

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.О.29 ХИМИЧЕСКАЯ ТЕХНОЛОГИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ
СУБСТАНЦИЙ И ВИТАМИНОВ**

Направление подготовки: 18.03.01 Химическая технология

Профиль подготовки: Производство фармацевтических препаратов

Формы обучения: очная

Квалификация (степень) выпускника: Бакалавр

Год набора: 2023

Срок получения образования: 4 года

Объем: в зачетных единицах: 8 з.е.
в академических часах: 288 ак.ч.

Разработчики:

Доцент кафедры химической технологии лекарственных веществ, кандидат химических наук Щенникова О. Б.

Рабочая программа дисциплины (модуля) составлена в соответствии с требованиями ФГОС ВО по направлению подготовки 18.03.01 Химическая технология, утвержденного приказом Минобрнауки России от 07.08.2020 № 922, с учетом трудовых функций профессиональных стандартов: "Специалист по промышленной фармации в области исследований лекарственных средств", утвержден приказом Минтруда России от 22.05.2017 № 432н; "Специалист по промышленной фармации в области контроля качества лекарственных средств", утвержден приказом Минтруда России от 22.05.2017 № 431н; "Специалист по промышленной фармации в области производства лекарственных средств", утвержден приказом Минтруда России от 22.05.2017 № 430н; "Специалист по валидации (квалификации) фармацевтического производства", утвержден приказом Минтруда России от 22.05.2017 № 434н; "Специалист по промышленной фармации в области обеспечения качества лекарственных средств", утвержден приказом Минтруда России от 22.05.2017 № 429н.

Согласование и утверждение

№	Подразделение или коллегиальный орган	Ответственное лицо	ФИО	Виза	Дата, протокол (при наличии)
1	Кафедра химической технологии лекарственных веществ	Заведующий кафедрой, руководитель подразделения, реализующего ОП	Лалаев Б. Ю.	Рассмотрено	04.05.2023
2	Методическая комиссия УГСН 18.00.00	Председатель методической комиссии/совета	Басевич А. В.	Согласовано	04.05.2023
3	Кафедра промышленной технологии лекарственных препаратов	Ответственный за образовательную программу	Басевич А. В.	Согласовано	04.05.2023

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	Куваева Е. В.	Согласовано	04.05.2023

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

Компетенции, индикаторы и результаты обучения

ОПК-5 Способен осуществлять экспериментальные исследования и испытания по заданной методике, проводить наблюдения и измерения с учетом требований техники безопасности, обрабатывать и интерпретировать экспериментальные данные

ОПК-5.1 Осуществляет экспериментальные исследования и испытания по заданной методике, обрабатывает и интерпретирует полученные экспериментальные данные

Знать:

ОПК-5.1/Зн10 Знать методы работы в лаборатории и анализа лекарственных субстанций

Уметь:

ОПК-5.1/Ум10 Уметь осуществлять синтез и анализ лекарственных субстанций

ОПК-5.2 Проводит наблюдения и измерения с учетом требований техники безопасности, в том числе при работе с оборудованием и химическими веществами

Знать:

ОПК-5.2/Зн13 Знать правила безопасного обращения с химическими материалами с учетом их физических свойств

Уметь:

ОПК-5.2/Ум1 Уметь осуществлять технологический процесс в соответствии с правилами техники безопасности

ОПК-1 Способен изучать, анализировать, использовать механизмы химических реакций, происходящих в технологических процессах и окружающем мире, основываясь на знаниях о строении вещества, природе химической связи и свойствах различных классов химических элементов, соединений, веществ и материалов

ОПК-1.2 Предлагает интерпретацию различных технологических процессов, основываясь на знании различных классов химических элементов, соединений, веществ и материалов

Знать:

ОПК-1.2/Зн3 Знать классы химических элементов, соединений, веществ и материалов и их свойства

Уметь:

ОПК-1.2/Ум3 Уметь выбирать условия осуществления технологического процесса синтеза лекарственной субстанции

ПК-4 Способен проводить работы по фармацевтической разработке лекарственных средств

ПК-4.1 Проводит исследования, испытания и экспериментальные работы по фармацевтической разработке в соответствии с утвержденными планами

Знать:

ПК-4.1/Зн8 Знать свойства используемых реагентов и синтезированных веществ.

ПК-4.1/Зн9 Знать основные условия и особенности процессов производства лекарственных субстанций.

