

МИНИСТЕРСТВО НАУКИ И ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ РФ
МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ, НАУКИ, КУЛЬТУРЫ И СПОРТА РА
Г О У В П О Р О С С И Й С К О - А Р М Я Н С К И Й У Н И В Е Р С И Т Е Т

Составлена в соответствии с федеральными
Государственными требованиями к структуре
основной профессиональной образовательной
программы послевузовского профессионального
образования (аспирантура)

Институт: Биомедицины и фармации
Кафедра: Общей и фармацевтической химии



Учебная программа подготовки аспиранта и соискателя
ДИСЦИПЛИНА: 2.1.9.3

Технология синтеза биологически активных веществ

наименование дисциплины (модуля) по учебному плану подготовки аспиранта

1.4.3.

-Шифр

Органическая химия

наименование научной специальности

Программа одобрена на заседании
кафедры

протокол № 12 от 13.07. 2023 г.

Утверждена Ученым Советом ИБМиФ

протокол № 12 от 18.07. 2023 г.

Заведующий кафедрой

Подпись

к.х.н., доцент, Григорян А.М.
И.О.Ф, ученая степень, звание

Разработчик программы

Подпись

к.х.н., доцент, Григорян А.М.
И.О.Ф, ученая степень, звание

Ереван 2023г.

Общие положения

Настоящая рабочая программа обязательной дисциплины (модуля) “Технология синтеза биологически активных веществ”

образовательной программы послевузовского профессионального образования (ООП ППО) ориентирована на аспирантов университета, уже прослушавших курс лекций по органической химии, а также общие и специальные курсы по различным разделам химии. Она разработана на основании законодательства Российской Федерации в системе послевузовского профессионального образования.

1. Цели изучения дисциплины (модуля)

Целью изучения дисциплины “Технология синтеза биологически активных веществ”

является углубление знаний у аспирантов и будущих преподавателей и научных работников высшей квалификации в области техники и технологии, математики, естественных и экономических наук. Быть способным и готовым использовать основные законы естественнонаучных дисциплин в профессиональной деятельности, применять методы математического моделирования, теоретического и экспериментального исследования. Владеть планированием эксперимента, обработкой и представлением полученных результатов.

Задачи дисциплины заключаются в изучении:

- оптимальные пути синтеза некоторых биологически активных веществ.
- важнейшие методы галогенирования нитрования, сульфирования, алкилирования и ацилирования органических молекул.
- Информационные возможности современных физико-химических методов исследования: спектральных (УФ-, ИК-, ЯМР ^1H -спектроскопия), хроматографических (ТСХ, ГЖХ, ВЭЖХ), масс-спектрометрического метода и границы их использования в анализе и идентификации биологически активных органических соединений.
- Строение и основные химические свойства групп соединений растительного и животного происхождения - терпеноидов, стероидов, алкалоидов – как основу для получения синтетических аналогов и производных.

Место дисциплины в структуре основной профессиональной образовательной программы послевузовского профессионального образования (аспирантура)

Дисциплина “Технология синтеза биологически активных веществ” является важной частью биоорганической химии и занимает важное место в ряду других химических дисциплин и является одним из связующих звеньев между химическими и биологическими, а также медицинскими и фармацевтическими дисциплинами, поскольку большинство процессов протекающих в живой природе включают реакции, биологически активных соединений. Важно также, что более 90% всех применяемых в медицине лекарств – растительного и животного происхождения.

2. Компетенции обучающегося, формируемые в результате освоения дисциплины (модуля)

Аспирант или соискатель должен

- знать:

- Что такое биологически активные вещества, историю и эволюцию органической химии лекарственных веществ. Обладать знаниями об основных принципах создания новых синтетических лекарственных препаратов и усвоить связь между структурой лекарств и их биологической активностью.
- Методы синтеза биологически активных органических соединений на базе знаний и умений, полученных при изучении органической химии.
- Методы введения в органические молекулы важнейших функциональных групп на основе знаний классов органических соединений: строения, правил номенклатуры, физических свойств, способов получения, типичных и специфических химических свойств и электронных механизмов соответствующих реакций.
- Важнейшие методы окисления и восстановления биологически активных органических соединений.
- Общие правила и порядок работы в химической лаборатории. Правила техники безопасности.

