

*Федеральное государственное автономное образовательное учреждение  
высшего образования «Российский университет дружбы народов»*

*Факультет физико-математических и естественных наук*

Рекомендовано МССН  
по направлению 04.00.00 «Химия»

## **РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ**

**Наименование дисциплины**

**СТРАТЕГИЯ ОРГАНИЧЕСКОГО СИНТЕЗА**

**Рекомендуется для направления подготовки**

**04.03.01 «ХИМИЯ»**

## **1. Цели и задачи дисциплины:**

Целью настоящего курса (курс по выбору) является ознакомление студентов - бакалавров с современным состоянием тонкого органического синтеза. Курс является общеобразовательным и призван сформировать у слушателя, на основе мозаичной картины последних достижений органической химии (складывается из направлений: стратегия направленного синтеза, молекулярный дизайн, супрамолекулярная химия), целостное восприятие перспектив развития органического синтеза. Лекционный материал помогает студентам 4-ого курса сориентироваться в океане химической науки и выбрать наиболее близкую по духу специализацию в магистратуре, с ориентацией на органическую химию. Наибольшее внимание уделяется тактике и стратегии синтеза сложных молекул с заданными свойствами: алкалоидов, природных и синтетических лекарственных препаратов. На этих примерах рассматриваются важнейшие понятия курса: трансформ, ретрон, синтон, синтетический эквивалент. В ознакомительной форме на примере практически важных производных излагаются главные достижения молекулярного дизайна и супрамолекулярной химии.

## **2. Место дисциплины в структуре ООП:**

Дисциплина “Стратегия органического синтеза” относится к части, формируемой участниками образовательных отношений, блока 1. Дисциплины (модули) учебного плана. Для успешного освоения дисциплины студент должен иметь основные представления о строении органических соединений и их реакционной способности. Обладать достаточным уровнем знаний по общим курсам органической и физической химии. Иметь представления о промежуточных частицах органической химии и особенностях их превращений (механизмы реакций). Для освоения дисциплины “Стратегия органического синтеза” обучающиеся используют знания, умения, сформированные в ходе изучения дисциплин: “Органическая химия”, “Коллоидная химия”, “Физическая химия”. Данная дисциплина предшествует изучению специальных курсов магистратуры: “Методы органической химии”, “Химия гетероциклических соединений”, “Теоретические основы органической химии”.

В таблице № 1 приведены предшествующие и последующие дисциплины, направленные на формирование компетенций дисциплины в соответствии с матрицей компетенций ОП ВО.

**Предшествующие и последующие дисциплины,  
направленные на формирование компетенций**

№ п/п	Шифр и наименование компетенции	Предшествующие дисциплины	Последующие дисциплины (группы дисциплин)
<b>Универсальные компетенции</b>			
1	<b>УК-1</b> Способен осуществлять поиск, критический анализ и синтез информации, применять системный подход для решения поставленных задач	Философия Математика Физика Информатика Неорганическая химия Аналитическая химия Органическая химия Физическая химия Курсовая работа «Неорганическая химия» Курсовая работа «Аналитическая химия» Курсовая работа «Органическая химия» Курсовая работа «Физическая химия» Основы квантовой химии Химические основы биологических процессов Введение в химию координационных соединений Основы нанохимии Химия лекарственных веществ	Методы получения новых веществ и материалов Избранные главы химии Экспериментальные методы исследования в химии Междисциплинарный модуль Учебная практика Преддипломная практика
<b>Профессиональные компетенции (научно-исследовательская деятельность)</b>			
1	<b>ПК-1</b> Способен использовать полученные знания теоретических основ фундаментальных разделов химии при решении профессиональных задач	Неорганическая химия Аналитическая химия Физическая химия Органическая химия Курсовая работа «Неорганическая химия» Курсовая работа «Аналитическая химия» Курсовая работа «Органическая химия» Курсовая работа «Физическая химия» Основы квантовой химии Химические основы биологических процессов Введение в химию координационных соединений Основы нанохимии Химия лекарственных веществ	Методы получения новых веществ и материалов Избранные главы химии Экспериментальные методы исследования в химии Учебная практика Научно-исследовательская работа Преддипломная практика

### 3. Требования к результатам освоения дисциплины:

Процесс изучения дисциплины направлен на формирование следующих компетенций: УК–1, ПК–1.

