

Федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение высшего образования  
«Санкт-Петербургский государственный химико-фармацевтический университет»  
Министерства здравоохранения Российской Федерации

Факультет промышленной технологии лекарств

Кафедра химической технологии лекарственных веществ

РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)

**Б1.В.ДВ.02.02 ОСНОВЫ ХИМИЧЕСКОГО СИНТЕЗА БИОЛОГИЧЕСКИ  
АКТИВНЫХ ВЕЩЕСТВ**

Направление подготовки: 18.04.01 Химическая технология

Профиль подготовки: Химическая технология лекарственных субстанций

Формы обучения: очная

Квалификация (степень) выпускника: Магистр

Год набора: 2021

Срок получения образования: очная форма обучения – 2 года

Объем: в зачетных единицах: 3 з.е.  
в академических часах: 108 ак.ч.

**Разработчики:**

Доктор фармацевтических наук, профессор Йозеп А. А.

Рабочая программа дисциплины (модуля) составлена в соответствии с требованиями ФГОС ВО по направлению подготовки 18.04.01 Химическая технология, утвержденного приказом Минобрнауки России от 07.08.2020 № 910

**Согласование и утверждение**

№	Подразделение или коллегиальный орган	Ответственное лицо	ФИО	Виза	Дата, протокол (при наличии)
1	Методическая комиссия факультета	Председатель методической комиссии	Алексеева Галина Михайловна	Согласовано	29.06.2021, № 9
2	Кафедра химической технологии лекарственных веществ	Ответственный за образовательную программу	Лалаев Борис Юрьевич	Согласовано	30.06.2021
3	Кафедра химической технологии лекарственных веществ	Заведующий кафедрой, руководитель подразделения, реализующего ОП	Лалаев Борис Юрьевич	Рассмотрено	10.10.2021, № 11

**Согласование и утверждение образовательной программы**

№	Подразделение или коллегиальный орган	Ответственное лицо	ФИО	Виза	Дата, протокол (при наличии)
1	факультет промышленной технологии лекарств	Декан, руководитель подразделения	Марченко Алексей Леонидович	Согласовано	30.06.2021, № 11

# 1. Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю), соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы

*Компетенция(и), индикатор(ы) и результаты обучения*

ПК-П2 Способен организовывать и контролировать технологический процесс и работу оборудования

ПК-П2.4 Организует мониторинг состояния объектов и процессов, прошедших валидацию, в том числе проводит анализ и оценку значимости отклонений от установленных требований

*Знать:*

ПК-П2.4/Зн1 Знать методы анализа и оценки значимости отклонений от установленных требований

ПК-П2.4/Зн6 Знать особенности технологических процессов синтеза биологических активных веществ.

*Уметь:*

ПК-П2.4/Ум5 Уметь проводить анализ и оценку значимости отклонений от нормального протекания процесса, прогнозировать возникновение отклонений во времени.

## 2. Место дисциплины в структуре ОП

Дисциплина (модуль) Б1.В.ДВ.02.02 «Основы химического синтеза биологически активных веществ » относится к формируемой участниками образовательных отношений части образовательной программы и изучается в семестре(ах): 3.

Последующие дисциплины (практики) по связям компетенций:

Б3.О.01(Д) Выполнение и подготовка к защите выпускной квалификационной работы;

Б3.О.02(Д) Защита выпускной квалификационной работы;

Б1.В.10 Квалификация технологического оборудования и валидация технологических процессов;

Б2.В.01.02(Н) производственная практика, технологическая (проектно-технологическая) практика;

Б1.В.ДВ.03.02 Статистические методы в управлении качеством;

Б1.В.ДВ.03.01 Статистический анализ производственных данных;

Б1.В.ДВ.02.01 Физико-химические методы анализа в производстве лекарственных средств;

В процессе изучения дисциплины студент готовится к видам профессиональной деятельности и решению профессиональных задач, предусмотренных ФГОС ВО и образовательной программой.