- уметь:

- ориентироваться в методах органического синтеза лекарственных препаратов, усвоить классификацию лекарственных веществ;

- Определять наличие и тип кислотных и основных центров и давать сравнительную оценку силы кислотности и основности биологически активных веществ, на основании чего выбирать пути их выделения и очистки из реакционных смесей;
- Ставить простой учебно-исследовательский эксперимент на основе овладения основными приемами техники работ в лаборатории, выполнять расчеты, составлять отчеты и рефераты по работе, пользоваться справочным материалом;

- демонстрировать

- основные методы синтеза органических соединений;
- планирование эксперимента, обработку и представление полученных результатов.

3. Объем дисциплины (модуля) и количество учебных часов

Вид учебной работы	Кол-во зачетных единиц*/уч.часов
Аудиторные занятия	26/0.72
Лекции (минимальный объем теоретических знаний)	8
Семинар	
Практические занятия	18
Другие виды учебной работы (авторский курс, учитывающий результаты исследований научных школ Университета, в т.ч. региональных)	
Формы текущего контроля успеваемости аспирантов	
Внеаудиторные занятия:	10/0.28
Самостоятельная работа аспиранта	10
ИТОГО	36/1
Вид итогового контроля	Составляющая экзамена кандидатского минимума зачет

*) Одна зачётная единица соответствует 36 академическим часам продолжительностью 45 минут.

4. Содержание дисциплины (модуля)

4.1 Содержание лекционных занятий

№п /п	Содержание	Кол-во уч.часов
1	Что такое биологически активные вещества (БАВ). Основные требования к лекарственным веществам. Стадии биологического изучения лекарственного вещества. Стратегия создания синтетических препаратов (лекарств): принцип машинного скрининга; принцип химического моделирования; принцип введения фармакофорной группы; принцип молекулярного моделирования; методология комбинаторной химии	1
2	Связь химической структуры с биологической активностью лекарственных веществ. Принципиальная схема разработки нового лекарственного вещества. Классификация лекарственных веществ. Основные болезни человека и ведущие группы лекарственных веществ.	1
3	Синтез лекарственных веществ алифатического ряда: алкилгалогениды для наркоза; алканола и их производные, альдегиды и кислоты; витамины В12 и F. Лекарственные вещества ациклического ряда: замещенные циклогексаны. Витамин А. Синтез производных ароматического ряда: синтез антигистаминного препарата димедрола; синтез аспирина; синтез парацетамола (панадола).	2
4	Наркотики и наркомания. Исторический экскурс в проблему. Классификация наркотических препаратов и психотропных веществ. Химические формулы основных, особенно опасных, наркотических веществ.	2
5	Методы введения функциональных групп в углеродный скелет органических молекул.	2
Всего:		8

Практические занятия

№п /п	Содержание	Кол-во уч.часов
1	Аспирин А.Е.Арбузова. Достижения К.К. Клауса, Н.Н. Зинина, А.М.Бутлерова и других химиков. Лекарственные препараты древности.	3
2	синтез первых лекарственных препаратов: сульфаниламиды, хинин, пенициллин. Современные лекарственные средства.	2
3	Принцип действия лекарственных веществ. Транспорт через плазматическую мембрану. Строение клетки. Типы и функции мембран. Взаимодействие биологически активных веществ с рецепторами. Типы связей. Ферменты ? белковые специфические катализаторы биохимических реакций	2
4	Синтез лекарственных веществ алифатического ряда: диэтиловый	3

