

Федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение
высшего образования
«Московский государственный университет имени М.В. Ломоносова»
Химический факультет

УТВЕРЖДАЮ

Декан химического факультета,
Акад. РАН, профессор



/В.В. Лунин/

«27» февраля 2017 г.

РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)

Стратегия органического синтеза

Уровень высшего образования:

Специалитет

Направление подготовки (специальность):

04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия

Направленность (профиль) ОПОП:

Органическая химия

Форма обучения:

очная

Рабочая программа рассмотрена и одобрена
Учебно-методической комиссией факультета
(протокол №1 от 27.01.2017)

Москва 2017

Рабочая программа дисциплины разработана в соответствии с самостоятельно установленным МГУ образовательным стандартом (ОС МГУ) для реализуемых основных профессиональных образовательных программ высшего образования по направлению подготовки / специальности 04.05.01 «Фундаментальная и прикладная химия» (программа специалитета), утвержденного приказом МГУ от 22 июля 2011 года № 729 (в редакции приказов МГУ от 22 ноября 2011 года № 1066, от 21 декабря 2011 года № 1228, от 30 декабря 2011 года № 1289, от 27 апреля 2012 года № 303, от 30 декабря 2016 года № 1671).

Год (годы) приема на обучение 2014/2015, 2015/2016, 2016/2017, 2017/2018, 2018/2019

1. Наименование дисциплины (модуля) **Стратегия органического синтеза**
2. Уровень высшего образования – **специалитет.**
3. Направление подготовки: **04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия.**
4. Место дисциплины (модуля) в структуре ООП: вариативная часть ООП, блок ПД.
5. Планируемые результаты обучения по дисциплине, соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы (компетенциями выпускников)

Компетенция	Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю)
ОПК-1.С. Способность решать современные проблемы фундаментальной и прикладной химии, используя методологию научного подхода и систему фундаментальных химических понятий и законов	Уметь анализировать научную литературу с целью выбора направления и методов, применяемых в исследовании по теме выпускной квалификационной работы, Уметь: самостоятельно составлять план исследования Владеть навыками поиска, критического анализа, обобщения и систематизации научной информации, постановки целей исследования и выбора оптимальных путей и методов их достижения
СПК-1.С. Способность использовать фундаментальные понятия органической химии и основные теоретические подходы к изучению механизмов реакций органических соединений при решении задач профессиональной деятельности	Знать: систематические подходы, используемые в ретросинтетическом анализе и набор базовых структурных единиц - ретронов , на которых основано планирование многостадийных синтезов. Уметь: найти в целевой молекуле входящие в ее структуру ретроны и в соответствии с этим провести расчленения молекулы
СПК-3.С. Способность самостоятельно оптимизировать условия проведения конкретной реакции исходя из базовых теоретических представлений о механизме реакции и факторах, определяющих реакционную способность	Знать: основные реагенты, используемые в органическом синтезе, и области применения этих реагентов. Уметь: составлять план химического синтеза, и оценивать его реальную осуществимость.

6. Объем дисциплины в зачетных единицах с указанием количества академических или астрономических часов, выделенных на контактную работу обучающихся с преподавателем (по видам учебных занятий) и на самостоятельную работу обучающихся:

Объем дисциплины (модуля) составляет 4 зачетных единицы, всего 144 часа, из которых 78 часов составляет контактная работа студента с преподавателем (36 часов занятия лекционного типа, 36 часов – занятия семинарского типа, 2 часа – групповые консультации, 4 часа – промежуточный контроль успеваемости), 66 часов составляет самостоятельная работа студента.

7. Входные требования для освоения дисциплины (модуля), предварительные условия.

Обучающийся должен:

Знать: Систематические подходы, используемые в ретросинтетическом анализе и набор базовых структурных единиц - ретронов, на которых основано планирование многостадийных синтезов. Синтетические методы органической химии, позволяющие реализовать спланированный синтез.

Уметь: Найти в целевой молекуле входящие в ее структуру ретроны и в соответствии с этим провести расчленения молекулы.

Владеть: Методическими приемами, позволяющими провести полный ретросинтетический анализ заданного целевого соединения, а также приемами, позволяющими переходить от анализа к синтетической схеме.

8. Содержание дисциплины (модуля), структурированное по темам.

