

Программа утверждена на заседании
Ученого Совета химического факультета
Протокол № 4 от 29 мая 2014 г.

Рабочая программа дисциплины (модуля)

1. Наименование дисциплины (модуля): **Каталитические реакции в синтезе потенциальных лекарственных средств**

Основная цель освоения дисциплины: формирование углубленных представлений о каталитических реакциях и их роли в синтезе потенциальных лекарственных средств

Основная задачи освоения дисциплины - формирование представлений о методах, планировании и дизайне комбинаторного синтеза.

2. Уровень высшего образования аспирантура.

3. Направление подготовки: 04.06.01 Химические науки, направленность (профиль) 02.00.16 Медицинская химия.

4. Место дисциплины (модуля) в структуре ООП: вариативная часть ООП, блок «Дисциплины (модули)»

5. Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю), соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы (компетенциями выпускников)

Формируемые компетенции (код компетенции)	Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю)
УК-1 способность к критическому анализу и оценке современных научных достижений, генерированию новых идей при решении исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях	З1 (УК-1) ЗНАТЬ: методы критического анализа и оценки современных научных достижений, а также методы генерирования новых идей при решении исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях. В2 (УК-1) ВЛАДЕТЬ: навыками критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях.
УК-2 способность проектировать и осуществлять комплексные ис-	З1(УК-2) ЗНАТЬ: методы научно-исследовательской

следования, в том числе междисциплинарные, на основе целостного системного научного мировоззрения с использованием знаний в области истории и философии науки	деятельности.
ОПК-1 способность самостоятельно осуществлять научно-исследовательскую деятельность в соответствующей профессиональной области с использованием современных методов исследования и информационно-коммуникационных технологий	У1 (ОПК-1) УМЕТЬ: выбирать и применять в профессиональной деятельности экспериментальные и расчетно-теоретические методы исследования.
ПК-14 способность к самостоятельному проведению научно-исследовательской работы и получению научных результатов, удовлетворяющих установленным требованиям к содержанию диссертаций на соискание ученой степени кандидата наук по направлению (научной специальности) 02.00.16 Медицинская химия	33 (ПК-14) Знать преимущества и недостатки основных типов каталитических реакций, используемых при синтезе лекарственных препаратов 34 (ПК-14) Знать методы комбинаторного синтеза, основные преимущества и недостатки жидкофазного и твердофазного синтеза

6. Объем дисциплины (модуля) 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 3 зачетных единицы, всего 108 часов, из которых 56 часов составляет контактная работа студента с преподавателем (36 часов занятия лекционного типа, 12 часов групповых и индивидуальных консультаций, 4 часа мероприятий текущего контроля успеваемости и промежуточной аттестации), 52 часа составляет самостоятельная работа учащегося.

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

Для того, чтобы формирование данной компетенции было возможно, обучающийся должен

Знать: общие курсы органической химии и физической химии

Уметь: применять информационные технологии для решения практических учебных и исследовательских задач

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. П.	Всего
Введение История открытия явления катализа. Общие вопросы катализа. Катализ в промышленности и живой природе	20	8			2		10			10
Именные каталитические реакции в синтезе потенциальных лекарственных средств	24	10			4		14			10
Каталитические реакции в синтезе потенциальных лекарственных средств путем комбинаторного синтеза	22	8			4		12			10

Перспективы использования ионных жидкостей в катализе	22	10			2		12			10
Промежуточная аттестация, зачет	20			4		4	8			12
Итого	108	36		4	12	4	56			52

8. Образовательные технологии.

Занятия проводятся с помощью традиционных образовательных технологий.

9. Учебно-методические материалы для самостоятельной работы по дисциплине (модулю): презентации к лекционным занятиям.

10. Ресурсное обеспечение:

- Перечень основной и вспомогательной учебной литературы ко всему курсу

Основная литература

1. Л.А.Асланов, М.А.Захаров, Н.Л. Абрамычева Ионные жидкости в ряду растворителей. — М.: Изд-во МГУ. 2005.—272 с.
2. О.А. Реутов, А.Л. Курц, К.П. Бутин, Органическая химия, М., Бином, 1999-2002, т.1-4.
3. Ю.С. Шабаров, Органическая химия, т.1, 2, М., Химия, 1994.
4. Конспект лекций

Дополнительная литература

1. А.Н.Несмеянов, Н.А.Несмеянов, Начала органической химии, М., 1974, т.1-2.