#### Формируемые компетенции

Компетенции	Название компетенции	Индикаторы достижения компетенций
<b>УК-1</b>	Способен осуществлять поиск, критический анализ и синтез информации, применять системный подход для решения поставленных задач	<b>ИУК-1.1.</b> Анализирует задачу, выделяя ее базовые составляющие; <b>ИУК-1.2.</b> Определяет, интерпретирует и ранжирует информацию, требуемую для решения поставленной задачи; <b>ИУК-1.5.</b> Рассматривает и предлагает возможные варианты решения поставленной задачи, оценивая их достоинства и недостатки.
<b>ПК-1</b>	Способен использовать полученные знания теоретических основ фундаментальных разделов химии при решении профессиональных задач	<ul style="list-style-type: none"> <li>• <b>ИПК-1.1.</b> Понимает основные принципы, законы, методологию изучаемых химических дисциплин, теоретические основы физических и физико-химических методов исследования;</li> <li>• <b>ИПК-1.2.</b> Использует фундаментальные химические понятия в своей профессиональной деятельности;</li> <li>• <b>ИПК-1.3.</b> Интерпретирует полученные результаты, используя базовые понятия химических дисциплин</li> </ul>

В результате изучения дисциплины студент должен:

**Знать:** основные направления развития современного органического синтеза, методы и подходы к планированию синтеза сложных молекул. Понимать и свободно пользоваться терминологией курса (понятиями: ретрон, синтон, трансформ, синтетический эквивалент и др.).

**Уметь:** планировать многостадийные синтезы достаточно сложных молекул на основе концепции ретросинтетического анализа.

**Владеть:** Владеть навыками работы с программами компьютерного ретросинтетического анализа SYNGEN, LHASA, Reaxys.

### 4. Объем дисциплины и виды учебной работы

Общая трудоемкость дисциплины составляет 2 зачетные единицы.

№ п/п	Вид учебной работы	Всего часов	Семестры			
			7			
<b>1.</b>	<b>Аудиторные занятия (всего)</b>	<b>36</b>	<b>36</b>			
	В том числе:					
1.1.	Лекции	36	36			
1.2.	Прочие занятия					
	в том числе:					
1.2.1.	Практические занятия (ПЗ)					

1.2.2.	Семинары (С)				
1.2.3.	Лабораторные работы (ЛР)				
<b>2.</b>	<b>Самостоятельная работа (всего)</b>	<b>36</b>	36		
<b>3.</b>	<b>Общая трудоемкость (академические часы)</b>	<b>72</b>	72		
	<b>Общая трудоемкость (зачётные единицы)</b>	<b>2</b>	2		

## 5. Содержание дисциплины

### 5.1. Содержание разделов дисциплины

№ п/п	Наименование раздела дисциплины	Содержание раздела
1.	<b>Введение</b>	Значение органического синтеза для развития органической химии. Проблемы планирования многостадийного органического синтеза. Стратегии ранних (1900-1950 гг) синтезов природных объектов и лекарственных препаратов. Современные синтетические задачи и подходы к их решению.
2.	<b>Критерии оптимального синтеза</b>	Факторы, определяющие путь синтеза. Выход, число стадий, регио- и стереоселективность, условия реакций. Проблема доступности исходных соединений, их устойчивости, токсичность, пожаро- и взрывоопасность как критерии оптимального синтеза.
3.	<b>Современные подходы к синтезу целевых молекул</b>	Основные современные подходы к синтезу сложных органических молекул. Планирование синтеза от исходных структур. Соединения регулярного строения, димеры, олигомеры и полимеры как объекты для синтетического анализа. "Иррациональные" синтезы ограниченность их возможностей в органическом синтезе.
4.	<b>Ретросинтетический анализ, основные понятия</b>	Ретросинтетический анализ. Методы и цели ретросинтетического анализа. Важнейшие понятия ретросинтетического анализа (целевая молекула, ретрон, синтон, трансформ, синтетический эквивалент). Расчленение молекулы.
5.	<b>Линейный и конвергентный синтез</b>	Линейный и конвергентный синтез. Достоинства и недостатки линейной и конвергентной схем ретросинтетического анализа. Оценка выхода целевой молекулы в многостадийном синтезе. Арифметический демон. Дерево синтеза. Применение конвергентной схемы в реализации многостадийного органического синтеза (примеры).
6.	<b>Трансформы</b>	Трансформы подробное рассмотрение. Основные трансформы, применяющиеся при анализе: расчленения и сочленения, изменения, введения и удаления функциональных групп, разрыв и создание цикла, перегруппировка. Мощные реакции.
7.	<b>Синтоны</b>	Синтоны. Синтоны с естественной и обращенной полярностью. Синтетические эквиваленты синтонов. Способы обращения полярности синтонов. Умполунг. Примеры использования в синтезе.
8.	<b>Управление региоселективностью реакции при помощи селективной активации</b>	Проблема региоселективности реакции. Активация реакционных центров. Методы активации электрофильных центров. Пути формирования легко уходящих заместителей у $sp^3$ -гибридизованного атома углерода. Сульфонатные и трифлатные группы как вариант активации спиртового

