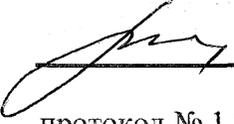


Медицинский факультет

Кафедра фармакологии и фармацевтической химии

УТВЕРЖДАЮ

Зав. кафедры-разработчика

 к.б.н, доцент Люленова В.В.

протокол № 1 « 28 » 08 2024 г.

**ФОНД ОЦЕНОЧНЫХ СРЕДСТВ**  
по дисциплине

**Б1.В. 02 «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ»**

Специальность:

3.33.05.01 Фармация

Специализация:

Фармация

Квалификация

Провизор

Форма обучения

Очная

2021 ГОД НАБОРА

Разработал: к.б.н.



О.С. Анисимова

« 28 » 08 2024г.

Тирасполь, 2024

**Паспорт фонда оценочных средств по учебной дисциплине  
«Современные методы органического синтеза лекарственных веществ»**

1. В результате изучения дисциплины «*Современные методы органического синтеза лекарственных веществ*» у обучающихся должны быть сформированы следующие компетенции

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, выработать стратегию действий	<b>ИД</b> ук-1.1 <b>Знает:</b> принципы сбора, отбора и обобщения информации. <b>ИД</b> ук-1.2 <b>Умеет:</b> -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; <b>ИД</b> ук-1.3 <b>Владеет навыками:</b> 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	<b>ИД</b> оПК-1.1. <b>Знает:</b> - основные биологические методы анализа для разработки, исследований и экспертизы лекарственных средств и лекарственного растительного сырья. - основные методы физико-химического анализа в изготовлении лекарственных препара- тов. <b>ИД</b> оПК-1.2. <b>Умеет:</b> – применять основные физико- химические и химические анализа для разработки, исследований и экспертизы лекарственных лекарственного растительного сырья и биологических объектов. <b>ИД</b> оПК-1.3. <b>Владеет:</b> – математическими методами обработки данных, полученных в ходе разработки лекарственных средств, а также исследований и экспертизы лекарственных средств, лекарственного растительного сырья и биологических объектов.
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.	<b>ИД</b> ПК - 4.1. <b>Знает:</b> - методы фармацевтического анализа лекарственных субстанций, вспомогательных веществ и лекарственных препаратов для медицинского применения заводского производства в соответствии со стандартами качества.

## 2.Программа оценивания контролируемой компетенции:

Текущая аттестация	Контролируемые модули, разделы (темы) дисциплины и их наименование	Код контролируемой компетенции (или ее части)	Наименование оценочного средства
1	Раздел 1. Введение. Тактика и стратегия создания новых лекарственных веществ	УК-1 ОПК-1	Доклад Собеседование
2	Раздел 2. Реакции электрофильного замещения в синтезе ЛВ	УК-1 ОПК-1 ПК-4	Доклад Контрольная работа

3	Раздел 3. Реакции нуклеофильного замещения, конденсации, гетероциклизации, диазотирования, окисления, восстановления в синтезе ЛВ	УК-1 ОПК-1 ПК-4	Доклад Контрольная работа
<b>Промежуточная аттестация</b>		<b>Код контролируемой компетенции (или ее части)</b>	<b>Наименование оценочного средства</b>
<b>Экзамен</b>		УК-1 ОПК-1 ПК-4	вопросы к экзамену

Государственное образовательное учреждение высшего образования  
«ПРИДНЕСТРОВСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ им. Т.Г. Шевченко»

**медицинский факультет**

*кафедра фармакологии и фармацевтической химии*

**СОБЕСЕДОВАНИЕ**

По дисциплине «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ»

Тема «Тактика и стратегия создания новых лекарственных веществ»