Уметь:

ПК-4.1/Ум2 Уметь выбирать наиболее экономичный, безопасный и экологически обоснованный метод осуществления процесса химического синтеза лекарственных веществ

2. Место дисциплины в структуре ОП

Дисциплина (модуль) Б1.О.29 «Химическая технология лекарственных субстанций и витаминов» относится к обязательной части образовательной программы и изучается в семестре(ах): 7.

Предшествующие дисциплины (практики) по связям компетенций:

- Б1.О.11 Аналитическая химия;
- Б1.О.18 Коллоидная химия;
- Б1.О.24 Массообменные процессы и аппараты химической технологии;
- Б1.О.13 Материаловедение;
- Б1.В.10 Оборудование и основы проектирования производств фармацевтических препаратов;
- Б1.О.06 Общая и неорганическая химия;
- Б1.О.22 Общая химическая технология;
- Б1.О.17 Органическая химия;
- Б1.О.19 Процессы и аппараты химической технологии;
- Б1.О.16 Статистические методы обработки данных с использованием программного обеспечения;
- Б1.О.27 Технология готовых лекарственных средств;
- Б2.О.01(У) учебная практика (технологическая (проектно-технологическая) практика);
- Б1.О.05 Физика;
- Б1.О.23 Физико-химические методы анализа;
- Б1.О.14 Физическая химия;
- Б1.О.25 Химия биологически активных веществ;
- Б1.О.26 Химия и технология фитопрепаратов;
- Б1.О.12 Электротехника и промышленная электроника;

Последующие дисциплины (практики) по связям компетенций:

- Б1.В.ДВ.06.01 Лекарственные препараты с модифицированным высвобождением;
- Б1.О.30 Моделирование химико-технологических процессов;
- Б1.О.34 Организация производства по GMP;
- Б3.01(Д) Подготовка к защите и защита выпускной квалификационной работы;
- Б2.В.01(П) производственная практика (научно-исследовательская работа);
- Б1.О.27 Технология готовых лекарственных средств;
- Б1.В.ДВ.06.02 Технология лекарственных субстанций растительного происхождения;
- Б1.В.ДВ.06.03 Технология лечебно-косметических средств;
- Б1.О.26 Химия и технология фитопрепаратов;

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

Период обучения	Общая трудоемкость (часы)	Общая трудоемкость (ЗЕТ)	Контактная работа (часы, всего)	Консультации в период сессии (часы)	Консультации в период теоретического обучения (часы)	Лабораторные занятия (часы)	Лекции (часы)	Практические занятия (часы)	Самостоятельная работа студента (часы)	Промежуточная аттестация (часы)
Седьмой семестр	288	8	126	2	12	64	16	32	128	Экзамен (34)
Всего	288	8	126	2	12	64	16	32	128	34

4. Содержание дисциплины

4.1. Разделы, темы дисциплины и виды занятий

Наименование раздела, темы	Всего	Консультации в период сессии	Консультации в период теоретического обучения	Лабораторные занятия	Лекции	Практические занятия	Самостоятельная работа студента	Планируемые результаты обучения, соотношенные с результатами освоения программы
Раздел 1. Подходы к синтезу лекарственных субстанций и витаминов	134		4	64		12	54	ОПК-1.2
Тема 1.1. Электрофильное замещение.	51		1	36		4	10	
Тема 1.2. Нуклеофильное замещение.	29		1	8		2	18	
Тема 1.3. Радикальные реакции. Реакции конденсации.	29		1	8		2	18	
Тема 1.4. Синтез гетероциклических соединений.	25		1	12		4	8	
Раздел 2. Лекарственные субстанции и витамины – производные карбоновых и тиокарбоновых кислот	41		3		6	8	24	ОПК-1.2 ОПК-5.1 ОПК-5.2 ПК-4.1
Тема 2.1. Производные п-аминобензойной кислоты.	15		1		2	4	8	
Тема 2.2. Сложные алкаминового эфиры карбоновых кислот.	13		1		2	2	8	
Тема 2.3. Амиды карбоновых кислот.	13		1		2	2	8	
Раздел 3. Лекарственные субстанции и витамины – производные пятичленных гетероциклов	36		2		4	4	26	ОПК-1.2 ОПК-5.1 ОПК-5.2 ПК-4.1