	<b>реакционных центров</b>	гидроксила. Активация альдегидного и кетонного электрофильного центров. Активация ацилирующих реагентов.
9.	<b>Активация нуклеофильных центров в карбонильных соединениях</b>	Методы активации нуклеофильных центров. Активация $\alpha$ -углеродного нуклеофильного центра в кетонах, енолят-анионы. Кинетический и термодинамический контроль в региоселективном генерировании енолят-анионов. Эфиры енолов как активированная форма кетонов. Силиловые эфиры енолов и енамины в синтезе. Активация $\alpha$ -углеродного нуклеофильного центра в кетонах путем временного введения вспомогательной карбоалкоксильной группировки в $\alpha$ -положение. Малоновый и ацетоуксусный эфир и их аналоги. Использование сильных оснований для формирования двухзарядных карбоанионов в органическом синтезе.
10.	<b>Защитные группы в синтезе. Защита гидроксильных групп</b>	Защитные группы в органической химии. Защита как альтернативный подход к решению проблем региоселективности синтеза. Критерии идеальной защитной группы. Необходимость использования различных защит реакционного центра одного типа. Принципы ортогональной стабильности и модулированной лабильности. Защита гидроксильной и аминогрупп.
11.	<b>Защита карбоксильных, карбонильных и аминогрупп</b>	Методы защиты карбоксильных, аминогрупп и альдегидных групп. Примеры использования защитных групп в многостадийных синтезах алкалоидов и сахаров.
12.	<b>Ретросинтетический анализ различных классов соединений</b>	Особенности ретросинтетического анализа классов органических соединений (алкенов, алкинов, аренов, спиртов, простых эфиров, альдегидов, кетонов и карбоновых кислот, аминов).
13.	<b>Ретросинтетический анализ бифункциональных соединений - 1,2-; 1,3-; 1,4-ретронов</b>	Ретросинтетический анализ бифункциональных соединений. Анализ 1,2-; 1,3-; 1,4-ретронов.
14.	<b>Ретросинтетический анализ 1,5- и 1,6-ретронов. Особенности ретросинтеза аренов</b>	Ретросинтетический анализ 1,5- и 1,6-ретронов. Особенности ретросинтеза аренов. Взаимное превращение групп и использование ориентирующего эффекта вспомогательной группы в кольце. Защита C–H связи в ароматическом ряду как метод региоспецифического синтеза. Методы удаления ориентирующей и защитной группировок в ароматическом кольце. Правила региоспецифичного введения третьего заместителя в бензольное кольцо.
15.	<b>Элементы молекулярного дизайна</b>	Элементы молекулярного дизайна. Общие принципы дизайна (разработки) молекул. Классические подходы и подходы, базирующиеся на молекулярных моделях. Молекулярное распознавание (молекулярные рецепторы, матричный синтез, супрамолекулярный катализ). Молекулярное моделирование объектов живой природы. Биомиметика. Математические методы моделирования и исследования строения и свойств химических объектов на примере программ молекулярного моделирования (HyperChem, ChemOffice). Типовые методы получения полиэдров (платоновы тела). Фуллерены и