Периодическая литература

5. SynLett, 2002, №7, 1118-1122.
6. JACS, 1999, 121, 10264-10269
7. Organic Letters, 2001, Vol. 3, No. 18, 2863-2865

8. Tetrahedron, 2009, 65, 364–368
9. Angew. Chem. Int. Ed, 2002, 41, 4176-4211
10. J. Org. Chem., 1999, 64, 4516-4518
11. Angew. Chem. Int. Ed, 2001, 40, 1967-1970
12. Angew. Chem. Int. Ed, 2002, 41, 4176-4211

Для всех перечисленных изданий открыт доступ с сервера химического факультета МГУ

- Перечень используемых информационных технологий, используемых при осуществлении образовательного процесса, включая программное обеспечение, информационные справочные системы (при необходимости):

Интернет-ресурсы

- Описание материально-технической базы.

Занятия проводятся в учебной аудитории, оборудованной доской, компьютером, проектором. Домашние задания выполняются с использованием персональных компьютеров студентов.

11. Язык преподавания – русский

12. Преподаватели:

проф., д.х.н. Томилова Л.Г.

Фонды оценочных средств, необходимые для оценки результатов обучения

1. Планируемые результаты обучения для формирования компетенций п.5 и соответствующие им критерии оценивания приведены в Приложении 1.
2. Материалы к текущей (контрольные работы, вопросы к коллоквиумам и пр.), промежуточной аттестации (вопросы к зачету)

Вопросы для зачета.

1. Введение История открытия явления катализа. Общие вопросы катализа. Катализ в промышленности и живой природе.

- 1.1. Гомогенный катализ - преимущества и недостатки
- 1.2. Гетерогенный катализ - преимущества и недостатки
- 1.3. Межфазный катализ - достоинства и недостатки
- 1.4. Особенности ферментативного катализа
- 1.5. Основные типы катализаторов
 - ✓ Кислоты и основания (гомогенные и гетерогенные)
 - ✓ Металлы или оксиды металлов (гетерогенные)
 - ✓ Комплексы металлов (гомогенные и гетерогенные)
 - ✓ Соли с липофильными катионами (межфазные)
 - ✓ Краун-эфиры (межфазные)
 - ✓ Ферменты (гомогенные и гетерогенные)

2. Именные каталитические реакции в синтезе потенциальных лекарственных средств :

- 2.1. Реакция Хека: гетерогенный катализ
- 2.2. Реакция Хека: гомогенный катализ - внутримолекулярная экзо-циклизация
- 2.3. Реакция Хека в синтезе ингибитора протеасомы TMS-95A
- 2.3. Реакция Сузуки: активированные арил хлориды – перспективные исходные соединения в синтезе потенциальных лекарственных средств
- 2.4. Реакция Сузуки в синтезе Ирбесартана - ключевой интермедиат в синтезе антагониста рецептора ангиотензина II.
- 2.5. Реакция Сузуки в синтезе ингибитора протеасомы TMS-95A

3. Каталитические реакции в синтезе потенциальных лекарственных средств путем комбинаторного синтеза

- 3.1 Методы комбинаторного синтеза. Планирование и дизайн комбинаторного синтеза “Паукообразные” молекулы. Центроиды или подпорки (scaffolds)
Требования к ним.
- 3.2 Жидкофазный синтез, преимущества и недостатки
- 3.3 Твердофазный синтез, его преимущества. Основные типы полимерных смол, используемых в настоящее время в комбинаторном синтезе.
- 3.4 Синтез индолов через интрамолекулярную реакцию Хека с использованием каталитических количеств $\text{Pd}(\text{Ph}_3\text{P})_4$.

4. Перспективы использования ионных жидкостей в катализе

- 4.1 . Определение IUPAC ионных жидкостей. Катализаторы на основе ИЖ: вызовы XXI века
- 4.2. Состав, строение и физико-химические свойства ионных жидкостей.
- 4.3. Катализатор на основе ИЖ, нанесенной на хитозан
- 4.4. Способы иммобилизации ИЖ
- 4.5. Иммобилизация ИЖ на носителях:
 - 4.5. 1. Иммобилизация ИЖ на поверхности силикагеля
 - 4.5. 2. Технология SILP: ковалентное связывание ИЖ через катион
- 4.6. Реакции Стилле, Сузуки, Троста-Цудзи, Фриделя-Крафтса и Хека в ионных жидкостях.
- 4.7. Асимметрический синтез в ИЖ.
- 4.8. Многофункциональные ионные жидкости

Методические материалы для проведения процедур оценивания результатов обучения

Зачет проводится по билетам. В ходе сдачи зачета проверяется, в первую очередь, формирование «знаниевой» компоненты компетенций, перечисленных в п.5, а также сформированность перечисленных в п.5 умений. Уровень знаний аспиранта по каждому вопросу оценивается на «отлично», «хорошо», «удовлетворительно», «неудовлетворительно». В случае, если на все вопросы был дан ответ, оцененный не ниже чем «удовлетворительно», аспирант получает общую оценку «зачтено». Ведомость приема зачета подписывается членами комиссии.

