

Документ подписан простой электронной подписью
Информация о владельце:
ФИО: Смирнов Сергей Николаевич
Должность: врио ректора
Дата подписания: 23.05.2024 09:40:33
Уникальный программный ключ:
69e375c64f7e975d4e8830e7b4fcc2ad1bf35f08

**МИНИСТЕРСТВО НАУКИ И ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ**
ФГБОУ ВО «ТВЕРСКОЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ»

Утверждаю:

Руководитель ООП

Феофанова М.А.

24 апреля 2024 г.



Рабочая программа дисциплины

**Методы синтеза органических соединений и
биологически активных соединений**

Закреплена за кафедрой: **Органической химии**

Направление подготовки: **04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия**

Направленность (профиль): **Экспертная и медицинская химия: теория и практика.**

Квалификация: **Химик. Преподаватель химии**

Форма обучения: **очная**

Семестр: **8**

Программу составил(и):
канд. хим. наук, доц., Темникова Светлана Анатольевна

Тверь, 2024

1. ЦЕЛИ И ЗАДАЧИ ДИСЦИПЛИНЫ

Цели освоения дисциплины (модуля):

Формирование у студентов компетенций, позволяющих разрабатывать схему синтеза и осуществлять синтез органических соединений, выделять и идентифицировать продукты.

Задачи:

- изучение основных приёмов планирования синтеза;
- освоение техники эксперимента, методов выделения, очистки и идентификации целевого соединения;
- развитие практических навыков планирования и осуществления синтеза органических соединений;
- формирование у студентов основ профессионального мышления и безопасной работы при синтезе и анализе органических соединений.

2. МЕСТО ДИСЦИПЛИНЫ В СТРУКТУРЕ ООП

Цикл (раздел) ОП: Б1.В

Требования к предварительной подготовке обучающегося:

Органическая химия

Методика научного исследования

Эксперимент и экспертиза в органической химии

Дисциплины (модули) и практики, для которых освоение данной дисциплины (модуля) необходимо как предшествующее:

Преддипломная практика

3. ОБЪЕМ ДИСЦИПЛИНЫ

Общая трудоемкость	4 ЗЕТ
Часов по учебному плану	144
в том числе:	
аудиторные занятия	55
самостоятельная работа	22
часов на контроль	27

4. ПЛАНИРУЕМЫЕ РЕЗУЛЬТАТЫ ОБУЧЕНИЯ ПО ДИСЦИПЛИНЕ, СООТНЕСЕННЫЕ С ПЛАНИРУЕМЫМИ РЕЗУЛЬТАТАМИ ОСВОЕНИЯ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЙ ПРОГРАММЫ

ПК-1.1: Планирует отдельные стадии исследования при наличии общего плана НИР

ПК-1.2: Выбирает технические средства и методы испытаний (из набора имеющихся) для решения поставленных задач НИР

ПК-1.3: Готовит объекты исследования

ПК-2.1: Проводит первичный поиск информации по заданной тематике (в т.ч., с использованием патентных баз данных)

ПК-2.2: Анализирует и обобщает результаты патентного поиска по тематике проекта в выбранной области химии (химической техно-логии)

5. ВИДЫ КОНТРОЛЯ

Виды контроля в семестрах:	
экзамены	8

6. ЯЗЫК ПРЕПОДАВАНИЯ

Язык преподавания: русский.

7. СТРУКТУРА И СОДЕРЖАНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)

Код занят.	Наименование разделов и тем	Вид занятия	Семестр / Курс	Часов	Источники	Примечание
	Раздел 1. Тема 1. Современное состояние и перспективы развития органического синтеза. Принципы и проблемы органического синтеза. Основные тенденции развития органического синтеза. Практическая направленность и фундаментальное значение. Методология органического синтеза. Стратегия синтеза. Роль планирования в синтезе. Варианты стратегии. Линейный и конвергентный подходы. Органические реакции и синтетические методы. Оптимизация классических и разработка новых синтетических методов. Ретросинтетический анализ.					
1.1		Лек	8	4		
	Раздел 2. Тема 2. Методы современного органического синтеза. Органическая реакция и синтетический метод Способы образования новой С–С связи. Сокращение углеродной цепи. Реакции циклизации и раскрытия циклов. Перегруппировки. Введение и обмен функциональных групп.					
2.1		Лек	8	8		
2.2		Ср	8	4		