**Контрольные вопросы:**

1. Классификация лекарственных средств.
2. Современные требования к лекарственным веществам
3. Основные этапы создания новых лекарственных средств. Этап первый - создание новой активной субстанции
4. Основные этапы создания новых лекарственных средств. Этап второй - доклинические исследования
5. Основные этапы создания новых лекарственных средств. Этап третий - клинические исследования
6. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: принцип химического модифицирования структуры,
7. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: принцип введения фармакофорной группы,
8. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: принцип молекулярного моделирования
9. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: стратегия пролекарств,
10. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: концепция антиметаболитов,
11. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: методология комбинаторной химии
12. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: связь структура – биологическая активность
13. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: метод QSAR

**Критерии оценки:**

- Оценка «*зачтено*» выставляется студенту, если студент ответил на теоретические вопросы точно или с некоторыми затруднениями.
- Оценка «*не зачтено*» выставляется студенту, если студент не ответил на теоретические вопросы или ответил лишь частично.

Составитель: \_\_\_\_\_ О.С. Анисимова

« \_\_\_\_ » \_\_\_\_\_ 2023 г.

Государственное образовательное учреждение высшего образования  
«ПРИДНЕСТРОВСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ им. Т.Г. Шевченко»

**медицинский факультет**

*кафедра фармакологии и фармацевтической химии*

**ДОКЛАД**

По дисциплине «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ»

Тема «Тактика и стратегия создания новых лекарственных веществ»

**Темы докладов**

1. Принципы комбинаторной химии
2. Принципы сочетательной химии
3. Метод QSAR
4. Токсикологические исследования новых лекарственных веществ
5. Клинические исследования новых лекарственных веществ
6. Пути создания дженериков
7. Фатальные побочные действия лекарств
8. Лекарственные вещества, полученные случайно
9. Лекарственные вещества, полученные целенаправленно
10. Биотрансформация лекарственных веществ

Тема Реакции электрофильного замещения в синтезе ЛВ: нитрование, нитрозирование, сульфирование

**Темы докладов**

1. Синтез анестетиков с использованием процесса нитрования
2. Синтез анестетиков с использованием процесса нитроирования
3. Синтез анестетиков с использованием процесса сульфирования
4. Синтез анальгетиков с использованием процесса нитрования
5. Синтез анальгетиков с использованием процесса нитроирования
6. Синтез анальгетиков с использованием процесса сульфирования
7. Синтез нейролептиков с использованием процесса нитрования
8. Синтез нейролептиков с использованием процесса нитроирования
9. Синтез нейролептиков с использованием процесса сульфирования
10. Синтез противосудорожных веществ с использованием процесса нитрования
11. Синтез противосудорожных веществ с использованием процесса нитроирования
12. Синтез противосудорожных веществ с использованием процесса сульфирования
13. Синтез кардиотонических и антиаритмических веществ с использованием процесса нитрования
14. Синтез кардиотонических и антиаритмических веществ с использованием процесса нитроирования
15. Синтез кардиотонических и антиаритмических веществ с использованием процесса сульфирования

Тема Реакции электрофильного замещения в синтезе ЛВ: галогенирование и алкилирование

**Темы докладов**

1. Синтез анестетиков с использованием процесса галогенирования
2. Синтез анестетиков с использованием процесса алкилирования
3. Синтез анестетиков с использованием процесса ацилирования
4. Синтез анальгетиков с использованием процесса галогенирования

5. Синтез анальгетиков с использованием процесса алкилирования
6. Синтез анальгетиков с использованием процесса ацилирования
7. Синтез нейролептиков с использованием процесса галогенирования
8. Синтез нейролептиков с использованием процесса алкилирования
9. Синтез нейролептиков с использованием процесса ацилирования
10. Синтез противоэпилептических веществ с использованием процесса галогенирования
11. Синтез противоэпилептических веществ с использованием процесса алкилирования
12. Синтез противоэпилептических веществ с использованием процесса ацилирования
13. Синтез кардиотонических и антиаритмических веществ с использованием процесса галогенирования
14. Синтез кардиотонических и антиаритмических веществ с использованием процесса алкилирования
15. Синтез кардиотонических и антиаритмических веществ с использованием процесса ацилирования

Тема Реакции нуклеофильного замещения, конденсации, гетероциклизации, диазотирования, окисления, восстановления в синтезе ЛВ.