## 3. Объем дисциплины и виды учебной работы

*Очная форма обучения*

Период	доемкость сы)	доемкость ЭТ)	ая работа всего)	сие занятия сы)	ии в период обучения (часы)	ьная работа а (часы)	ая аттестация сы)

обучения	Общая гру (час	Общая гру (ЗЕ	Контактн (часы,	Практичест (ча	Консультаци теоретического	Самостоятел. студент	Промежуточн (ча
Третий семестр	108	3	32	24	8	74	Зачет (2)
Всего	108	3	32	24	8	74	2

#### 4. Содержание дисциплины

##### 4.1. Разделы, темы дисциплины и виды занятий

###### Очная форма обучения

Наименование раздела, темы	Всего	Практические занятия	Самостоятельная работа студента	Консультации в период теоретического обучения	Планируемые результаты обучения, соотнесенные с результатами освоения программы
<b>Раздел 1. Замещение атома водорода на электрофил и радикал</b>	<b>20</b>	<b>6</b>	<b>12</b>	<b>2</b>	ПК-П2.4
Тема 1.1. Процессы сульфирования, нитрования и галогенирования	10	3	6	1	
Тема 1.2. Процессы нитрозирования и азосочетания, алкилирования и ацилирования	10	3	6	1	
<b>Раздел 2. Замещение галогена, гидроксила и сульфогруппы на нуклеофил</b>	<b>10</b>	<b>3</b>	<b>6</b>	<b>1</b>	
Тема 2.1. Процессы нуклеофильного замещения галогена, гидроксила, сульфо и др. групп	10	3	6	1	
<b>Раздел 3. Синтез гетероциклических соединений</b>	<b>76</b>	<b>15</b>	<b>56</b>	<b>5</b>	
Тема 3.1. Методы синтеза пятичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами	31	6	23	2	
Тема 3.2. Методы получения ароматических шестичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами	30	6	22	2	
Тема 3.3. Методы синтеза конденсированных гетероциклических систем	15	3	11	1	

<b>Итого</b>	<b>106</b>	<b>24</b>	<b>74</b>	<b>8</b>	
--------------	------------	-----------	-----------	----------	--

## 4.2. Содержание разделов, тем дисциплин и формы текущего контроля

### *Раздел 1. Замещение атома водорода на электрофил и радикал*

#### *Тема 1.1. Процессы сульфирования, нитрования и галогенирования*

Механизмы, направление и скорость реакций.

Методы сульфирования аренов серной кислотой, олеумом, серным ангидридом, неводными растворами SO<sub>3</sub> и его комплексами: область применения; характеристика сульфлирующих агентов; влияние технологических параметров на процесс достоинства и недостатки методов. Выделение сульфокислот и их очистка.

Методы нитрования органических соединений концентрированной азотной кислотой, её смесями с серной кислотой и уксусным ангидридом, разбавленной азотной кислотой: область применения; влияние технологических параметров на процесс нитрования; достоинства и недостатки методов. Технология нитрования серно – азотной смесью и её смесью с уксусным ангидридом. Выделение и очистка нитросоединений.

Методы галогенирования аренов, алканов и в боковую цепь аренов: влияние технологических параметров на процесс галогенирования; сравнительная характеристика хлорирования, бромирования и йодирования; достоинства и недостатки методов; особенности технологий; специфические переносчики галогена.

Текущий контроль (очная форма обучения)

Вид (форма) контроля, оценочное средство
Тест
Письменный опрос
Контроль самостоятельной работы

#### *Тема 1.2. Процессы нитрозирования и азосочетания, алкилирования и ацилирования*

Механизмы, направление и скорость реакций.

Процессы нитрозирования, диазотирования, замены диазогруппы и азосочетания: влияние технологических параметров на ход процесса, свойства диазосоединений и реакции замены диазониевой группы, реакция азосочетания.

Процессы алкилирования (гидроксиметилирования, галогенметилирования, аминометилирования) и ацилирования (формилирования) аренов: алкилирующие и ацилирующие агенты, их характеристики; механизмы реакций; область их применения, достоинства и недостатки. Побочные процессы и методы повышения селективности. Сравнительная характеристика процессов алкилирования и ацилирования. Сходство и различие. Побочные процессы и методы повышения селективности.

