

Федеральное государственное
бюджетное образовательное
учреждение
высшего образования
«Московский государственный университет имени М.В. Ломоносова»
Химический факультет

УТВЕРЖДАЮ

И.о. декана химического факультета,
Чл.-корр. РАН, профессор



/С.Н. Калмыков/

«20» мая 2019 г.

РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)

Химия гетероциклических соединений

Уровень высшего образования:
Специалитет

Направление подготовки (специальность):
04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия

Направленность (профиль) ОПОП:
Органическая химия

Форма обучения:
очная

Рабочая программа рассмотрена и одобрена
Учебно-методической комиссией факультета
(протокол №3 от 13.05.2019)

Москва 2019

Рабочая программа дисциплины разработана в соответствии с самостоятельно установленным МГУ образовательным стандартом (ОС МГУ) для реализуемых основных профессиональных образовательных программ высшего образования по направлению подготовки / специальности 04.05.01 «Фундаментальная и прикладная химия» (программа специалитета), утвержденного приказом МГУ от 29 декабря 2018 года № 1770 (с изменениями по приказу № 1109 от 11.09.2019).

Год (годы) приема на обучение 2019/2020

1. Место дисциплины (модуля) в структуре ООП: вариативная часть ООП, блок ПД.

2. Планируемые результаты обучения по дисциплине, соотнесенные с планируемыми результатами освоения образовательной программы (компетенциями выпускников). Соответствие результатов обучения по данному элементу ОПОП результатам освоения ОПОП (в форме компетенция – индикатор - ЗУВ) указано в Общей характеристике ОПОП.

Компетенция	Индикатор достижения	Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю)
<p>ОПК-1.С. Способен решать современные проблемы фундаментальной и прикладной химии, используя методологию научного подхода и систему фундаментальных химических понятий и законов</p>	<p>ОПК-1.С.1. Воспринимает информацию химического содержания, систематизирует и анализирует ее, оценивает актуальность и степень новизны данных</p>	<p>Уметь анализировать научную литературу с целью выбора направления и методов, применяемых в исследовании по теме выпускной квалификационной работы, Уметь: самостоятельно составлять план исследования Владеть: навыками поиска, критического анализа, обобщения и систематизации научной информации, постановки целей исследования и выбора оптимальных путей и методов их достижения</p>
<p>СПК-1.С. Способен использовать физические основы радиационной химии для общей характеристики радиационно-химических процессов при действии различных видов ионизирующих излучений</p>	<p>СПК-1.С.1 Предлагает возможные механизмы реакций с участием органических гетероциклических соединений</p>	<p>знать: фундаментальные понятия органической химии; уметь: выбрать наиболее рациональные реагенты для осуществления заданных превращений органических соединений.</p>
<p>СПК-2.С Способен определять стратегию проведения реакции и ее результат (состав продуктов и их стереохимию, возможность катализа, оптимизацию растворителя и т.п.) на основе теоретических знаний в области</p>	<p>СПК-2.С.2 Оценивает влияние различных факторов на выход целевого продукта органического синтеза, оптимизирует условия синтеза с учетом методов построения гетероциклических соединений</p>	<p>знать: основные типы органических реакций и механизмы их протекания; знать: общие закономерности, приёмы и методы построения гетероциклических соединений различных классов, специфику их химических свойств; уметь: анализировать современную научную литературу по профильной тематике;</p>

органической химии		владеть: знаниями по идентификации органических соединений
СПК-3.С. Способен самостоятельно оптимизировать условия проведения конкретной реакции исходя из базовых теоретических представлений о механизме реакции и факторах, определяющих реакционную способность	СПК-3.С(итог) оптимизирует условия проведения конкретной гетероциклической реакции исходя из основных представлений о механизме реакции и факторах, определяющих реакционную способность органических соединений	знать: теоретические основы и возможности для практического использования синтетических методов в химии гетероциклических соединений уметь: самостоятельно оптимизировать условия проведения конкретной реакции исходя из базовых теоретических представлений о механизме реакции и факторах, определяющих реакционную способность. владеть: Методическими приемами, позволяющими планировать заданные превращения с учетом доступности реагентов, а также эффективности и специфики протекающих реакций.
СПК-4.С. Способен использовать современные физико-химические методы анализа для интерпретации результатов органического синтеза	СПК-4.С.1 выбирает современные физико-химические методы анализа органических веществ, адекватные поставленной задаче получения конкретных гетероциклических соединений	знать: основные реагенты, используемые в органическом синтезе, и области применения этих реагентов. уметь: составлять план химического синтеза, и оценивать его реальную осуществимость. владеть: синтетическими методами на основе ретросинтетического анализа
СПК-5.С. Владеет навыками интерпретации результатов эксперимента и теоретических расчетов, применение их при решении практических задач в области органической химии	СПК-5.С.1 предлагает несколько возможных вариантов, объясняющих полученные данные в ходе эксперимента, аргументирует собственный выбор	знать: синтетические методы органической химии, позволяющие реализовать спланированный синтез. уметь: способность использовать теоретические знания для решения конкретных задач, возникающих в ходе исследования; Владеть: методами идентификации органических соединений,