#### Темы докладов

1. Синтез анестетиков с использованием процесса конденсации
2. Синтез анестетиков с использованием процесса гетероциклизации
3. Синтез анестетиков с использованием процесса окисления
4. Синтез анестетиков с использованием процесса восстановления
5. Синтез анестетиков с использованием процесса аминирования
6. Синтез анальгетиков с использованием процесса конденсации
7. Синтез анальгетиков с использованием процесса гетероциклизации
8. Синтез анальгетиков с использованием процесса окисления
9. Синтез анальгетиков с использованием процесса восстановления
10. Синтез анальгетиков с использованием процесса аминирования
11. Синтез нейролептиков с использованием процесса конденсации
12. Синтез нейролептиков с использованием процесса гетероциклизации
13. Синтез нейролептиков с использованием процесса окисления
14. Синтез нейролептиков с использованием процесса восстановления
15. Синтез нейролептиков с использованием процесса аминирования

#### Критерии оценки:

- Оценка «*зачтено*» выставляется студенту, если содержание доклада соответствует заявленной в названии тематике, в тексте доклада отсутствуют или имеются незначительные логические нарушения в представлении материала; представлен анализ найденного материала.

- Оценка «*не зачтено*» выставляется студенту, если содержание доклада не соответствует заявленной в названии тематике, в тексте доклада имеются значительные логические нарушения в представлении материала; не представлен анализ найденного материала.

Составитель: \_\_\_\_\_ О.С. Анисимова

« \_\_\_\_ » \_\_\_\_\_ 2023 г.

**медицинский факультет**

*кафедра фармакологии и фармацевтической химии*

**КОНТРОЛЬНАЯ РАБОТА**

По дисциплине «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ»

**Тема:** Реакции электрофильного замещения в синтезе ЛВ: нитрование, нитрозирование, сульфирование

**Контрольная работа №1**

**Вариант I**

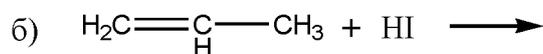
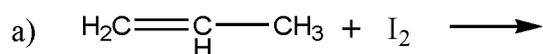
1. Дайте определение понятию «лекарственный препарат»
2. На какие группы делятся ЛВ по источнику получения
3. Перечислите этапы создания нового ЛВ
4. Раскройте сущность III фазы клинических исследований нового ЛВ
5. В чем заключается концепция антиметаболитов
6. Объясните, что такое фармакофорная группа
7. Обозначьте аббревиатурой следующие типы органических реакций:
  - а) свободнорадикальное присоединение
  - б) нуклеофильное замещение
  - в) электрофильное элиминирование
8. Чем отличается нитрование от нитроирования?
9. Перечислите реагенты для введения группы  $\text{SO}_2\text{Cl}$
10. На примере нитрования бензола покажите механизм процесса нитрования
11. Напишите уравнение реакции получения п-фенолхлорсульфокислоты, о-фенолхлорсульфокислоты, из фенола. Укажите условия проведения реакций.
12. Напишите уравнения реакций:
  - а) о-ксилол +  $\text{NaNO}_2 + \text{HCl}$  (при охлаждении)
  - б) п-сульфофенол +  $\text{NaNO}_2 + \text{HCl}$  (при нагревании)
  - в) анилин +  $\text{H}_2\text{SO}_4$  (140-160°C)
  - г) толуол +  $\text{SO}_2\text{Cl}_2$  (ультрафиолет)
13. Определите количество реагентов для получения 100 г β-нафталинсульфокислоты из нафталина и серной кислоты, если используется 96% серная кислота с коэффициентом избытка 1,5. Практический выход продукта составляет 85% Укажите условия проведения реакции.