		нанотрубки – новая модификация углерода. История открытия. Синтез и практическое применение фуллеренов и нанотрубок.
16.	<b>Элементы супрамолекулярной химии</b>	Элементы супрамолекулярной химии (Жан-Мари Лен, 1978 г.). Межмолекулярные (нековалентные) взаимодействия. Архитектура супрамолекулярных образований, супермолекулы и супрамолекулярные ансамбли. Компоненты супрамолекулярных ассоциатов: рецептор ( $\rho$ ) и субстрат ( $\sigma$ ), соединение включения и соединение (комплекс) типа гость-хозяин. Ротаксаны, катенаны, узлы, клатраты, дендримеры. Синтез и применение. Молекулярные пинцеты, ловушки и прочее. Формирование нанообъектов. Темплатный синтез химических объектов с заданными свойствами.

## 5.2. Разделы дисциплин и виды занятий

№ п/п	Наименование раздела дисциплины	Лекции	Практические занятия и лабораторные работы			СРС	Всего
			ПЗ/С	ЛР	семинар		
1.	Введение. Возникновение СОС	2				2	4
2.	Критерии оптимального синтеза	2				2	4
3.	Современные подходы к синтезу целевых молекул	2				2	4
4.	Ретросинтетический анализ, основные понятия	2				4	6
5.	Линейный и конвергентный синтез	2				2	4
6.	Трансформы	2				2	4
7.	Синтоны	2				4	6
8.	Управление региоселективностью реакции при помощи селективной активации реакционных центров	2				2	4
9.	Активация нуклеофильных центров в карбонильных соединениях	2				2	4
10.	Защитные группы в синтезе. Защита гидроксильных групп	2				2	4
11.	Защита карбоксильных, карбонильных и аминогрупп	2				2	4
12.	Ретросинтетический анализ различных классов соединений	2				4	6
13.	Ретросинтетический анализ бифункциональных соединений - 1,2-; 1,3-; 1,4-ретронов	2				2	4
14.	Ретросинтетический анализ 1,5- и 1,6-ретронов. Особенности ретросинтеза аренов	3				1	4
15.	Элементы молекулярного дизайна	3				1	4
16.	Элементы супрамолекулярной химии	4				2	6
	Всего	36				36	72

**6. Лабораторный практикум**– не предусмотрены учебным планом.

**7. Практические занятия (семинары)** – не предусмотрены учебным планом.

**8. Материально-техническое обеспечение дисциплины:**

Москва, ул. Орджоникидзе, 3, корп. 1

Учебная аудитория для проведения занятий лекционного типа, групповых и индивидуальных консультаций, текущего контроля и промежуточной аттестации, самостоятельной работы

ауд.№ 530 Комплект специализированной мебели; технические средства: проектор BENQ MX661, проектор NEC NP40, экран моторизованный для проекторов, столы; имеется wi-fi

**9. Информационное обеспечение дисциплины:**

а) Программа корпоративного лицензирования (Microsoft Subscription) Enrollment for Education Solutions № 86626883(продлевается ежегодно, программе присваивается новый номер), ISIS Draw.

б) базы данных, информационно-справочные и поисковые системы

1. Электронно-библиотечная система РУДН – ЭБС РУДН:

<http://lib.rudn.ru:8080/MegaPro/Web>

2. Химическая информационная сеть: <http://www.chem.msu.ru/>

3. Мультидисциплинарная реферативная база данных Скопус:

<https://www.scopus.com/>

4. База данных по органическим, природным и физиологически активным соединениям: <https://www.reaxys.com/>

5. Научные журналы американского химического общества: <http://pubs.acs.org/>

6. Алфавитный перечень химических терминов (IUPAC): <http://goldbook.iupac.org/>

**10. Учебно-методическое обеспечение дисциплины:**

**а) основная литература**

1. В. А. Смит, А. Д. Дильман. “Основы современного органического синтеза”, Москва, Бинوم. Лаборатория знаний, 2009 г.

2. В. Смит, А. Бочков, Р. Кейпл. “Органический синтез. Наука и искусство”. Москва, Мир, 2001 г.

**б) дополнительная литература**

1. Сид Дж. В., Этвуд Дж. Л. “Супрамолекулярная химия”. В 2-х томах. Москва, Академкнига, 2007.