3. Объем дисциплины 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 76 часов составляет контактная работа студента с преподавателем (36 часов занятия лекционного типа, 36 часов- занятия семинарского типа, 4 часа – промежуточный контроль успеваемости), 32 часа составляет самостоятельная работа студента.

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

Обучающийся должен:

знать: области применения, достоинства и недостатки различных методов синтеза гетероциклических соединений

уметь: обсуждать результаты проведенного исследования; ориентироваться в современной литературе по теории и методам синтеза гетероциклических соединений и их применению в различных областях органической, биологической и медицинской химии

владеть: основными химическими теориями, концепциями, законами, описывающими физико-химические явления, применять основные законы химии при обсуждении полученных результатов, в том числе с привлечением информационных баз данных.

5. Содержание дисциплины (модуля), структурированное по темам.

Наименование и краткое содержание разделов и тем дисциплины (модуля), форма промежуточной аттестации по дисциплине	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 и т.п.	Всего
Раздел 1. Методы синтеза и химические свойства пятичленных гетероциклических соединений с одним гетероатомом (фураны, пирролы, тиофены)	16	8	8				16			
Раздел 2. Методы синтеза и химические свойства конденсированных пятичленных гетероциклических соединений с одним гетероатомом (индолы, бензофураны, бензотиофены)	12	6	6				12			
Раздел 3. Методы синтеза и химические свойства 1,2- и 1,3-азолов	8	4	4				8			
Раздел 4. Методы синтеза шестичленных гетероциклических	20	10	10				20			

соединений с одним гетероатомом (пиридины, хинолины, Изохинолины)										
Раздел 5. Методы синтеза и химические свойства пиримидинов и пуринов	16	8	8				16			
Итоговая аттестация <i>экзамен</i>	36					4	4			32
Итого	108	36	36			4	76			32

6. Образовательные технологии:

- применение компьютерных симуляторов, обработка данных на компьютерах, использование компьютерных программ, управляющих приборами;
- использование средств дистанционного сопровождения учебного процесса;
- преподавание дисциплин в форме авторских курсов по программам, составленным на основе результатов исследований научных школ МГУ.

7. Учебно-методические материалы для самостоятельной работы по дисциплине (модулю):

Конспект лекций.

8. Ресурсное обеспечение:

Перечень основной и вспомогательной учебной литературы ко всему курсу

Основная литература:

1. М.А. Юровская, Химия ароматических гетероциклических соединений, М.: Изд. «Бином. Лаборатория знаний», 2015, 208 стр.
2. М.А. Юровская, А.В. Куркин, А.В. Карчава, Сборник задач по синтезу гетероциклических соединений субстанций лекарственных препаратов, М.: Изд. «ЧеРо», 2009

Дополнительная литература

1. Дж. Джоуль, К. Миллс, Химия гетероциклических соединений, М.: Мир, 2004.
2. Общая органическая химия, под ред. Акад. Н.К. Кочеткова, М.: Химия, т. 8, 1985.
3. Общая органическая химия, под ред. Акад. Н.К. Кочеткова, М.: Химия, т. 9, 1985.

Перечень информационных технологий, используемых при осуществлении образовательного процесса, включая программное обеспечение, информационные базы данных, использование средств дистанционного сопровождения учебного процесса, преподавание дисциплин в форме авторских курсов по программам, составленным на основе результатов исследований научных школ МГУ

- Материально-техническое обеспечение: специальных требований нет, занятия проводятся в обычной аудитории, оснащенной доской и мелом (маркерами)

9. Язык преподавания – русский

10. Преподаватели: Юровская Марина Абрамовна в.н.с., д.х.н., профессор

Фонды оценочных средств, необходимые для оценки результатов обучения

Образцы оценочных средств для текущего контроля усвоения материала и промежуточной аттестации - экзамена. На экзамене проверяется достижение промежуточных индикаторов компетенций, перечисленных в п.2.