Текущий контроль (очная форма обучения)

Вид (форма) контроля, оценочное средство
Тест
Письменный опрос
Контроль самостоятельной работы

### *Раздел 2. Замещение галогена, гидроксила и сульфогруппы на нуклеофил*

#### *Тема 2.1. Процессы нуклеофильного замещения галогена, гидроксила, сульфо и др. групп*

Нуклеофильное замещение галогена, гидроксила, сульфогруппы в молекуле органического соединения, N- и O- ацилирование. Механизмы реакций (SN1, SN2, SNi, SNAr, SNEA, SNAE). Влияние строения субстрата, полярности среды, нуклеофильности атакующих частиц и других технологических факторов на механизм, скорость и условия проведения процессов. Практическое значение нуклеофильного замещения.

Текущий контроль (очная форма обучения)

Вид (форма) контроля, оценочное средство
Тест
Письменный опрос
Контроль самостоятельной работы

### **Раздел 3. Синтез гетероциклических соединений**

*Тема 3.1. Методы синтеза пятичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами*

Синтезы пятичленных гетероциклов с одним и двумя гетероатомами: производных фурана, пиррола, тиофена, индола, имидазола, пиразола, оксазола, изоксазола, тиазола, бензимидазола и др. (ароматичность, механизмы, достоинства и недостатки)

Текущий контроль (очная форма обучения)

Вид (форма) контроля, оценочное средство
Письменный опрос
Контроль самостоятельной работы

*Тема 3.2. Методы получения ароматических шестичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами*

Синтезы шестичленных гетероциклов с одним и двумя гетероатомами: производных пиридина, хинолина, изохинолина, фентиазина, пиридазина, пиримидина, (урацилов, тимина, цитазина, оротовой и барбитуровой кислот, барбитуратов и др.) пиразина, бензпиразина, гексамидина (ароматичность, механизмы, достоинства и недостатки).

Текущий контроль (очная форма обучения)

Вид (форма) контроля, оценочное средство
Письменный опрос
Контроль самостоятельной работы

*Тема 3.3. Методы синтеза конденсированных гетероциклических систем*

Анализ применения основных методов синтеза конденсированных гетероциклических систем (область применения, механизмы, технологические параметры, достоинства и недостатки) в синтезе БАВ.

Технология получения фолиевой кислоты.

Текущий контроль (очная форма обучения)

Вид (форма) контроля, оценочное средство
Письменный опрос
Контроль самостоятельной работы

### **4.3. Содержание занятий семинарского типа.**

**Очная форма обучения. Практические занятия (24 ч.)**

**Раздел 1. Замещение атома водорода на электрофил и радикал (6 ч.)**

#### Тема 1.1. Процессы сульфирования, нитрования и галогенирования (3 ч.)

Анализ применения методов сульфирования, нитрования и галогенирования ароматических и алифатических соединений (область применения, механизмы, технологические параметры, достоинства и недостатки).

#### Тема 1.2. Процессы нитрозирования и азосочетания, алкилирования и ацилирования (3 ч.)

Анализ применения процессов нитрозирования, диазотирования и замены диазогруппы, азосочетания (механизмы, технологические параметры), а также основных методов алкилирования и ацилирования, гидрокси, галогено и аминометилирования (алкилирующие и ацилирующие агенты механизмы, достоинства и недостатки) в синтезе БАВ.

#### **Раздел 2. Замещение галогена, гидроксила и сульфогруппы на нуклеофил (3 ч.)**

##### Тема 2.1. Процессы нуклеофильного замещения галогена, гидроксила, сульфо и др. групп (3 ч.)

Анализ процессов замещения галогена, гидроксила, сульфо и др. групп ( N,O-ацилирование) на другие атомы и группы: область применения, механизмы, влияние субстрата, среды, активности частиц, технологических параметров.

Технология получения пантотената кальция.