Тема 3.1. Производные гидантоина, оксазола и ФМП.	23		1		2	2	18	
Тема 3.2. Производные сиднонимина и тиазола.	13		1		2	2	8	
Раздел 4. Лекарственные субстанции и витамины – производные шестичленных гетероциклов	26		2		4	4	16	ОПК-1.2 ОПК-5.1 ОПК-5.2 ПК-4.1
Тема 4.1. Производные барбитуровой кислоты и пиримидина.	13		1		2	2	8	
Тема 4.2. Производные фенотиазина и пурина.	13		1		2	2	8	
Раздел 5. Лекарственные субстанции и витамины – производные семичленных гетероциклов	17	2	1		2	4	8	ОПК-1.2 ОПК-5.1 ОПК-5.2 ПК-4.1
Тема 5.1. Производные 1,4-бензодиазепина.	17	2	1		2	4	8	
Итого	254	2	12	64	16	32	128	

4.2. Содержание разделов, тем дисциплин и формы текущего контроля

Раздел 1. Подходы к синтезу лекарственных субстанций и витаминов

Тема 1.1. Электрофильное замещение.

Содержание и задачи курса. Строение молекул бензола, нафталина и гетероциклических соединений (граничные структуры). Механизм электрофильного замещения; направление и скорость реакции. Заместители I и II рода: определение, свойства. Механизм ориентации в аренах; устойчивость σ -комплексов разных ароматических систем. Влияние кинетического и термодинамического факторов на направление реакции. Образование электрофильных частиц и особенности реакций сульфирования, нитрования, галогенирования, нитро-зирования, азосочетания, алкилирования, ацилирования.

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Коллоквиум
Письменный опрос

Тема 1.2. Нуклеофильное замещение.

Механизмы SN_1 , SN_2 , SN_{Ar} , $SNEA$, SN_i , $SNAE$ в ацильных соединениях, факторы, определяющие реализацию того или иного механизма, скорость и направление реакции (строения субстрата, сила нуклеофила, растворитель).

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Тема 1.3. Радикальные реакции. Реакции конденсации.

Радикальное замещение и присоединение. Электрофильное присоединение. Реакции SE в алифатических соединениях. Реакции конденсации (альдольная, кротоновая, Кляйзена и др.).

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Тема 1.4. Синтез гетероциклических соединений.

Методы циклизации пяти- и шестичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами.

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Раздел 2. Лекарственные субстанции и витамины – производные карбоновых и тиокарбоновых кислот

Тема 2.1. Производные п-аминобензойной кислоты.

Промышленное производство производных п-аминобензойной кислоты. Синтез анестезина, новокаина, дикаина, новокаиамида. Схема их получения через ХА п-НБК.

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Тема 2.2. Сложные алкаминовые эфиры карбоновых кислот.

Промышленная схема синтеза амизила. Общий подход к синтезу арпенала, апрофена, спазмолитина. Сложные тиоэфиры карбоновых кислот (тифен, дипрофен). Особенности их химического синтеза.

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Тема 2.3. Амиды карбоновых кислот.

Синтез хлоракона, пираретама. Производные карбаминовой кислоты. Синтез мепротана.

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Раздел 3. Лекарственные субстанции и витамины – производные пятичленных гетероциклов

Тема 3.1. Производные гидантоина, оксазола и ФМП.

Производные гидантоина. Синтез 5,5-дифенилгидантоина. Производные оксазола. Получение триметина. Производные 1-фенил-3-метилпиразолона-5: антипирин, анальгин (метамизол), пропифеназон.

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Тема 3.2. Производные сиднонимина и тиазола.

Производные сиднонимина. Особенности структуры. Синтез сиднокарба. Производные тиазола. Промышленное производство тиамин (витамина В1).

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Раздел 4. Лекарственные субстанции и витамины – производные шестичленных гетероциклов

Тема 4.1. Производные барбитуровой кислоты и пиримидина.

Подходы к синтезу производных барбитуровой кислоты и пиримидина. Производство барбамила, гексенала, фенобарбитала, гексамидина, бензонала.

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Тема 4.2. Производные фенотиазина и пурина.

Общие подходы к синтезу производных фенотиазина. Синтез аминазина, трифтазина, этаперазина, тиоридазина. Производные пурина. Синтез теобромин. Подходы к синтезу теофиллина, кофеина. Получение дипрофиллина.

