному занятию.

Практические занятия проводятся на базе аудиторного фонда и лаборатории кафедры фармакологии и фармацевтической химии. Общая направленность практических занятий - максимальное приближение к практике использования изучаемых средств и явлений.

9. Технологическая карта дисциплины

Курс 3, группа 305 МФ20ДР65ФЦ1, АП 308/ АКП 311
семестр 5

Лектор: к.б.н., Анисимова Оксана Сергеевна

Преподаватель, ведущий практические занятия: к.б.н., Анисимова Оксана Сергеевна