#### **Раздел 3. Синтез гетероциклических соединений (15 ч.)**

##### Тема 3.1. Методы синтеза пятичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами (6 ч.)

1. Методы синтеза пятичленных гетероциклических соединений с одним гетероатомом
2. Методы синтеза пятичленных гетероциклических соединений с двумя гетероатомами

##### Тема 3.2. Методы получения ароматических шестичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами (6 ч.)

1. Методы получения ароматических шестичленных гетероциклических соединений с одним гетероатомом.
2. Методы получения ароматических шестичленных гетероциклических соединений с двумя гетероатомами

##### Тема 3.3. Методы синтеза конденсированных гетероциклических систем (3 ч.)

Анализ основных методов синтеза конденсированных гетероциклических систем (область применения, механизмы, технологические параметры, достоинства и недостатки) в синтезе БАВ. Анализ технологии получения фолиевой кислоты.

#### **4.4. Содержание занятий семинарского типа.**

#### **Очная форма обучения. Консультации в период теоретического обучения (8 ч.)**

##### **Раздел 1. Замещение атома водорода на электрофил и радикал (2 ч.)**

##### Тема 1.1. Процессы сульфирования, нитрования и галогенирования (1 ч.)

Консультация по теме "Процессы сульфирования, нитрования и галогенирования"

##### Тема 1.2. Процессы нитрозирования и азосочетания, алкилирования и ацилирования (1 ч.)

Консультация по теме "Процессы нитрозирования и азосочетания, алкилирования и ацилирования "

##### **Раздел 2. Замещение галогена, гидроксила и сульфогруппы на нуклеофил (1 ч.)**

##### Тема 2.1. Процессы нуклеофильного замещения галогена, гидроксила, сульфо и др. групп (1 ч.)

Консультация по теме "Процессы нуклеофильного замещения галогена, гидроксила, сульфо и др. групп "

##### **Раздел 3. Синтез гетероциклических соединений (5 ч.)**

##### Тема 3.1. Методы синтеза пятичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами (2 ч.)

1. Консультация по теме "Методы синтеза пятичленных гетероциклических соединений с

одним гетероатомом"

2. Консультация по теме "Методы синтеза пятичленных гетероциклических соединений с двумя гетероатомами"

Тема 3.2. Методы получения ароматических шестичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами (2 ч.)

1. Консультация по теме "Методы получения ароматических шестичленных гетероциклических соединений с одним гетероатомом".

2. Консультация по теме "Методы получения ароматических шестичленных гетероциклических соединений с двумя гетероатомами "

Тема 3.3. Методы синтеза конденсированных гетероциклических систем (1 ч.)

Консультация по теме "Методы синтеза конденсированных гетероциклических систем"

#### **4.5. Содержание самостоятельной работы обучающихся**

**Очная форма обучения. Самостоятельная работа студента (74 ч.)**

**Раздел 1. Замещение атома водорода на электрофил и радикал (12 ч.)**

Тема 1.1. Процессы сульфирования, нитрования и галогенирования (6 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний и промежуточной аттестации

Тема 1.2. Процессы нитрозирования и азосочетания, алкилирования и ацилирования (6 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний и промежуточной аттестации

**Раздел 2. Замещение галогена, гидроксила и сульфогруппы на нуклеофил (6 ч.)**

Тема 2.1. Процессы нуклеофильного замещения галогена, гидроксила, сульфо и др. групп (6 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний и промежуточной аттестации

**Раздел 3. Синтез гетероциклических соединений (56 ч.)**

Тема 3.1. Методы синтеза пятичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами (23 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний и промежуточной аттестации.

Тема 3.2. Методы получения ароматических шестичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами (22 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний и промежуточной аттестации

Тема 3.3. Методы синтеза конденсированных гетероциклических систем (11 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний и промежуточной аттестации

#### **5. Порядок проведения промежуточной аттестации**

*Промежуточная аттестация: Зачет, Третий семестр.*

Промежуточная аттестация осуществляется в виде зачета. Зачет проводится в форме оценки портфолио.

Порядок проведения зачета:

1. Зачет проводится в период теоретического обучения. Не допускается проведения зачета на последнем аудиторном занятии.

2. Преподаватель принимает зачет только при наличии ведомости и надлежащим образом оформленной зачетной книжки студента.