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

Раздел 5. Лекарственные субстанции и витамины – производные семичленных гетероциклов

Тема 5.1. Производные 1,4-бензодиазепина.

Синтез 5-замещенных производных 2-аминобензофенон. Подходы к синтезу нитразепама, мезапама, сибазона. Промышленная схема производства феназепама. Комплексная промышленная схема производства нозепама и хлосепада.

Текущий контроль

Вид (форма) контроля, оценочные материалы
Письменный опрос

4.3. Содержание занятий семинарского типа.

Очная форма обучения. Консультации в период сессии (2 ч.)

Раздел 1. Подходы к синтезу лекарственных субстанций и витаминов

Тема 1.1. Электрофильное замещение.

Тема 1.2. Нуклеофильное замещение.

Тема 1.3. Радикальные реакции. Реакции конденсации.

Тема 1.4. Синтез гетероциклических соединений.

Раздел 2. Лекарственные субстанции и витамины – производные карбоновых и тиокарбоновых кислот

Тема 2.1. Производные п-аминобензойной кислоты.

Тема 2.2. Сложные алкаминозные эфиры карбоновых кислот.

Тема 2.3. Амиды карбоновых кислот.

Раздел 3. Лекарственные субстанции и витамины – производные пятичленных гетероциклов

Тема 3.1. Производные гидантоина, оксазола и ФМП.

Тема 3.2. Производные сиднонимина и тиазола.

Раздел 4. Лекарственные субстанции и витамины – производные шестичленных гетероциклов

Тема 4.1. Производные барбитуровой кислоты и пиримидина.

Тема 4.2. Производные фенотиазина и пурина.

Раздел 5. Лекарственные субстанции и витамины – производные семичленных гетероциклов (2 ч.)

Тема 5.1. Производные 1,4-бензодиазепина. (2 ч.)

Консультация по подготовке к экзамену

4.4. Содержание занятий семинарского типа.

Очная форма обучения. Консультации в период теоретического обучения (12 ч.)

Раздел 1. Подходы к синтезу лекарственных субстанций и витаминов (4 ч.)

Тема 1.1. Электрофильное замещение. (1 ч.)

Консультация по выполнению самостоятельной работы

Тема 1.2. Нуклеофильное замещение. (1 ч.)

Консультация по выполнению самостоятельной работы

Тема 1.3. Радикальные реакции. Реакции конденсации. (1 ч.)

Консультация по выполнению самостоятельной работы

Тема 1.4. Синтез гетероциклических соединений. (1 ч.)

Раздел 2. Лекарственные субстанции и витамины – производные карбоновых и тиокарбоновых кислот (3 ч.)

Тема 2.1. Производные п-аминобензойной кислоты. (1 ч.)

Консультация по выполнению самостоятельной работы

Тема 2.2. Сложные алкаминовые эфиры карбоновых кислот. (1 ч.)
Консультация по выполнению самостоятельной работы
Тема 2.3. Амиды карбоновых кислот. (1 ч.)

Раздел 3. Лекарственные субстанции и витамины – производные пятичленных гетероциклов (2 ч.)

Тема 3.1. Производные гидантоина, оксазола и ФМП. (1 ч.)
Консультация по выполнению самостоятельной работы
Тема 3.2. Производные сидномина и тиазола. (1 ч.)
Консультация по выполнению самостоятельной работы

Раздел 4. Лекарственные субстанции и витамины – производные шестичленных гетероциклов (2 ч.)

Тема 4.1. Производные барбитуровой кислоты и пиримидина. (1 ч.)

Тема 4.2. Производные фенотиазина и пурина. (1 ч.)
Консультация по выполнению самостоятельной работы

Раздел 5. Лекарственные субстанции и витамины – производные семичленных гетероциклов (1 ч.)

Тема 5.1. Производные 1,4-бензодиазепина. (1 ч.)
Консультация по выполнению самостоятельной работы

4.5. Содержание занятий семинарского типа.

Очная форма обучения. Лабораторные занятия (64 ч.)

Раздел 1. Подходы к синтезу лекарственных субстанций и витаминов (64 ч.)