Наименование и краткое содержание разделов и тем дисциплины (модуля), форма промежуточной аттестации по дисциплине (модулю)	Всего (часы)	В том числе								
		Контактная работа (работа во взаимодействии с преподавателем), часы из них					Самостоятельная работа обучающегося, часы из них			
		Занятия лекционного типа	Занятия семинарского типа	Групповые консультации	Индивидуальные консультации	Учебные занятия, направленные на проведение текущего контроля успеваемости, промежуточной аттестации	Всего	Выполнение домашних заданий	Подготовка рефератов и т.п.	Всего

Тема 1. Стратегия использования защитных групп в синтезе	8	4	2				6	2		2
Тема 2. Основные понятия ретросинтетического анализа	8	4					4	4		4
Тема 3. Монофункциональные ретроны. 1,3-Бифункциональные ретроны	14	8	2				10	4		4
Тема 4. 1,5- Дикарбонильный ретрон	6	2	2				4	2		2
Тема 5. Концепция изменения полярности синтона. 1,2- и 1,4-Ретроны.	14	4	4	2			10	4		4
Тема 6. Ретрон Дильса-Альдера	8	4	2				6	2		2
Тема 7. 1,6-Дикарбонильный ретрон	8	2	2				4	4		4
Тема 8. Анализ циклических структур	9	5	2				7	2		2
Тема 9. Синтезы на основе сигматропных перегруппировок	7	3	2				5	2		2
Тема 10. Синтез сложных природных соединений	26		18				18	8		8
Промежуточная аттестация <u>экзамен</u>	36					4	4			32

Итого	144	36	36	2		4	78	34		66
--------------	------------	-----------	-----------	----------	--	----------	-----------	-----------	--	-----------

9. Образовательные технологии:

- применение компьютерных симуляторов, обработка данных на компьютерах, использование компьютерных программ, управляющих приборами;
- использование средств дистанционного сопровождения учебного процесса;
- преподавание дисциплин в форме авторских курсов по программам, составленным на основе результатов исследований научных школ МГУ.

10. Учебно-методические материалы для самостоятельной работы по дисциплине (модулю):

Темы семинарских занятий

- 1) Монофункциональные ретроны.
- 2) 1,3-Бифункциональные ретроны.
- 3) 1,5- Дикарбонильный ретрон.
- 4) Концепция изменения полярности синтона.
- 5) 1,2- и 1,4-Бифункциональные ретроны.
- 6) Ретрон Дильса-Альдера.
- 7) 1,6-Дикарбонильный ретрон.
- 8) Анализ циклических структур.
- 9) Синтезы на основе сигматропных перегруппировок
- 10) Синтез цедрена и тестостерона.
- 11) Синтез эстрогена и простагландинов $F_{2\alpha}$ и E_2 .
- 12) Синтез (\pm)спартеина и (+)-спартеина.
- 13) Синтез (+)-гербоксидиена и гелминтоспораля.
- 14) Синтез пенталенолактона и биотина.

11. Ресурсное обеспечение:

- Перечень основной и вспомогательной учебной литературы ко всему курсу

Основная литература

1. Конспект лекций.
2. В.П. Дядченко, А.Н. Андресюк, Е.К. Белоглазкина, Г.П. Бруслова, Планирование многостадийных синтезов

3. Защитные группы в органической химии, ред. Дж.МакОми, М., Мир, 1976
4. S.Warren, Organic Synthesis: The Disconnection Approach / Wiley, Chichester, 1994.

Дополнительная литература

1. P.G.M.Wuts, T.W.Green, Protective Groups in Organic Synthesis, 3rd Ed, Wiley, New-York, 1999.
2. S.Warren, Workbook for Organic Synthesis: The Disconnection Approach / Wiley, Chichester, 1994.
3. I. Fleming, Frontier Orbitals and Organic Chemical Reactions / Reference Edition, Wiley, Chichester, 2010.

- Материально-техническое обеспечение: специальных требований нет, занятия проводятся в обычной аудитории, оснащенной доской и мелом (маркерами)

12. Язык преподавания – русский

13. Преподаватели: д.х.н., профессор В.П. Дядченко

Фонды оценочных средств, необходимые для оценки результатов обучения

Образцы оценочных средств для текущего контроля усвоения материала и промежуточной аттестации - экзамена. На экзамене проверяется достижение промежуточных индикаторов компетенций, перечисленных в п.5.