3. Результат зачета объясняется студенту непосредственно после его сдачи, затем выставляется в ведомость и зачетную книжку студента. Положительная оценка заносится в ведомость и зачетную книжку, неудовлетворительная оценка проставляется только в ведомость. В случае неявки студента для сдачи зачета в ведомости делается запись "не явился".

Портфолио студента оценивается в категориях "зачтено - не зачтено". В рамках промежуточной аттестации оценка "зачтено" выставляется, если все элементы портфолио имеют оценку не ниже "удовлетворительно".

Если по итогам проведенной промежуточной аттестации хотя бы одна из компетенций не



сформирована на уровне требований к дисциплине в соответствии с образовательной программой (результаты обучающегося не соответствуют критериям сформированности компетенции) обучающемуся выставляется оценка "не зачтено"

## **6. Материально-техническое и учебно-методическое обеспечение дисциплины**

### **6.1. Перечень основной и дополнительной учебной литературы**

#### *Основная литература*

1. Мокрушин В. С., Вавилов Г. А. Основы химии и технологии биоорганических и синтетических лекарственных веществ [Электронный ресурс]: - Санкт-Петербург: Проспект Науки, 2009. - 494 с.
2. Москвичев Ю. А., Фельдблюм В. Ш. Продукты органического синтеза и их применение [Электронный ресурс]: - Санкт-Петербург: Проспект Науки, 2009. - 376 с.

#### *Дополнительная литература*

1. Пассет Б. В. Основные процессы химического синтеза биологически активных веществ [Электронный ресурс]: Серия "XXI век" - Москва: Изд. дом "ГЭОТАР - МЕД", 2002. - 376 с.
2. Коротченкова Н. В., Иозеп А. А. Химическая технология витаминов [Электронный ресурс]: - Санкт-Петербург: Проспект Науки, 2017. - 224 - Режим доступа: <http://www.iprbookshop.ru/35800.html>

### **6.2. Профессиональные базы данных и ресурсы «Интернет», к которым обеспечивается доступ обучающихся**

#### *Профессиональные базы данных*

1. eLibrary.ru - Портал научных публикаций

#### *Ресурсы «Интернет»*

1. <https://himsintez24ru/dushistye-veshestva> - Сайт "Химсинтез 24"
2. <https://scholar.google.com/> - Сайт для поиска научной информации
3. [www.viniti.ru](http://www.viniti.ru) - Сайт поиска научно-технической информации
4. <http://www.iprbookshop.ru> - ЭБС IPR BOOKS : электронная библиотечная система / ООО Компания «Ай Пи Ар Медиа», гл.ред. Е. А. Богатырева. — [Саратов]

### **6.3. Программное обеспечение и информационно-справочные системы, используемые при осуществлении образовательного процесса по дисциплине**

Для обеспечения реализации дисциплины используется стандартный комплект программного обеспечения (ПО), включающий регулярно обновляемое свободно распространяемое и лицензионное ПО, в т.ч. MS Office.

Программное обеспечение для адаптации образовательных ресурсов для обучающихся из числа лиц с ограниченными возможностями здоровья:

Программа экранного доступа Nvda - программа экранного доступа к системным и офисным приложениям, включая web-браузеры, почтовые клиенты, Интернет-мессенджеры и офисные пакеты. Встроенная поддержка речевого вывода на более чем 80 языках. Поддержка большого числа брайлевских дисплеев, включая возможность автоматического обнаружения многих из них, а также поддержка брайлевского ввода для дисплеев с брайлевской клавиатурой. Чтение элементов управления и текста при использовании жестов сенсорного экрана.

#### *Перечень программного обеспечения*

*(обновление производится по мере появления новых версий программы)*

Не используется.

*Перечень информационно-справочных систем  
(обновление выполняется еженедельно)*

Не используется.

#### **6.4. Специальные помещения, лаборатории и лабораторное оборудование**

Для обеспечения реализации дисциплины используется оборудование общего назначения, специализированное оборудование, оборудование, обеспечивающее адаптацию электронных и печатных образовательных ресурсов для обучающихся из числа лиц с ограниченными возможностями здоровья, наборы демонстрационного оборудования и учебно-наглядных пособий по списку.