Вопросы экзамену

1. Химические свойства пятичленных гетероциклов с одним гетероатомом – реакции электрофильного замещения в ряду пиррола, фурана и тиофена
2. Синтезы пятичленных гетероциклов с образованием связи $C_{(3)}-C_{(4)}$ (двухкомпонентный синтез пирролов из фрагментов $C_{(3)}-C_{(2)}-N$ и $C_{(4)}-C_{(5)}$ [синтез Кнорра], взаимодействие α -хлоркарбонильных и 1,3-дикарбонильных соединений [синтез пирролов по Ганчу и фуранов по Фейсту-Бенари], синтез пирролов из кетоксимов и ацетиленов [реакция Трофимова], мультикомпонентный синтез аминотиофенов по Гевальду).
3. Сравнение химических свойств пиррола и пиридина
4. Особенности химических свойств фуранов
5. Сравнение химических свойств фурана, тиофена и пиррола.

6. Особенности химических свойств фурана.
7. Методы синтеза индолов с образованием связи C₍₃₎-C_(3a) (синтез оксиндолов из гидразидов кислот под действием оксида кальция [синтез Бруннера], синтез индолов конденсацией *n*-бензохинонов с β-аминокротонатами [синтез Неницеску], синтез индолов кислотнокатализируемая циклизация α-(ариламино)кетонов [синтез Бишлера]).
8. Реакции электрофильного замещения в индоле.
9. Синтезы индолов с одновременным образованием бензольного и пиррольного колец – трансформация солей 3-нитропиридиния под действием N-алкилкетиминов: механизм и синтетические возможности.
10. Методы синтеза индолов с электрофильными заместителями в бензольном кольце
11. Химические свойства индолов – NH-кислотность индола и реакции металлизированных производных, реакции с электрофилами, окисление и восстановление.
12. Синтезы индолов с образованием связи C-N (синтез Рейсера – восстановительная конденсация *o*-нитрофенилпировиноградной кислоты и ее производных, восстановительная конденсация производных нитростиролов, циклизация алкиниланилинов, *o*-аминобензилкетонов [методы получения исходных кетонов]).
13. Химические свойства индолов – NH-кислотность индола и реакции металлизированных производных, реакции с электрофилами, окисление и восстановление.
14. Синтезы индолов с образованием связи C₍₂₎-C₍₃₎ (внутримолекулярная циклизация *o*-алкилациланилинов [синтез Маделунга], модификации метода – литиирование, использование *o*-ациламинобензилфосфониевых солей, викариозного нуклеофильного замещения)
15. Методы синтеза индолов с образованием связи C₍₃₎-C_(3a) (синтез Фишера – циклизация арилгидразинов под действием кислых агентов, синтез триптамина по Грандбергу, реакция Коста – синтез 2-аминоиндолов циклизацией арилгидразидов кислот).
16. Синтезы производных индола на основе грамина 3-(диметиламинометил)индола
17. Методы синтеза изоиндолов: получение из *o*-ароилбензиламинов, из *o*-хлорметилбензонитрила, восстановительной циклизацией *o*-фталодинитрила, внутримолекулярной ариновой циклизацией замещенных *o*-галогенбензиламинов.
18. Химические свойства 1,2-азолов (реакции с электрофилами, фотоперегруппировка пиразолов, раскрытие связи C-O в изоксазолах, перегруппировка Боултона-Катрицкого).
19. Синтезы 1,2-азолов (из 1,3-дикарбонильных соединений, региохимия процессов, использование 1,3-диполярного циклоприсоединения, рециклизация других гетероциклов).
20. Химические свойства имидазола – реакции с алкилирующими и ацилирующими агентами; использование N-ацилимидазолов в качестве ацилирующих агентов, катализ имидазолами эфиров и других ацильных производных. Особенности реакций с электрофилами по атомам углерода.