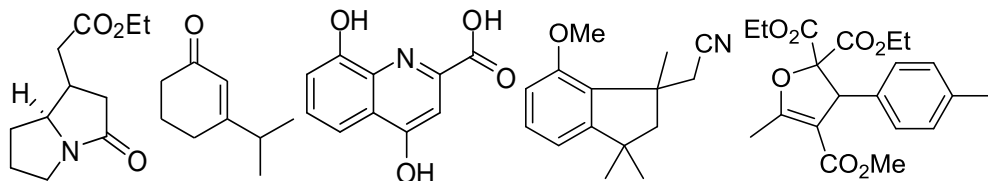
Примеры вопросов для контрольных работ и тестовых опросов:

- Контрольные работы

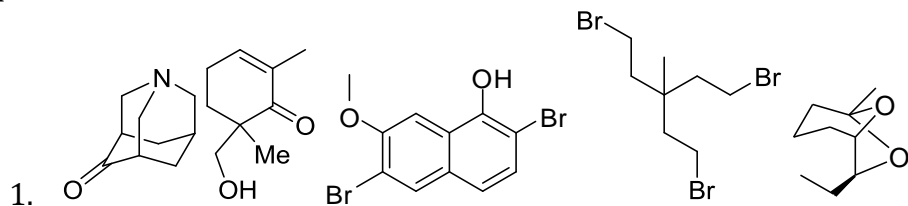
Пример контрольной работы:

Проведите ретросинтетический анализ и предложите методы синтеза следующих соединений:

Вариант 1



Вариант 2



Перечень экзаменационных вопросов

1. Защитные группы для алкинов-1, спиртов, альдегидов, кетонов, аминов, карбоновых кислот.
2. Условия создания и удаления защитных групп.
3. Устойчивость защитных групп к различным воздействиям. Ортогональная стабильность.
4. Фотоудаляемые защитные группы.
5. Стратегия использования защитных групп.
6. Целевая молекула (ТМ), трансформ, синтон, ретрон. Типы трансформов.
7. Компьютерные программы, позволяющие планировать синтез.
8. Концепция альтернирования донорных и акцепторных атомов в алифатической цепи. Логичные и нелогичные синтоны. Соответствие синтонов и реагентов.
9. Ретроны частичные и полные.
10. Основные этапы ретросинтетического анализа.
11. Расчленения одноатомных спиртов на базе карбонильных соединений, эпоксидов и трансформа Михаэля.
12. Расчленения моно-кетонов на базе производных карбоновых кислот, алкилирования енолятов, трансформов Манниха и Михаэля.
13. Внутренние и внешние расчленения 1,3-бифункциональных ретронов на основе трансформов Манниха, Михаэля и различных конденсаций.
14. Реакция Михаэля как основной путь расчленения 1,5-ретрона на базе 1,5-дикарбонильных соединений.
15. Стереоконтроль в реакции Михаэля.
16. Сведение ретрона Робинсона к 1,5-дикарбонильным соединениям. Синтез циклических β -дикетонов.
17. Подходы к анализу на основе трансформа Робинсона-Шёпфа. Анализ и синтез кокцинеллина.

18. Синтоны, возникающие при расчленении 1,2-бифункционального ретрона: “логичный” и “нелогичный”.
19. Ацил-анионы, их генерирование при низкой температуре. Umrolung на примере бензоиновой конденсации, литиевых солей дитианов, и α -литированных эфиров енолов.
20. Ацетиленид-ион как эквивалент ацил-аниона.
21. Сведение α -функционализированных карбонильных соединений к ацетиленам; α -амино-, α -гидроксикислот и 1,2-диола - к циангидринам.
22. Сведение α -функционализированных спиртов к алкенам. Сведение ацетиленов к 1,2-ретрону.
23. Анализ 1,2-ретрона на базе восстановительного сочетания кетонов: пинаконовая конденсация и конденсация под действием соединений $Ti(3+)$.
24. Использование трансформации сочленение (R) при анализе 1,4-бифункциональных соединений: сочленение с образованием двойной C=C-связи. 1,4-Функционализация на базе галогенопроизводных аллильного и пропаргильного типа.
25. Синтоны, возникающие при расчленении 1,2-бифункционального ретрона: “логичный” и “нелогичный”.
26. Ацил-анионы, их генерирование при низкой температуре. Umrolung на примере бензоиновой конденсации, литиевых солей дитианов, и α -литированных эфиров енолов.
27. Ацетиленид-ион как эквивалент ацил-аниона.
28. Сведение α -функционализированных карбонильных соединений к ацетиленам; α -амино-, α -гидроксикислот и 1,2-диола - к циангидринам.
29. Сведение α -функционализированных спиртов к алкенам. Сведение ацетиленов к 1,2-ретрону.
30. Анализ 1,2-ретрона на базе восстановительного сочетания кетонов: пинаконовая конденсация и конденсация под действием соединений $Ti(3+)$.
31. Использование трансформации сочленение (R) при анализе 1,4-бифункциональных соединений: сочленение с образованием двойной C=C-связи. 1,4-Функционализация на базе галогенопроизводных аллильного и пропаргильного типа.
32. Анализ 1,6-ретрона. Сочленение, приводящее к ретрону Дильса-Альдера как основная тактика анализа 1,6-бифункциональных соединений.
33. Сочленение в сочетании с трансформом Байера-Виллигера.
34. Кинетические и термодинамические факторы, способствующие реакциям циклизации. Расчленение циклов по стратегическим связям.
35. Расчленение трехчленных алициклов на базе диазоалканов, илидов серы и реакции Симмонса-Смита. Внутримолекулярное аннелирование с образованием трехчленного цикла.
36. Расчленение четырехчленных алициклов на базе циклизации α, α' -дигалозэфиров дикарбоновых кислот и ацилоиновой конденсации.