Оборудование общего назначения:

Презентационное оборудование (мультимедиа-проектор, экран, компьютер для управления) - для проведения лекционных и семинарских занятий.

Компьютерный класс (с выходом в Internet) - для организации самостоятельной работы обучающихся.

Оборудование, обеспечивающее адаптацию электронных и печатных образовательных ресурсов для обучающихся из числа лиц с ограниченными возможностями здоровья (место размещения - учебно-методический отдел, устанавливается по месту проведения занятий (при необходимости)):

Устройство портативное для увеличения DION OPTIC VISION - предназначено для обучающихся с нарушением зрения с целью увеличения текста и подбора контрастных схем изображения;

Электронный ручной видеоувеличитель Bigger D2.5-43 TV - предназначено для обучающихся с нарушением зрения для увеличения и чтения плоскочечатного текста;

Радиокласс (радиомикрофон) «Сонет-PCM» РМ-6-1 (заушный индиктор) - портативная звуковая FM-система для обучающихся с нарушением слуха, улучшающая восприятие голосовой информации.

Специализированное оборудование:

учебно-лабораторные помещения

Шкаф вытяжной ЛАБ-1800ШВ-Н - 1 шт.

Шкаф вытяжной ЛАБ-1800ШВ-Н - 1 шт.

#### **7. Методические указания по освоению дисциплины (модуля)**

В ходе реализации учебного процесса по дисциплине проводятся учебные занятия и выполняется самостоятельная работа. По вопросам, возникающим в процессе выполнения самостоятельной работы, проводятся консультации.

Для организации и контроля самостоятельной работы обучающихся, а также проведения консультаций применяются информационно-коммуникационные технологии:

Информирование: <http://edu.spcpu.ru/course/view.php?id=1336>

Консультирование: <http://edu.spcpu.ru/course/view.php?id=1336>

Контроль: <http://edu.spcpu.ru/course/view.php?id=1336>

Размещение учебных материалов: <http://edu.spcpu.ru/course/view.php?id=1336>

Учебно-методическое обеспечение:

Иозеп А.А. Основы химического синтеза биологически активных веществ : электронный учебно-методический комплекс / А.А.Иозеп, Б.Ю.Лалаев; ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России. – Санкт-Петербург, 2018. – Текст электронный // ЭИОС СПХФУ : [сайт]. – URL:

### ***Методические указания по формам работы***

#### *Консультации в период теоретического обучения*

Консультации в период теоретического обучения предназначены для разъяснения порядка выполнения самостоятельной работы и ответа на сложные вопросы в изучении дисциплины. В рамках консультаций проводится контроль выполнения обучающимся самостоятельной работы. Контроль осуществляется в следующей форме:

##### **Задач и заданий репродуктивного уровня**

Краткая характеристика оценочного средства: представляет собой средство, позволяющее оценивать и диагностировать знание фактического материала (базовые понятия, алгоритмы, факты) и умение правильно использовать специальные термины и понятия, узнавание объектов изучения в рамках определенного раздела дисциплины.

Представление оценочного средства в оценочных материалах: комплект задач и заданий

##### **Задач и заданий реконструктивного уровня**

Краткая характеристика оценочного средства: представляет собой средство, позволяющее оценивать и диагностировать умения синтезировать, анализировать, обобщать фактический и теоретический материал с формулированием конкретных выводов, установлением причинно-следственных связей.

Представление оценочного средства в оценочных материалах: комплект задач и заданий

#### *Практические занятия*

Практические занятия предусматривают применение преподавателем различных интерактивных образовательных технологий и активных форм обучения: дискуссия, деловая игра, круглый стол, мини-конференция. Текущий контроль знаний осуществляется на практических занятиях и проводится в форме:

##### **Письменный опрос**

Краткая характеристика оценочного средства: представляет собой средство проверки знаний по теме или разделу, подразумевающее письменный ответ студента на поставленный вопрос.

Представление оценочного средства в оценочных материалах: вопросы по темам/разделам дисциплины.