

МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ И НАУКИ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
Ярославский государственный университет им. П.Г. Демидова
Факультет биологии и экологии

УТВЕРЖДАЮ

Проректор по развитию образования
_____ Е.В.Сапир

" ____ " _____ 2012 г.

**Рабочая программа дисциплины
послевузовского профессионального образования
(аспирантура)
Стратегия органического синтеза карбо- и гетероароматических структур
по специальности научных работников
02.00.03 Органическая химия**

Ярославль 2012

1. Цели освоения дисциплины

Целями освоения дисциплины «Стратегия органического синтеза карбо- и гетероароматических структур» в соответствии с общими целями основной профессиональной образовательной программы послевузовского профессионального образования (аспирантура) (далее - образовательная программа послевузовского профессионального образования) являются:

- знание основных современных подходов к планированию многостадийных синтезов;
- представление о синтетическом методе и ретросинтетическом анализе;
- представления об основных методах конструирования сложных органических молекул;
- формирование навыков синтеза сложных органических соединений,
- знание и применение теории реакционной способности органических соединений для решения научных и прикладных задач.

2. Место дисциплины в структуре образовательной программы послевузовского профессионального образования

Данная дисциплина относится к разделу обязательные дисциплины (подраздел дисциплины по выбору аспиранта ОД.А.04) образовательной составляющей образовательной программы послевузовского профессионального образования по специальности научных работников 02.00.03 органическая химия.

Дисциплина «Стратегия органического синтеза карбо- и гетероароматических структур» показывает пути решения одной из важных проблем современной органической химии – разработка путей синтеза сложных органических молекул.

Для изучения данной дисциплины необходимы «входные» знания, умения, полученные в процессе обучения по программам специалитета или бакалавриата – магистратуры, а также при изучении дисциплины «Современная органическая химия») в аспирантуре и готовность обучающегося, к восприятию знаний и навыков, необходимых при освоении данной дисциплины и приобретенных в результате освоения предшествующих дисциплин. Освоение данной дисциплины необходимо как предшествующее для выполнения и защиты диссертации на соискание ученой степени кандидата химических наук.

3. Требования к результатам освоения содержания дисциплины «Стратегия органического синтеза карбо- и гетероароматических структур»

В результате освоения дисциплины «Стратегия органического синтеза карбо- и гетероароматических структур» обучающийся должен:

знать:

- методы планирования многостадийных синтезов;
- способы получения карбо- и гетероароматических структур и трансформации функциональных групп.

уметь:

- оценивать и анализировать свойства органических соединений в сопоставлении с их строением;
- осуществлять планирование синтеза сложных органических соединений, находить оптимальные пути синтеза;
- оценивать реакционную способность карбо- и гетероароматических структур.

владеть:

- навыками осуществления синтеза органических соединений заданного строения;
- методами установления строения карбо- и гетероароматических соединений
- методами оценки реакционной способности.

4. Структура и содержание дисциплины «Стратегия органического синтеза карбо- и гетероароматических структур»

Общая трудоемкость дисциплины составляет 3 зачетные единицы, 108 часов.

№ п/п	Раздел Дисциплины	Курс	Неделя	Виды учебной работы, включая самостоятельную работу обучающихся, и трудоемкость (в часах) Форма обуч.: очная/заочная					Формы текущего контроля успеваемости (по неделям) Форма промежуточной аттестации
				Лекций	Лабораторных	Практических	Сам. работа	Контроль сам. работы	
1	Тема 1. Синтетический анализ в планировании органического синтеза.	1	1	1/1			17/17		Задание в рамках самостоятельной работы
2	Тема 2. Ретросинтетический анализ.	1	2	1/0			17/18		Задание в рамках самостоятельной работы
3	Тема 3. Конструирование углеродного скелета.	1	3	1/1			17/17		Задание в рамках самостоятельной работы
4	Тема 4. Активация реакционных центров.	1	4	1/1			17/17		Задание в рамках самостоятельной работы
5	Тема 5. Трансформации функциональных групп.	1	5	1/0			17/18		Задание в рамках самостоятельной работы
6	Тема 6. Защитные группы в синтезе.	1	6	1/1			17/17		Задание в рамках самостоятельной работы
		1		6/4			102/104		Зачет

Содержание дисциплины

Тема 1. Введение в органический синтез. Стратегия и тактика органического синтеза. Общие принципы планирования органического синтеза; математическое и компьютерное планирование. Основные понятия: прямое и ретросинтетическое планирование, дерево синтеза, целевые и исходные соединения, синтоны, синтетические эквиваленты, реагенты, субстраты. Синтетический анализ в планировании органического синтеза.

Тема 2. Ретросинтетический анализ. Основные этапы ретросинтетического анализа. Типы стратегий в ретросинтетическом анализе. Стратегии, базирующиеся на трансформах, на функциональных группах; топологические и стереохимические стратегии. Линейный и конвергентный синтез. Трансформации: расчленение, сочленение, введение функциональной группы, изменение функциональной группы, замена одной функциональной группы на другую, перегруппировка. Выбор первичного расчленения. Синтонный подход. Соответствие синтонов, синтетических эквивалентов, реагентов. Основные типы синтонов. Нуклеофильные и электрофильные синтоны.