Приложение 1.

Оценочные средства для промежуточной аттестации по дисциплине «Каталитические реакции в синтезе потенциальных лекарственных средств» на основе карт компетенций выпускников

РЕЗУЛЬТАТ ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)	КРИТЕРИИ ОЦЕНИВАНИЯ РЕЗУЛЬТАТА ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю) и ШКАЛА оценивания					ПРОЦЕДУРЫ ОЦЕНИВАНИЯ*
	1	2	3	4	5	
31 (УК-1) ЗНАТЬ: методы критического анализа и оценки современных научных достижений, а также методы генерирования новых идей при решении исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях	Отсутствие знаний	Фрагментарные знания методов критического анализа и оценки современных научных достижений, а также методов генерирования новых идей при решении исследовательских и практических задач	Общие, но не структурированные знания методов критического анализа и оценки современных научных достижений, а также методов генерирования новых идей при решении исследовательских и практических задач	Сформированные, но содержащие отдельные пробелы знания основных методов критического анализа и оценки современных научных достижений, а также методов генерирования новых идей при решении исследовательских и практических задач, в том числе междисциплинарных	Сформированные систематические знания методов критического анализа и оценки современных научных достижений, а также методов генерирования новых идей при решении исследовательских и практических задач, в том числе междисциплинарных	Зачет в форме индивидуального собеседования

<p>В2 (УК-1) ВЛАДЕТЬ: навыками критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях</p>	<p>Отсутствие навыков</p>	<p>Фрагментарные навыки критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях.</p>	<p>Неполные навыки критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях.</p>	<p>Сформированные, но содержащие отдельные пробелы навыки критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях.</p>	<p>Сформированные устойчивые навыки критического анализа и оценки современных научных достижений и результатов деятельности по решению исследовательских и практических задач, в том числе в междисциплинарных областях.</p>	<p>Зачет в форме индивидуального собеседования</p>
<p>31(УК-2) ЗНАТЬ: методы научно-исследовательской деятельности.</p>	<p>Отсутствие знаний о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии.</p>	<p>Фрагментарные знания о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии.</p>	<p>Неполные знания о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии.</p>	<p>Сформированные, но содержащие отдельные пробелы знания о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии</p>	<p>Сформированные систематические знания о методах научно-исследовательской деятельности в области медицинской химии.</p>	<p>Зачет в форме индивидуального собеседования</p>

<p>У1 (ОПК-1) УМЕТЬ: выбирать и применять в профессиональной деятельности экспериментальные и расчетно-теоретические методы исследования.</p>	<p>Отсутствие умений</p>	<p>Частично освоенное умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования в области медицинской химии</p>	<p>В целом успешное, но не систематическое умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования в области медицинской химии</p>	<p>В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования в области медицинской химии</p>	<p>Успешное и систематическое умение в выборе и применении экспериментальных и расчетно-теоретических методов исследования в области медицинской химии</p>	<p>Письменное решение задач</p>
<p>33 (ПК-14) Знать преимущества и недостатки основных типов каталитических реакций, используемых при синтезе лекарственных препаратов</p>	<p>Отсутствие знаний</p>	<p>Фрагментарные представления о достоинствах и недостатках основных типов каталитических реакций, используемых при синтезе лекарственных препаратов</p>	<p>Знает только преимущества основных типов каталитических реакций, используемых при синтезе лекарственных препаратов; не может сформулировать недостатки</p>	<p>Сформированные, но содержащие отдельные пробелы знания достоинств и недостатков основных типов каталитических реакций, используемых при синтезе лекарственных препаратов</p>	<p>Сформированные систематические знания достоинств и недостатков основных типов каталитических реакций, используемых при синтезе лекарственных препаратов</p>	<p>Зачет в форме индивидуального собеседования</p>

<p>34 (ПК-14) Знать методы комбинаторного синтеза, основные преимущества и недостатки жидкофазного и твердофазного синтеза</p>	<p>Отсутствие знаний</p>	<p>Фрагментарные представления о методах комбинаторного синтеза, основных преимуществах и недостатках жидкофазного и твердофазного синтеза</p>	<p>Знает преимущества и недостатки только одного типа синтетических процессов (жидкофазного или твердофазного синтеза)</p>	<p>Сформированные, но содержащие отдельные пробелы знания о методах комбинаторного синтеза, основных преимуществах и недостатках жидкофазного и твердофазного синтеза</p>	<p>Сформированные систематические знания о методах комбинаторного синтеза, основных преимуществах и недостатках жидкофазного и твердофазного синтеза</p>	<p>Зачет в форме индивидуального собеседования</p>
--	--------------------------	--	--	---	--	--