Тема 1.1. Электрофильное замещение. (36 ч.)
Лабораторное занятие 1. Техника безопасности. Методы работы в лаборатории.
Лабораторное занятие 2. Коллоквиум по технике безопасности и методам работы в лаборатории.
Лабораторное занятие 3-5. Синтез ацетанилида.
Лабораторное занятие 6-7. Синтез нитрофенола.
Лабораторное занятие 8-9. Синтез фенилазосалициловой кислоты.
Тема 1.2. Нуклеофильное замещение. (8 ч.)
Лабораторное занятие 10-11. Синтез салициловой кислоты.
Тема 1.3. Радикальные реакции. Реакции конденсации. (8 ч.)
Лабораторное занятие 12-13. Синтез витамина К3
Тема 1.4. Синтез гетероциклических соединений. (12 ч.)
Лабораторное занятие 14-16. Синтез 5,5-дифенилгидантоина.

Раздел 2. Лекарственные субстанции и витамины – производные карбоновых и тиокарбоновых кислот

Тема 2.1. Производные п-аминобензойной кислоты.

Тема 2.2. Сложные алкаминовые эфиры карбоновых кислот.

Тема 2.3. Амиды карбоновых кислот.

Раздел 3. Лекарственные субстанции и витамины – производные пятичленных гетероциклов

Тема 3.1. Производные гидантоина, оксазола и ФМП.

Тема 3.2. Производные сиднонимина и тиазола.

Раздел 4. Лекарственные субстанции и витамины – производные шестичленных гетероциклов

Тема 4.1. Производные барбитуровой кислоты и пиримидина.

Тема 4.2. Производные фенотиазина и пурина.

Раздел 5. Лекарственные субстанции и витамины – производные семичленных гетероциклов

Тема 5.1. Производные 1,4-бензодиазепина.

4.6. Содержание занятий лекционного типа.

Очная форма обучения. Лекции (16 ч.)

Раздел 1. Подходы к синтезу лекарственных субстанций и витаминов

Тема 1.1. Электрофильное замещение.

Тема 1.2. Нуклеофильное замещение.

Тема 1.3. Радикальные реакции. Реакции конденсации.

Тема 1.4. Синтез гетероциклических соединений.

Раздел 2. Лекарственные субстанции и витамины – производные карбоновых и тиокарбоновых кислот (6 ч.)

Тема 2.1. Производные п-аминобензойной кислоты. (2 ч.)

Лекция 1. Содержание и задачи курса. Лекарственные субстанции – производные карбоновых и тиокарбоновых кислот. Местноанестезирующие средства — производные п-аминобензойной кислоты. Строение анестезина, новокаина, дикаина, новокаинамида. Технологические принципы организации промышленного производства производных п-аминобензойной кислоты. Промышленное производство основных представителей. Пути его совершенствования.

Тема 2.2. Сложные алкаминового эфиры карбоновых кислот. (2 ч.)

Лекция 2. Сложные алкаминового эфиры карбоновых кислот. Промышленная схема синтеза амизила, арпенала, апрофена, спазмолитина. Общий подход к синтезу сложных эфиров — препаратов данной группы. Сложные тиоэфиры карбоновых кислот (дипрофен). Особенности их химического синтеза.

Тема 2.3. Амиды карбоновых кислот. (2 ч.)

Лекция 3. Амиды карбоновых кислот. Синтез хлоракона, пираретама. Производные карбаминовой кислоты. Синтез мепротана.

Раздел 3. Лекарственные субстанции и витамины – производные пятичленных гетероциклов (4 ч.)

Тема 3.1. Производные гидантоина, оксазола и ФМП. (2 ч.)

Лекция 4. Лекарственные субстанции – производные пятичленных гетероциклов. Производные гидантоина. Синтез 5,5-дифенилгидантоина. Производные оксазола. Получение триметина. Производные 1-фенил-3-метилпиразолона-5: антипирин, анальгин (метамизол), пропифеназон. Комплексное производство производных фенилметилпиразолона, структура, основные стадии, взаимосвязь в рамках комплексного (совмещенного) производства.

Тема 3.2. Производные сиднонимина и тиазола. (2 ч.)

Лекция 5. Производные сиднонимина. Особенности структуры. Синтез сиднокарба. Производные тиазола. Промышленное производство тиамина (витамина В1).

Раздел 4. Лекарственные субстанции и витамины – производные шестичленных гетероциклов (4 ч.)

Тема 4.1. Производные барбитуровой кислоты и пиримидина. (2 ч.)