21. Химические свойства имидазолов – депротонирование положения 2 в катионах имидазолия и реакции образующихся илидов с электрофильными агентами, реакции нуклеофильного замещения в производных имидазола, раскрытие имидазольного цикла.
22. Механизм динитрильной конденсации и применение ее для синтеза пяти- и шестичленных ароматических гетероциклов.
23. Методы синтеза 1,3-азолов. Синтезы из углеродного фрагмента $C_{(4)}-C_{(5)}$ и фрагмента X-C-N: синтез оксазолов из гидроксикарбонильных соединений и формамида; синтез триазолов из α -галогенкарбонильных соединений и тиоамидов или тиомочевин. Синтезы имидазолов из фрагментов $C_{(4)}-C_{(5)}-N_{(1)}$ и $C_{(2)}-N$: синтез из хлораля, аммиака и формамида; конденсацией α -аминокарбонильных соединений с тиоцианат-анионом. Динитрильная конденсация в синтезе имидазолов.
24. Методы синтеза 1,3-азолов (из углеродного фрагмента $C_{(4)}-C_{(5)}$ и фрагмента X-C-N, из фрагментов $C_{(4)}-C_{(5)}-N$ и $C_{(2)}-N$, использование динитрильной конденсации).
25. Химические свойства пиридонов – реакции с электрофилами по атому азота (основность пиридина, протонирование, образование четвертичных солей, реакции с кислотами Льюиса)
26. Использование диенового синтеза с прямыми и обратными электронными требованиями в формировании пиридинового ядра (реакция Дильса-Альдера 1-азабутадиенов с электронодефицитными диенофилами, реакции 1-азадиенов с электроноизбыточными диенофилами [использование азадиеновой системы 5-нитропиримидина], использование азадиеновых систем различных гетероциклов: 1,2,4-триазина, 1,3-оксазинона, 2-(1H)-пиразинов, оксазола)
27. Синтезы пиридинов с образованием связи $C_{(3)}-C_{(4)}$ (синтез из 1,3-дикарбонильных и β -енаминокарбонильных соединений, синтез пиридонов-2 из β -дикарбонильных соединений и цианацетамида [синтез Гуареши], трансформация 5-нитропиримидина под действием нитрилов, использование реакции Дильса-Альдера).
28. Синтезы пиридинов с образованием связи $C_{(3)}-C_{(4)}$ (синтез из 1,3-дикарбонильных и β -енаминокарбонильных соединений, синтез пиридонов-2 из β -дикарбонильных соединений и цианацетамида [синтез Гуареши], трансформация 5-нитропиримидина под действием нитрилов, использование реакции Дильса-Альдера).
29. Химические свойства пиридина (реакции нуклеофильного замещения, окисление и восстановление, нуклеофильные трансформации пиридинового ядра – реакция Коста-Сагитуллина).
30. Синтезы витамина B₆ – пиридоксина. Синтез пиридинового ядра по Ганчу (трехкомпонентный синтез из альдегидов, 1,3-дикарбонильных соединений и аммиака или аминов). Методы ароматизации 1,4-дигидропиридинов.
31. Понятие об ANRORC-механизме, его использование в химии гетероциклических соединений.
32. Сравнение химических свойств пиррола и пиридина
33. Реакции нуклеофильного замещения в пиридиновом ряду.
34. Получение и химические свойства N-оксида пиридина
35. Электрофильные реакции по атомам азота и углерода в ряду хинолинов и изохинолинов.