Тема 3. Конструирование углеродного скелета. Методы создания связи углерод-углерод. Расщепление связи углерод-углерод и перестройка углеродного скелета. Методы построения

карбо- и гетероциклов. Расширение циклов по Демьянову. [2+4]-Циклоприсоединение по Дильсу-Альдеру. Типы диенов и диенофилов и характеристики их активности. Стереохимия диенового синтеза. Условия внутримолекулярного циклообразования.

Тема 4. Активация реакционных центров. Медьорганические реагенты в синтезе. Комплексы медьорганических соединений, их использование в синтезе. Использование других металлоорганических соединений в синтезе. Методы генерирования енолятов. Доноры и акцепторы Михаэля. Катализаторы реакции, ее обратимость, побочные процессы. Енамины как доноры Михаэля. Понятие о каскадных реакциях. Стабилизированные и нестабилизированные илidy.

Тема 5. Трансформации функциональных групп. Гидролитическое расщепление. Термическое и окислительное расщепление. Пинаколиновая и другие перегруппировки. Методы окисления органических соединений. Методы восстановления органических соединений.

Тема 6. Защитные группы в синтезе. Понятие «защитная группа». Требования к защитным группам: легкость введения, стабильность при трансформации молекулы, легкость удаления. Условия введения и удаления защитных групп, устойчивость их к действию различных реагентов (кислот, оснований, окислителей, восстановителей и др.). Метод выбора условий и реагентов. Метод «скрытой функциональности». Методы введения и удаления защитных групп. Понятие «модифицируемой» защитной группы. Защита ненасыщенных связей.

5. Образовательные технологии

В преподавании используются мультимедийные презентации, иллюстрации, таблицы, методические пособия.

В преподавании курса используются активные и интерактивные технологии проведения занятий в сочетании с внеаудиторной работой.

6. Оценочные средства для текущего контроля успеваемости, промежуточной аттестации по итогам освоения дисциплины и учебно-методическое обеспечение самостоятельной работы обучающихся

В качестве средств текущего контроля используются выполняемые в рамках самостоятельной работы задания. Промежуточная аттестация (зачет) дает возможность выявить уровень профессиональной подготовки аспиранта по данной дисциплине.

Задание № 1

Подобрать исходные соединения и составить план (дерево) синтеза заданной карбоили гетероциклической структуры.

Задание № 2

С использованием ретросинтетического анализа составить план синтеза заданного соединения.

Задание № 3

Проанализировать составленные планы в **Заданиях № 1 и 2** и сделать выбор оптимального пути синтеза заданного соединения.

Задание № 4

Разработать план синтеза целевого соединения с применением элементоорганических соединений на отдельных стадиях, каскадных реакций и др.

Задание № 5

Введение и изменение функциональных групп в заданном соединении.

Задание № 6

Осуществить выбор защитных групп в синтезе заданной структуры.

Вопросы к аттестации (зачету)

1. Общие принципы планирования органического синтеза.
2. Основные понятия: прямое и ретросинтетическое планирование, дерево синтеза, целевые и исходные соединения, синтоны, синтетические эквиваленты, реагенты, субстраты.
3. Основные этапы ретросинтетического анализа.
4. Методы создания связи углерод-углерод.
5. Расщепление связи углерод-углерод и перестройка углеродного скелета.
6. Методы окисления органических соединений.
7. Методы восстановления органических соединений.
8. Методы построения циклов.
9. Реакции раскрытия циклов.
10. Применение защитных групп в органическом синтезе.

7. Учебно-методическое и информационное обеспечение дисциплины

а) основная литература: (не более двух наименований – желательно наличие в библиотеке)

В. Смит, А. Бочков, Р. Кейпл. Органический синтез. Наука и искусство. М.: Мир. 2001.

Мандельштам Т. В. Стратегия и тактика органического синтеза. Л., 1989.

б) дополнительная литература:

Ч. Пейн, Л. Пейн. Как выбирать путь синтеза органического соединения. М.: Мир. 1973.

Орлов В.Ю., Котов А.Д., Русаков А.И. Функционализация карбо- N,O-содержащих гетероароматических систем. - Мир, 2010

О.А. Реутов, А.Л. Курц, К.П. Бутин. Органическая химия. В 4 ч. М.: БИНОМ. Лаборатория знаний. 2005. Ч.1, 568 с.; Ч. 2, 624 с.; Ч. 3. 544 с.; Ч. 4, 728 с.

в) программное обеспечение и Интернет-ресурсы:

1. Журналы научной электронной библиотеки (elibrary.ru)

2. Журналы американского химического общества (<http://pubs.acs.org>)

3. Доступ к патентным базам данных компании Questel (<http://www.qpat.com/>)

4. Organic Chemistry Portal (<http://www.organic-chemistry.org/>)

5. Журналы Wiley-VCH (<http://www.wiley-vch.de/publish/en/journals/alphabeticalIndex/?sID=g2l06r5eqi7q28ioctnuhhimo1>)

8. Материально-техническое обеспечение дисциплины

Компьютерный класс – 7 рабочих мест.

Программа составлена в соответствии с федеральными государственными требованиями к структуре основной профессиональной образовательной программы послевузовского профессионального образования (аспирантура) (приказ Минобрнауки от 16.03.2011 г. № 1365) с учетом рекомендаций, изложенных в письме Минобрнауки от 22.06.2011 г. № ИБ – 733/12.

Программа одобрена на заседании кафедры органической и биологической химии

17.10.2012 г. (протокол № 5)

Заведующий кафедрой

Орлов В.Ю., д.х.н., проф.

Автор

Котов А.Д., д.х.н., проф.