**Тема:** Реакции электрофильного замещения в синтезе ЛВ: галогенирование, алкилирование, ацилирование

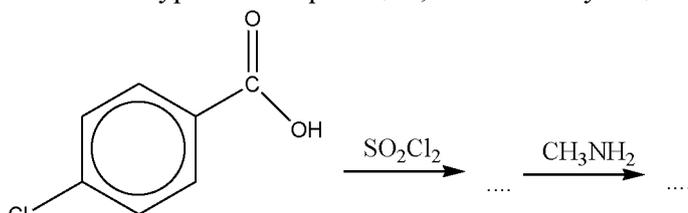
### Контрольная работа №2

#### Вариант II

1. Перечислите алкилирующие агенты
2. Распределите процессы фторирования, хлорирования, бромирования и йодирования по скорости протекания реакции. Какие из этих процессов применяются на практике, а какие не применяются и почему?
3. Приведите 2 примера O-ацилирования, используя разные ацилирующие агенты
4. На примере ацилирования толуола хлорангидридом пропионовой кислоты в среде  $\text{CHCl}_3$  покажите механизм реакции Фриделя-Крафтса
5. Напишите уравнения реакций наиболее эффективного получения следующих соединений:
  - а) метиламин
  - б) метилэтиламин
  - в) диэтилметиламин
6. Используя различные примеры, опишите процессы галогенирования карбонильных соединений
7. Напишите уравнения реакций с указанием всех продуктов:



8. Напишите уравнения реакций, соответствующих цепочке превращений



9. При взаимодействии 12 г анилина и 30 бромэтила было получено 4,5 г моноэтилфениламина и 9,8 г диэтилфениламина. Определите выход диэтилфениламина от теоретического и степень превращения анилина.

**Тема** Реакции нуклеофильного замещения, конденсации, гетероциклизации, диазотирования, окисления, восстановления в синтезе ЛВ.

### Контрольная работа №3

#### Вариант III

1. Дайте определение понятию «нуклеофуг»
2. Приведите 2 примера n-нуклеофилов
3. Покажите механизм реакции нуклеофильного замещения на примере взаимодействия 3-бром-3-метилпентана с диэтиламино

4. Почему ароматические соединения гораздо легче вступают в реакции электрофильного замещения, чем нуклеофильного замещения?
5. Покажите механизм реакции нуклеофильного замещения на примере взаимодействия п-нитрохлорбензола с ацетатом натрия
6. Напишите уравнение реакции получения вторбутилового спирта из пропионола с помощью реактива Гриньяра
7. Перечислите гидроксимирующие агенты
8. Осуществите превращение бензола в 1,2-дигидрокси-3-фенилпропан за несколько стадий
9. Напишите формулу продукта гетероциклизации 3-кето-2-метилбутанала и сероводорода
10. Из каких исходных веществ можно гетероциклизацией получить 4,5-диметилпиридазин

#### **Критерии оценки:**

Оценка «5» - работа выполнена самостоятельно, ответы на теоретические вопросы полные и развернутые. Задания выполнены с учетом построения логических связей, расчетные задачи решены правильно и оформлены с учетом общепринятых требований

Оценка «4» - работа выполнена самостоятельно, ответы на теоретические вопросы верные, но недостаточно полные или развернутые. Задания выполнены с учетом построения логических связей, расчетные задачи решены правильно и оформлены с учетом общепринятых требований. Допущено не более трех несущественных ошибок или одна существенная

Оценка «3» - работа выполнена самостоятельно, ответы на теоретические вопросы частично верные, не развернутые. Задания выполнены с ошибками в логических рассуждениях, расчетные задачи решены неверно, оформлены с учетом общепринятых требований. Допущено не более трех существенных ошибок.

Оценка «2» - работа выполнена не самостоятельно, ответы на теоретические вопросы отсутствуют или только отчасти верные, не развернутые. Задания не выполнены или выполнены с ошибками в логических рассуждениях, расчетные задачи решены неверно, оформлены без учета общепринятых требований. Допущено более трех существенных ошибок.

Составитель: \_\_\_\_\_ О.С. Анисимова

« \_\_\_\_ » \_\_\_\_\_ 2023 г.