Лекция 6. Лекарственные субстанции – производные шестичленных гетероциклов. Производные барбитуровой кислоты. Связь строения и биологической активности. Подходы к синтезу барбитуратов, проблемы выбора исходного сырья и промышленной технологии. Промышленные схемы синтеза на основе диалкилмалоновых эфиров и мочевины, диалкилциануксусных эфиров и дициандиамида. Синтез барбамила, гексенала, фенобарбитала, бензонала. Принципы синтеза 2-тиобарбитуратов. Производные пиримидина. Синтез гексамидина.

Тема 4.2. Производные фенотиазина и пурина. (2 ч.)

Лекция 7. Нейролептические средства — производные фенотиазина (аминазин, этаперазин, трифтазин). Связь строения и биологического действия. Подходы к синтезу, структура производства, технологические принципы организации производства препаратов фенотиазинового ряда. Лекарственные субстанции и витамины – производные пурина, хинолина, изохинолина. Синтез теобромина. Подходы к синтезу кофеина. Получение дипрофиллина.

Раздел 5. Лекарственные субстанции и витамины – производные семичленных гетероциклов (2 ч.)

Тема 5.1. Производные 1,4-бензодиазепина. (2 ч.)

Лекция 8. Лекарственные субстанции – производные 1,4-бензодиазепина (нитразепам, мезапам, феназепам, сибазон, нозепам, хлосепид). Особенности строения, общие подходы к синтезу. Методы производства основных полупродуктов.

4.7. Содержание занятий семинарского типа.

Очная форма обучения. Практические занятия (32 ч.)

Раздел 1. Подходы к синтезу лекарственных субстанций и витаминов (12 ч.)

Тема 1.1. Электрофильное замещение. (4 ч.)

Практическое занятие 1. Строение молекул бензола, нафталина и гетероциклических соединений (граничные структуры). Механизм электрофильного замещения; направление и скорость реакции. Заместители I и II рода: определение, свойства. Механизм ориентации в аренах; устойчивость сигма-комплексов разных ароматических систем. Влияние кинетического и термодинамического факторов на направление реакции.

Практическое занятие 2. Механизм электрофильного замещения; направление и скорость реакции в гетероароматических системах. Образование электрофильных частиц и особенности реакций сульфирования, нитрования, галогенирования, нитро-зирования, азосочетания, алкилирования (галоген- и гидроксиметилирования), ацилирования (р. Гаттермана-Коха, Вильсмайера, Тимана-Реймера, Кольбе-Шмидта).

Тема 1.2. Нуклеофильное замещение. (2 ч.)

Практическое занятие 3. Нуклеофильное замещение. Механизмы SN1, SN2, SNAr, SNEA, SNi, SNAE в ацильных соединениях, факторы, определяющие реализацию того или иного механизма, скорость и направление реакции (строения субстрата, сила нуклеофила, растворитель).

Тема 1.3. Радикальные реакции. Реакции конденсации. (2 ч.)

Практическое занятие 4. Радикальное замещение и присоединение. Электрофильное присоединение. Реакции SE в алифатических соединениях. Реакции конденсации (альдольная, кротоновая, Кляйзена и др.).

Тема 1.4. Синтез гетероциклических соединений. (4 ч.)

Практическое занятие 5. Методы циклизации пятичленных гетероциклических соединений с

одним и двумя гетероатомами.

Практическое занятие 6. Методы циклизации шестичленных гетероциклических соединений с одним и двумя гетероатомами.

Раздел 2. Лекарственные субстанции и витамины – производные карбоновых и тиокарбоновых кислот (8 ч.)

Тема 2.1. Производные п-аминобензойной кислоты. (4 ч.)

Практическое занятие 7. Промышленное производство производных п-аминобензойной кислоты.

Практическое занятие 8. Синтез анестезина, новокаина, дикаина, новокаинамида. Схема их получения через ХА п-НБК.

Тема 2.2. Сложные алкаминозные эфиры карбоновых кислот. (2 ч.)

Практическое занятие 9. Промышленная схема синтеза амизила. Общий подход к синтезу арпенала, апрофена, спазмолитина. Сложные тиоэфиры карбоновых кислот (тифен, дипрофен). Особенности их химического синтеза.

Тема 2.3. Амиды карбоновых кислот. (2 ч.)

Практическое занятие 10. Амиды карбоновых кислот. Синтез хлоракона, пиратама, мепротана.