	эфир, алкилгалогениды для наркоза (этилхлорид, хлороформ, фторотан); алканола и их производные, альдегиды и кислоты; витамины В12 и F.	
5	Промышленный синтез этанола гидратацией этилена и ферментативный путь получения из сахаридов. Синтез сложных эфиров азотистой и азотной кислот с одно и полиатомными спиртами, например, нитроглицерин, эринит.	2
6	Монооксид азота и его роль в организме. Синтез антисептика метанала. Синтез аминокислот: метионина (используется при диабете, снимает токсические поражения печени), триптофана (используется при лечебном питании).	2
7	Классификация наркотических препаратов и психотропных веществ: производные конопли (марихуана, гашиш, анаша); опиатные наркотики (маковая соломка, сок маковых коробочек, морфин, кодеин, гкроин, метадон, промедол и другие);	2
8	Психостимуляторы (растения - кока, кола, эфедра, препараты - кокаин, эфедрин, первитин, амфетамин, экстази, кофеин и другие); ЛСД, кетамин, фенцилидин и другие; ингалянты (ЛНДВ) нефтепродукты, растворителя, лаки, краски.	2
	Всего:	18

Самостоятельная работа аспиранта

№п /п	Виды самостоятельной работы	Кол-во уч. часов
1	Повторение тем по истории открытия и синтеза первых лекарственных препаратов: сульфаниламиды, хинин, пенициллин. Современные лекарственные средства	1
2	Повторение тем связь химической структуры с биологической активностью (эффективностью) лекарственных веществ.	1
3	Повторение тем растворимость или полная нерастворимость (в случае действия, например, на гельминта в кишечнике); липофильность (способностью растворяться в жирах) и способностью проникать через мембраны клетки.	1
4	Подготовка по лекциям посвященным антибиотикам, содержащие азетидиновое ядро (нокардицины, монокабактамы, карбапенемы, тринемы, трибактамы, клавулановая кислота, пенемы, пенициллины, цефалоспорины.	2
5	Подготовка к семинару по синтезу лекарственных веществ алифатического ряда: диэтиловый эфир, алкилгалогениды для наркоза (этилхлорид, хлороформ, фторотан).	1
6	Подготовка по теме синтеза лекарственных веществ алифатического ряда: алканола и их производные, альдегиды и кислоты; витамины В12 и F.	1
7	Подготовка по теме синтез сложных эфиров азотистой и азотной кислот с одно и полиатомными спиртами, например, нитроглицерин, эринит.	1
8	Снотворно-седативные препараты (барбитураты, нитразепам, фенодорм, элениум, тазепам, реладорм Подготовка к семинару.	1
9	Подготовка по теме - Методы усложнения углеродного скелета	1

	органических соединений. Нуклеофильное и электрофильное замещение, нуклеофильное присоединение.	
Всего:		10

4 Перечень контрольных мероприятий и вопросы к экзаменам кандидатского минимума

Перечень вопросов к экзаменам кандидатского минимума:

Итоговая аттестация аспиранта включает сдачу кандидатских экзаменов и представление диссертации в Диссертационный совет. Порядок проведения кандидатских экзаменов включает в кандидатский экзамен по научной специальности дополнительные разделы, обусловленные спецификой научной специальности. Билеты кандидатского экзамена по специальной дисциплине в соответствии с темой диссертации на соискание ученой степени кандидата наук должны охватывать разделы Специальной дисциплины отрасли науки и научной специальности (ОД.А.) и Дисциплины научной специальности по выбору аспиранта (ОДН.А.).