Государственное образовательное учреждение высшего образования  
«ПРИДНЕСТРОВСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ им. Т.Г. Шевченко»

**медицинский факультет**

*кафедра фармакологии и фармацевтической химии*

**ЭКЗАМЕН**

По дисциплине «Современные методы органического синтеза лекарственных веществ»

***Вопросы для подготовки к экзамену***

1. Классификация лекарственных средств. Современные требования к лекарственным веществам
2. Основные этапы создания новых лекарственных средств. Этап первый - создание новой активной субстанции
3. Основные этапы создания новых лекарственных средств. Этап второй - доклинические исследования
4. Основные этапы создания новых лекарственных средств. Этап третий - клинические исследования
5. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: принцип химического модифицирования структуры, принцип введения фармакофорной группы, принцип молекулярного моделирования
6. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: стратегия пролекарств, концепция антиметаболитов, методология комбинаторной химии
7. Основы стратегии создания новых синтетических лекарственных веществ: связь структура – биологическая активность
8. Основные механизмы протекания реакций
9. Реакции нитрования и нитрозирования: механизм реакции, нитрующие и нитрозирующие агенты, влияние условий реакции на процессы
10. Реакции сульфирования: механизм реакции, сульфлирующие агенты, влияние условий реакции на процесс сульфирования
11. Реакции сульфохлорирования: механизм реакции, сульфохлорирующие агенты, влияние условий реакции на процесс сульфохлорирования
12. Реакции галогенирования: галогенирующие агенты, катализаторы процесса, влияние условий реакции на процесс замещение одних галогенов на другие
13. Галогенирование алканов, алкенов и боковой цепи аренов: механизм реакции, особенности процессов
14. Галогенирование аренов, карбонильных и карбоксильных соединений
15. Реакции алкилирования: алкилирующие агенты, механизм реакций алкилирования аренов, аминов, алкенов, спиртов и фенолов
16. Реакции ацилирования: ацилирующие агенты, механизм реакции ацилирования спиртов и фенолов, аминов, аренов
17. Реакции нуклеофильного замещения в алифатическом ряду
18. Реакции нуклеофильного замещения в ароматическом ряду
19. Реакции нуклеофильного присоединения

20. Реакции окисления: агенты-окислители, механизм реакции, конечные продукты окисления

21. Реакции восстановления: агенты-восстановители, катализаторы процесса, конечные продукты восстановления

22. Реакции конденсации: конденсирующие агенты, механизм реакции, конечные продукты конденсации

23. Реакции диазотирования: получение солей диазония, механизм реакции, конечные продукты диазотирования и их свойства

24. Реакции гидроксирования: гидроксильные агенты, механизм реакции, конечные продукты гидроксирования

25. Реакции аминирования: аминирующие агенты, механизм реакции, конечные продукты аминирования

26. Гетероциклизация. Общие принципы получения гетероциклических соединений

#### **Критерии оценки:**

**«отлично»** - отличное владение всеми компетенциями, в ответе отлично ориентирован (либо возможны единичные незначительные ошибки) в сути и принципах современных методов синтеза ЛВ; легко их объясняет, отлично владеет практическими навыками; в подготовке использована дополнительная научная литература.

**«хорошо»** - хорошее владение необходимыми компетенциями, ответ выше среднего уровня, допускает 1-2 ошибки в знании отдельных принципов современных методов синтеза ЛВ, но не в построении общей логической цепи, очень хорошо владеет практическими навыками; в подготовке использована дополнительная учебная литература.

**«удовлетворительно»** - значительное количество недостатков в знании отдельных принципов современных методов синтеза ЛВ, цепь логических рассуждений в объяснении оказывается не полной, относительно хорошо владеет практическими навыками; в подготовке использована только основная учебная литература.

**«неудовлетворительно»** - владеет не всеми необходимыми компетенциями, с материалом качественно не знаком, не способен выстраивать логические связи на основании предыдущего материала или учебного материала, полученных на других дисциплинах.

Составитель: \_\_\_\_\_ О.С. Анисимова

« \_\_\_\_ » \_\_\_\_\_ 2023 г.