Раздел 3. Лекарственные субстанции и витамины – производные пятичленных гетероциклов (4 ч.)

Тема 3.1. Производные гидантоина, оксазола и ФМП. (2 ч.)

Практическое занятие 11. Производные пятичленных гетероциклов. Синтез 5,5-дифенилгидантоина, триметина, анальгина, пропифеназона.

Тема 3.2. Производные сидномина и тиазола. (2 ч.)

Практическое занятие 12. Синтез сиднокарба. Промышленное производство тиамин (витамина В1).

Раздел 4. Лекарственные субстанции и витамины – производные шестичленных гетероциклов (4 ч.)

Тема 4.1. Производные барбитуровой кислоты и пиримидина. (2 ч.)

Практическое занятие 13. Подходы к синтезу производных барбитуровой кислоты и пиримидина. Производство барбитала, гексенала, фенобарбитала, гексамидина, бензонала.

Тема 4.2. Производные фенотиазина и пурина. (2 ч.)

Практическое занятие 14. Общие подходы к синтезу производных фенотиазина. Синтез аминазина. Производные пурина. Синтез теобромин. Подходы к синтезу кофеина. Получение дипрофиллина.

Раздел 5. Лекарственные субстанции и витамины – производные семичленных гетероциклов (4 ч.)

Тема 5.1. Производные 1,4-бензодиазепина. (4 ч.)

Практическое занятие 15. Производные 1,4-бензодиазепина. Синтез 5-замещенных производных 2-аминобензофенона. Подходы к синтезу нитразепама, мезапама, сибазона.

Практическое занятие 16. Промышленная схема производства феназепама. Комплексная промышленная схема производства нозепама и хлосепада.

4.8. Содержание самостоятельной работы обучающихся

Очная форма обучения. Самостоятельная работа студента (128 ч.)

Раздел 1. Подходы к синтезу лекарственных субстанций и витаминов (54 ч.)

Тема 1.1. Электрофильное замещение. (10 ч.)

Тема 1.2. Нуклеофильное замещение. (18 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Подготовка к лабораторной работе 4 и защита отчета

Тема 1.3. Радикальные реакции. Реакции конденсации. (18 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Подготовка к лабораторной работе 5 и защита отчета

Тема 1.4. Синтез гетероциклических соединений. (8 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Раздел 2. Лекарственные субстанции и витамины – производные карбоновых и тиокарбоновых кислот (24 ч.)

Тема 2.1. Производные п-аминобензойной кислоты. (8 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Тема 2.2. Сложные алкаминовые эфиры карбоновых кислот. (8 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Тема 2.3. Амиды карбоновых кислот. (8 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Раздел 3. Лекарственные субстанции и витамины – производные пятичленных гетероциклов (26 ч.)

Тема 3.1. Производные гидантоина, оксазола и ФМП. (18 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Подготовка к лабораторной работе 6 и защита отчета

Тема 3.2. Производные сиднонимина и тиазола. (8 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Раздел 4. Лекарственные субстанции и витамины – производные шестичленных гетероциклов (16 ч.)

Тема 4.1. Производные барбитуровой кислоты и пиримидина. (8 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Тема 4.2. Производные фенотиазина и пурина. (8 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

Раздел 5. Лекарственные субстанции и витамины – производные семичленных гетероциклов (8 ч.)

Тема 5.1. Производные 1,4-бензодиазепина. (8 ч.)

Подготовка к текущему контролю знаний

5. Порядок проведения промежуточной аттестации

Промежуточная аттестация: Экзамен, Седьмой семестр.

Основанием для проведения промежуточной аттестации по дисциплине является выполнение учебной программы дисциплины и получение не менее 60 % баллов за каждое контрольное мероприятие.

Промежуточная аттестация проводится в виде экзамена. Экзамен проводится письменно по билетам с предварительной подготовкой в течение 40 минут. Экзаменатор вправе задавать вопросы студенту сверх билета. Экзаменационный билет включает три теоретических вопроса и одну задачу.