	Раздел 3. Тема 3. Методология эксперимента. Планирование, подготовка и проведение эксперимента. Качество реагентов и растворителей. Стандартное оборудование. Ведение лабораторного журнала. Методы выделения и очистки органических веществ. Определение важнейших констант органических соединений. Правила безопасной работы в химической лаборатории органического синтеза.					
3.1		Лаб	8	10		
3.2		Ср	8	8		
	Раздел 4. Тема 4. Выполнение синтетических работ по основным направлениям органического синтеза. Нуклеофильное замещение в алифатическом ряду. Реакции ацилирования. Электрофильное замещение в ароматическом ряду. Реакции diazotирования и азосочетания. Синтезы с помощью реактива Гриньяра.					
4.1		Лаб	8	23		
4.2		Лек	8	10		
4.3		Ср	8	10		
4.4		Экзамен	8	27		

8. ОЦЕНОЧНЫЕ МАТЕРИАЛЫ ДЛЯ ПРОВЕДЕНИЯ ТЕКУЩЕЙ И ПРОМЕЖУТОЧНОЙ АТТЕСТАЦИИ

8.1. Оценочные материалы для проведения текущей аттестации

Оценочные материалы для проведения текущей аттестации приведены в Приложении 2

8.2. Оценочные материалы для проведения промежуточной аттестации

Оценочные материалы для проведения промежуточной аттестации приведены в Приложении 2

8.3. Требования к рейтинг-контролю

9. УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ И ИНФОРМАЦИОННОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)

9.1. Рекомендуемая литература

9.3.1 Перечень программного обеспечения

1	Kaspersky Endpoint Security 10 для Windows
2	Adobe Acrobat Reader
3	Google Chrome
4	WinDjView
5	OpenOffice

9.3.2 Современные профессиональные базы данных и информационные справочные системы

1	ЭБС «ZNANIUM.COM»
2	ЭБС «ЮРАИТ»
3	ЭБС «Лань»
4	ЭБС BOOK.ru
5	ЭБС ТвГУ
6	Репозиторий ТвГУ
7	ЭБС IPRbooks

10. МАТЕРИАЛЬНО-ТЕХНИЧЕСКОЕ ОБЕСПЕЧЕНИЕ ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)

Аудит-я	Оборудование
3-407а	комплект учебной мебели, переносной ноутбук, проектор, весы, холодильник, шкафы, рефрактометр, горелка, мойка, плитки электрические, столы, сушилка

11. МЕТОДИЧЕСКИЕ МАТЕРИАЛЫ ДЛЯ ОБУЧАЮЩИХСЯ ПО ОСВОЕНИЮ ДИСЦИПЛИНЫ

Методические указания и материалы приведены в Приложении 1

Методические материалы для обучающихся по освоению дисциплины**Учебная программа дисциплины****Тема 1. Современное состояние и перспективы развития органического синтеза.**

Принципы и проблемы органического синтеза. Основные тенденции развития органического синтеза. Практическая направленность и фундаментальное значение. Методология органического синтеза. Стратегия синтеза. Роль планирования в синтезе. Варианты стратегии. Линейный и конвергентный подходы. Органические реакции и синтетические методы. Оптимизация классических и разработка новых синтетических методов. Ретросинтетический анализ. Примеры синтезов сложных органических соединений.

Тема 2. Методы современного органического синтеза.

Органическая реакция и синтетический метод. Образование C–C связи: ключевая тактическая проблема органического синтеза. Способы образования новой C–C связи. Металлоорганический синтез: реакции Вюрца-Шорыгина и Вюрца-Фиттига, натрийацетиленовый синтез, реакция Ульмана, реакция Реформатского, магний- и литийорганический синтез. Реакции конденсации: реакции Фаворского, Реппе, Фриделя-Крафтса, реакция хлорметилирования, альдольная и кротоновая конденсация, конденсация Кляйзена-Шмидта, оксинитрильный синтез, реакция Арндта-Эйстера-Вольфа.

Сокращение углеродной цепи. Декарбоксилирование, декарбонилирование, синтезы с участием гидроксилamina, отщепление метана, окисление, галоформные реакции, перегруппировка Гофмана, расщепление производных ацетоуксусного эфира, крекинг.

Реакции циклизации и раскрытия циклов. Циклизация без изменения количества атомов углерода: реакция Дикмана, внутримолекулярная реакция Вюрца, декарбоксилирование солей двухосновных кислот. Реакции циклоприсоединения с удлинением цепи: внутримолекулярные циклизации - реакция Фриделя-Крафтса, реакция Бишлера-Напиральского, синтез Скраупа, синтез индолов. Межмолекулярная конденсация: реакции с участием диаминов и гликолей. Реакции циклоприсоединения. Раскрытие циклов.