Перечень вопросов к экзаменам кандидатского минимума:

1. Стратегия создания синтетических препаратов (лекарств): принцип машинного скрининга; принцип химического моделирования.
2. Синтез первых лекарственных препаратов: сульфаниламиды, хинин, пенициллин.
3. Синтез лекарственных веществ алифатического ряда: диэтиловый эфир, алкилгалогениды для наркоза (этилхлорид, хлороформ, фторотан).
4. Синтез лекарственных веществ алифатического ряда алканола и их производные.
5. Синтез сложных эфиров азотистой и азотной кислот с одно и полиатомными спиртами, например, нитроглицерин, эринит.
6. Синтез антисептика метанала.
7. Синтез антибиотиков содержащие азетидиновое ядро (нокардицины, монокабактамы, карбапенемы, тринемы,
8. Синтез антибиотиков содержащие азетидиновое ядро (трибактамы, клавулановая кислота, пенемы, пенициллины, цефалоспорины).
9. Снотворно-седативные препараты (барбитураты, нитразепам, фенодорм, элениум, тазепам).
10. Промышленный синтез этанола гидратацией этилена и ферментативный путь получения из сахаридов
11. Синтез аминокислот: метионина, триптофана.

12. Синтез лекарственных веществ; альдегиды и кислоты.
13. Синтез витаминов В12 и F.
14. Методы *O*, *N*, *C*-алкилирования и ацилирования органических соединений.
15. Методы галогенирования, нитрования и сульфирования органических соединений.
16. Методы усложнения углеродного скелета органических соединений. Нуклеофильное и электрофильное замещение, нуклеофильное присоединение.
17. Физико-химических методы исследования: спектральных спектральных (УФ-, ИК-, ЯМР ¹H-спектроскопия).
18. Физико-химических методы исследования: спектральных спектральных (ТСХ, ГЖХ, ВЭЖХ).

Образовательные технологии

В процессе обучения применяются следующие образовательные технологии:

1. Сопровождение лекций показом визуального материала.
2. Проведение лекций с использованием интерактивных методов обучения.
3. Лабораторные работы проводятся в лаборатории и включают синтез гетероциклических соединений и обсуждение их спектров.

5 Учебно-методическое и информационное обеспечение дисциплины (модуля)

Учебно-методические и библиотечно-информационные ресурсы обеспечивают учебный процесс и гарантируют качественное освоение аспирантом образовательной программы. Мультимедийная аудитория. Университет располагает обширной библиотекой, включающей научно-экономическую литературу, научные журналы и труды научно-практических конференций по основополагающим проблемам науки и практики управления.

7.1.Основная литература:

1. «Химическая технология лекарственных веществ. Основные процессы химического синтеза биологически активных веществ: учебное пособие» Иозеп А. А., Пассет Б. В., Самаренко В. Я., Щенникова О. Б. Издательство "Лань" ISBN 978-5-8114-2037-7 Год 2020 Издание 3-е изд

2. «Химическая технология фармацевтических субстанций» Иозеп А. А., Пассет Б. В., Самаренко В. Я., Щенникова О. Б. Издательство "Лань" ISBN 978-5-8114-9937-3 Год 2022 Издание 3-е изд.
3. БИООРГАНИЧЕСКАЯ ХИМИЯ 2-е изд., испр. и доп. Учебное пособие для вузов/ Мочульская Н. Н., Максимова Н. Е., Емельянов В. В. ; под науч. ред. Чарушина В.Н., издательство Юрайт, 2018 <https://urait.ru/bcode/415396>

4. 7.2. Дополнительная литература

Основы современного органического синтеза [Электронный ресурс] : учебное пособие / : В.А. Смит, А.Д. Дильман. Москва: Издательство "Лаборатория знаний" 2015. Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/66366>.

7.3. Интернет-ресурсы

<http://libweb.ksu.ru/vufind/Search/Results?type=AllFields&filter%5B%5D=building%3A%22eLIBRARY.RU%22>

<http://pubs.acs.org/> www.nanometer.ru - <http://www.nanometer.ru> www.nanotech.ru - www.nanotech.ru www.sciencedirect.com - <http://www.sciencedirect.com/>

6 Материально-техническое обеспечение

Учебные лаборатории, технические средства, используемые для нормального усвоения дисциплины, вычислительная техника, проектор, компьютерная аудитория.