2. Ласло П. “Логика органического синтеза”. В 2 томах. Москва, Мир, 1998.

3. E. J. Corey, X. Cheng, “The Logic of Chemical Synthesis”, Wiley, N.-Y., 1989.

4. Т. В. Мандельштам. “Стратегия и тактика органического синтеза”. Ленинград, издательство ЛГУ, 1989.

5. Под ред. Дж. МакОми. “Защитные группы в органической химии”. Москва, Мир, 1976.

6. А. Ф. Бочков, В. А. Смит. “Органический синтез”. Москва, Наука, 1987.



## **11. Методические рекомендации по организации изучения дисциплины:**

От студентов требуется посещение лекций, обязательное участие в аттестационно-тестовых испытаниях и выполнение заданий преподавателя. Для оценки текущих контрольных работ и итоговой аттестации применяется балльно-рейтинговая система оценки знаний. Если в итоге за семестр студент получил менее 29 баллов, то ему выставляется оценка F и студент должен повторить дисциплину в установленном порядке. Студенты, получившие в течение семестра, оценку: 2+ (FX), 3 (E), 3+ (D) или 4 (C) и желающие повысить свою оценку, допускаются к экзамену (итоговая аттестация). Итоговая работа оценивается из 14 баллов.

### ***Лекции:***

Написание конспекта лекций: кратко, схематично, последовательно фиксировать основные положения, выводы, формулировки, обобщения; пометать важные мысли, выделять ключевые слова, термины. Проверка терминов, понятий с помощью энциклопедий, словарей, справочников с выписыванием толкований в тетрадь. Обозначить вопросы, термины, материал, который вызывает трудности, пометить и попытаться найти ответ в рекомендуемой литературе. Если самостоятельно не удастся разобраться в материале, необходимо сформулировать вопрос и задать преподавателю на консультации.

### ***Правила выполнения письменных работ (контрольных тестовых работ).***

Для проверки усвоения теоретических знаний и выполнения лабораторных работ, студенты выполняют письменные контрольные работы.

- Контрольные работы выполняются по пунктам в отдельной тетради, на обложке которой указаны название дисциплины, фамилия и инициалы, специальность, курс. Перед каждой контрольной работой указывается номер контрольной работы, вариант задания, дата.
- Контрольные работы выполняются чернилами черного, синего или фиолетового цвета. Условие каждой задачи необходимо записывать полностью.

### ***Подготовка к промежуточной (итоговой) аттестации***

При подготовке к итоговой аттестации необходимо ориентироваться на конспекты лекций, рекомендуемую литературу.

## 12. Фонд оценочных средств для проведения промежуточной аттестации обучающихся по дисциплине (модулю)

Материалы для оценки уровня освоения учебного материала дисциплины «Стратегия органического синтеза» (оценочные материалы), включающие в себя перечень компетенций с указанием этапов их формирования, описание показателей и критериев оценивания компетенций на различных этапах их формирования, описание шкал оценивания, типовые контрольные задания или иные материалы, необходимые для оценки знаний, умений, навыков и (или) опыта деятельности, характеризующих этапы формирования компетенций в процессе освоения образовательной программы, методические материалы, определяющие процедуры оценивания знаний, умений, навыков и (или) опыта деятельности, характеризующих этапы формирования компетенций, разработаны в полном объеме в соответствии с требованиями «Регламента формирования фондов оценочных средств (ФОС)», утвержденного приказом ректора от 05.05.2016 г. № 420 и доступны для обучающихся на странице дисциплины в ТУИС РУДН.

Знания студентов оцениваются по рейтинговой системе. Оценка знаний по рейтинговой системе основана на идее поощрения систематической работы студента в течение всего периода обучения.

При выставлении оценок используется балльно-рейтинговая система, в соответствии с Положением о БРС оценки качества освоения основных образовательных программ, принятого Решением Ученого совета университета (протокол №6 от 17.06.2013 г) и утвержденного Приказом Ректора Университета от 20.06.2013 года.

Программа составлена в соответствии с требованиями ОС ВО РУДН.

### Разработчики:

Доцент кафедры органической химии, к.х.н.

Ф.И. Зубков

Заведующий кафедрой  
органической химии

Л.Г. Воскресенский