Порядок проведения экзамена:

1. Экзамен проводится в период экзаменационной сессии, предусмотренной календарным учебным графиком. Не допускается проведение экзамена на последних аудиторных занятиях.
2. Экзамен должен начинаться в указанное в расписании время и проводиться в отведенной для этого аудитории. Самостоятельный перенос экзаменатором времени и места проведения экзамена не допускается.
3. Преподаватель принимает экзамен только при наличии ведомости и надлежащим образом оформленной зачетной книжки.
4. Критерии оценки ответа студента на экзамене, а также форма его проведения доводятся преподавателем до сведения студентов до начала экзамена на экзаменационной консультации.
5. Результат экзамена объявляется студенту непосредственно после его сдачи, затем выставляется в экзаменационную ведомость и зачетную книжку студента. Положительные

оценки заносятся в экзаменационную ведомость и зачетную книжку, неудовлетворительная оценка проставляется только в экзаменационной ведомости. В случае неявки студента для сдачи экзамена в ведомости вместо оценки делается запись «не явился».

Уровень качества ответа студента на экзамене определяется с использованием оценок «неудовлетворительно», «удовлетворительно», «хорошо», «отлично». Если по итогам проведенной промежуточной аттестации результаты обучающегося не соответствуют критерию сформированности компетенции, обучающемуся выставляется оценка «неудовлетворительно». Оценка «удовлетворительно», «хорошо» или «отлично» означает успешное прохождение промежуточной аттестации.

Уровень качества ответа студента на экзамене определяется по следующим критериям.

1. Оценка «отлично» предполагает:

- полные ответы на три теоретических вопроса билета и правильное решение задачи.

2. Оценка «хорошо» предполагает:

- полные ответы на два теоретических вопроса билета и правильное решение задачи;
- неполные ответы на все вопросы билета.

3. Оценка «удовлетворительно» предполагает:

- полные ответы на два теоретических вопроса билета;
- полный ответ на один теоретический вопрос билета и правильное решение задачи;
- неполные ответы на три вопроса билета.

4. Оценка «неудовлетворительно» предполагает следующие характеристики ответа студента:

- полный ответ только на один вопрос экзаменационного билета;
- неполные ответы на два вопроса экзаменационного билета.

Оценка «удовлетворительно», «хорошо» или «отлично» означает успешное прохождение промежуточной аттестации.

Если по итогам проведенной промежуточной аттестации, результаты обучающегося не соответствуют критерию сформированности компетенции, обучающемуся выставляется оценка «не удовлетворительно».

6. Материально-техническое и учебно-методическое обеспечение дисциплины

6.1. Перечень основной и дополнительной учебной литературы

Основная 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, 2012. - 222, [1] с.

Дополнительная 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. Вартамян Р.С. Синтез основных лекарственных средств [Электронный ресурс]: - М.: Мед. информ. агентство, 2004. - 844 с.

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

Профессиональные базы данных

1. eLibrary.ru - Портал научных публикаций

2. <http://grls.rosminzdrav.ru> - Реестр лекарственных средств, зарегистрированных в Российской Федерации

Ресурсы «Интернет»

Не используются.

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

"Водонагреватель ""Термекс"" RZB-30L" - 1 шт.

Привод лабораторный ЭР-0270 - 1 шт.

Фильтр ФМ-02 - 1 шт.

Шпатель двусторонний металлический L=180 mm - 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=1440>

Консультирование: <http://edu.spcpu.ru/course/view.php?id=1440>

Контроль: <http://edu.spcpu.ru/course/view.php?id=1440>

Размещение учебных материалов: <http://edu.spcpu.ru/course/view.php?id=1440>

Учебно-методическое обеспечение:

Щенникова О.Б. Химическая технология лекарственных субстанций и витаминов : электронный учебно-методический комплекс / О.Б. Щенникова; ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России. – Санкт-Петербург, 2018. – Текст электронный // ЭИОС СПХФУ : [сайт]. – URL: <http://edu.spcpu.ru/course/view.php?id=1440>. — Режим доступа: для авторизованных пользователей.

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.

Лекции

Лекции предназначены для сообщения обучающимся необходимого для изучения дисциплины объема теоретического материала. В рамках лекций преподавателем могут реализовываться следующие интерактивные образовательные технологии: дискуссия, лекция с ошибками, видеоконференция, вебинар.

Лабораторные занятия

Текущий контроль знаний осуществляется на лабораторных 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.

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:

Коллоквиума

Краткая характеристика оценочного средства: представляет собой средство контроля усвоения учебного материала темы, раздела или разделов дисциплины, организованное как учебное занятие в виде собеседования преподавателя с обучающимися.

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