36. Синтезы хинолинов с образованием связи C₍₃₎-C₍₄₎ (получение из *o*-ациланилинов и карбонильных соединений [синтез Фридлиндера], синтез хинолин-4-карбоновых кислот на основе изатина [синтез Пфитцингера], конденсация *o*-нитроарилбензилсульфонов с эфирами малеиновой и фумаровой кислот, синтез исходных сульфонов по реакции викариозного нуклеофильного замещения).
37. Синтезы изохинолинов с образованием связи C₍₁₎-C_(1a) (взаимодействие ативированных фенилэтиламинов с формальдегидом [синтез Пикте-Шпенглера], циклизация ацилированных фенилэтиламинов, циклизация нитрильных солей).
38. Синтезы хинолинов с образованием связи C₍₃₎-C₍₄₎ (конденсация ариламинов с α,β -непредельными карбонильными соединениями [синтезы Скраупа и Дебнера-Миллера], с 1,3-дикарбонильными соединениями [реакция Комба], с β -кетозэфирами [синтез Конрада-Лимпах-Кнорра]).
39. Химические свойства хинолинов и изохинолинов – нуклеофильное присоединение, окислительное расщепление циклической системы, N-оксиды.
40. Реакции нуклеофильного замещения в ряду хинолина и изохинолина.
41. Реакции электрофильного замещения в ряду хинолинов и изохинолинов.
42. Химические свойства пиримидинов – нуклеофильное замещение уходящих групп, реакции замещения, идущие по ANRORC-механизму
43. Химические свойства пуринов – методы получения хлорпроизводных и нуклеофильное замещение атомов хлора, перегруппировка Димрота (реакции по пиримидиновому ядру).
44. Синтезы пуринов на основе имидазола: циклизация 5-аминоимидазол-4-карбоксамидов с муравьиной кислотой, производными карбодиимида, взаимодействие 5-аминоимидазол-4-карбонитрила с тиоимидами, циклизация 5-аминоимидазол-4-карбоксамидов с имидоилхлоридом угольной кислоты
45. Химические свойства пиримидина и его производных: основные свойства, реакции электрофильного замещения в молекуле урацила, нуклеофильное замещение, реакции, идущие по ANRORC-механизму.
46. Синтезы пуринов на основе пиримидина: взаимодействие 4,5-диаминопиримидина с уксусным ангидридом [синтез Траубе], циклизация 2,5,6-аминопиримидин-2-она под действием муравьиной кислоты, циклизация диаминопиримидин-2,4-диона с мочевиной, взаимодействие диаминопиримидин-2-она с сероуглеродом.

Методические материалы для проведения процедур оценивания результатов обучения

Шкала оценивания знаний, умений и навыков является единой для всех дисциплин (приведена в таблице ниже)

ШКАЛА И КРИТЕРИИ ОЦЕНИВАНИЯ РЕЗУЛЬТАТА ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)				
Оценка \ Результат	2	3	4	5
Знания	Отсутствие знаний	Фрагментарные знания	Общие, но не структурированные знания	Сформированные систематические знания
Умения	Отсутствие умений	В целом успешное, но не систематическое умение	В целом успешное, но содержащее отдельные пробелы умение (допускает неточности не принципиального характера)	Успешное и систематическое умение
Навыки (владения)	Отсутствие навыков	Наличие отдельных навыков	В целом, сформированные навыки, но не в активной форме	Сформированные навыки, применяемые при решении задач

РЕЗУЛЬТАТ ОБУЧЕНИЯ по дисциплине (модулю)	ФОРМА ОЦЕНИВАНИЯ
<p>знать: фундаментальные понятия органической химии;</p> <p>знать: основные типы органических реакций и механизмы их протекания;</p> <p>знать: общие закономерности, приёмы и методы построения гетероциклических соединений различных классов, специфику их химических свойств;</p> <p>знать: основные реагенты, используемые в органическом синтезе, и области применения этих реагентов.</p> <p>знать: теоретические основы и возможности для практического использования синтетических методов в химии гетероциклических соединений</p> <p>знать: синтетические методы органической химии, позволяющие реализовать спланированный синтез</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>
<p>Уметь анализировать научную литературу с целью выбора направления и методов, применяемых в исследовании по теме выпускной квалификационной работы,</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на</p>

<p>Уметь: самостоятельно составлять план исследования</p> <p>уметь: выбрать наиболее рациональные реагенты для осуществления заданных превращений органических соединений.</p> <p>уметь: анализировать современную научную литературу по профильной тематике;</p> <p>уметь: составлять план химического синтеза, и оценивать его реальную осуществимость.</p> <p>уметь: самостоятельно оптимизировать условия проведения конкретной реакции исходя из базовых теоретических представлений о механизме реакции и факторах, определяющих реакционную способность.</p> <p>уметь: способность использовать теоретические знания для решения конкретных задач, возникающих в ходе исследования;</p>	<p>экзамене</p>
<p>Владеть: навыками поиска, критического анализа, обобщения и систематизации научной информации, постановки целей исследования и выбора оптимальных путей и методов их достижения</p> <p>Владеть: знаниями по идентификации органических соединений</p> <p>Владеть: синтетическими методами на основе ретросинтетического анализа</p> <p>Владеть: Методическими приемами, позволяющими планировать заданные превращения с учетом доступности реагентов, а также эффективности и специфики протекающих реакций.</p> <p>Владеть: методами идентификации органических соединений,</p>	<p>мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на экзамене</p>