37. Фотохимическое и термическое [2+2]-циклоприсоединение. Региоселективность этих реакций, нуклеофильный и электрофильный концы двойной связи.
38. Создание четырехчленных алициклов на базе эпоксидов (спиро-аннелирование илидами серы с последующей перегруппировкой эпоксида).
39. Образование 5- и 6-членных насыщенных гетероциклов комбинацией присоединения по Михаэлю и конденсации Клайзена.
40. 1,3-Диполярное циклоприсоединение диазометана и нитронов как метод создания 5-членных гетероциклов с двумя гетероатомами. Синтез нитронов на базе N-окисей аминов (Коуп).
41. Синтезы на основе [3,3]-сигматропных перегруппировок. Закономерности этих реакций.
42. Перегруппировки аллиловых эфиров енолов (Клайзен-Коуп) и фенолов (Клайзен). Синтез эвгенола.
43. Перегруппировки 1,5-диенов (Коуп), аллил-винилкарбинолов (окси-перегруппировка Коупа) и сложных эфиров аллиловых спиртов (Кэрролл).
44. Синтезы на базе перегруппировки диенонов в циклопентеноны (Назаров).
45. Синтезы на основе перегруппировок диазокетонов (Арндт-Эйстерт, Вольф), α -галокетонов (Фаворский), пинаколиновой. Перегруппировка эпоксидов в альдегиды.

Методические материалы для проведения процедур оценивания результатов обучения

Шкала оценивания знаний, умений и навыков является единой для всех дисциплин (приведена в таблице ниже)

ШКАЛА И КРИТЕРИИ ОЦЕНИВАНИЯ РЕЗУЛЬТАТА ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)				
Оценка \ Результат	2	3	4	5
Знания	Отсутствие знаний	Фрагментарные знания	Общие, но не структурированные знания	Сформированные систематические знания
Умения	Отсутствие умений	В целом успешное, но не систематическое умение	В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы умение (допускает неточности непринципиального характера)	Успешное и систематическое умение
Навыки (владения)	Отсутствие навыков	Наличие отдельных навыков	В целом, сформированные навыки, но не в активной форме	Сформированные навыки, применяемые при решении задач

РЕЗУЛЬТАТ ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)	ФОРМА ОЦЕНИВАНИЯ
<p>Знать: систематические подходы, используемые в ретросинтетическом анализе и набор базовых структурных единиц - ретронов , на которых основано планирование многостадийных синтезов.</p> <p>Знать: основные реагенты, используемые в органическом синтезе, и области применения этих реагентов.</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>
<p>Уметь анализировать научную литературу с целью выбора направления и методов, применяемых в исследовании по теме выпускной квалификационной работы,</p> <p>Уметь: самостоятельно составлять план исследования</p> <p>Уметь: найти в целевой молекуле входящие в ее структуру ретроны и в соответствии с этим провести расчленения молекулы</p> <p>Уметь: составлять план химического синтеза, и оценивать его реальную осуществимость.</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>
<p>Владеть навыками поиска, критического анализа, обобщения и систематизации научной информации, постановки целей исследования и выбора оптимальных путей и методов их достижения</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>