Перегруппировки. Перегруппировки с сохранением углеродного скелета: аллильная перегруппировка, перемещение тройной связи и функциональной группы, реакция Вильгеродта, перегруппировка Фаворского. Перегруппировки с построением углеродного скелета: перегруппировки Фриса и Кляйзена, бензидиновая перегруппировка. Перегруппировки с расщеплением углеродного скелета: гофмановское расщепление амидов кислот, перегруппировка Бекмана, реакция Шмидта. Перегруппировки с перестройкой углеродного скелета: перегруппировка Вагнера-Меервейна, пинаколиновая перегруппировка, ретропинаколиновая перегруппировка, изомеризация углеводородов.

Введение и обмен функциональных групп. Введение двойной и тройной углерод-углеродной связей, введение атомов галогена, введение гидроксильной, карбонильной, карбоксильной, сложноэфирной и нитрильной групп, синтез галогенангидридов и ангидридов карбоновых кислот, введение нитрогруппы, аминогруппы, сульфогруппы.

Тема 3. Методология эксперимента.

Планирование, подготовка и проведение эксперимента. Качество реагентов и растворителей. Стандартное оборудование. Ведение лабораторного журнала.

Методы выделения и очистки органических веществ. Приборы для экстрагирования. Способы перегонки. Перегонка при атмосферном давлении. Перегонка с водяным паром, перегонка в вакууме. Очистка твердых веществ перекристаллизацией из воды и органических растворителей. Возгонка (сублимация). Определение важнейших констант органических соединений: температура кипения, температура плавления, плотность, показатель преломления.

Правила безопасной работы в химической лаборатории органического синтеза. Первая помощь при ожогах, отравлениях, порезах стеклом. Тушение местных загораний и горящей одежды.

Тема 4. Выполнение синтетических работ по основным направлениям органического синтеза.

Нуклеофильное замещение в алифатическом ряду. Общая характеристика методов введения галогена в алифатическую цепь. Обзор методов ацилирования. Механизмы реакций. Синтез галоидных алкилов и алкилацетатов. Обзор методик, планирование эксперимента, синтез и выделение целевого продукта из реакционной смеси, побочные реакции, спектральная характеристика.

Электрофильное замещение в ароматическом ряду. Общая характеристика методов нитрования и галогенирования ароматических соединений. Механизмы реакций. Синтез *n*-нитроацетанилида и *n*-йоданилина. Обзор методик, планирование эксперимента, синтез и выделение целевого продукта из реакционной смеси, побочные реакции, спектральная характеристика. Альтернативные синтезы: нитробезол, *o*- и *n*-нитрофенолы, *n*-нитроанилин, *m*-нитробензойная кислота.

Общая характеристика методов диазотирования и азосочетания. Механизмы реакций. Синтез йодбензола и метилоранжа. Обзор методик, планирование эксперимента, синтез и выделение целевого продукта из реакционной смеси, побочные реакции, спектральная характеристика. Альтернативные синтезы: фенол, *n*-крезол, хлорбензол, метиловый красный, конго красный.

Синтезы с помощью магнийорганических соединений. Типы магнийорганических соединений. Реактивы Гриньяра. Получение реактивов Гриньяра и использование их в органическом синтезе.

Образовательные технологии

Учебная программа – наименование разделов и тем	Вид занятия	Образовательные технологии
<p>Тема 1. Современное состояние и перспективы развития органического синтеза. Принципы и проблемы органического синтеза. Основные тенденции развития органического синтеза. Практическая направленность и фундаментальное значение. Методология органического синтеза. Стратегия синтеза. Роль планирования в синтезе. Варианты стратегии. Линейный и конвергентный подходы. Органические реакции и синтетические методы. Оптимизация классических и разработка новых синтетических методов. Ретросинтетический анализ.</p>	<ul style="list-style-type: none"> • лекция • решение упражнений • проверка домашних заданий 	<ul style="list-style-type: none"> • традиционные (фронтальная лекция, решение упражнений), • информационные (показ презентаций) • технология модульного и блочно-модульного обучения • здоровьесберегающие технологии
<p>Тема 2. Методы современного органического синтеза. Органическая реакция и синтетический метод Способы образования новой С–С связи. Сокращение углеродной цепи. Реакции циклизации и раскрытия циклов. Перегруппировки. Введение и обмен функциональных групп.</p>	<ul style="list-style-type: none"> • лекция • лабораторная работа в химической лаборатории • решение задач и упражнений • проверка домашних заданий 	<ul style="list-style-type: none"> • традиционные (фронтальная лекция, решение упражнений), • информационные (показ презентаций) • технология исследовательской деятельности (химический эксперимент) • технология модульного и блочно-модульного обучения • здоровьесберегающие технологии

<p>Тема 3. Методология эксперимента. Планирование, подготовка и проведение эксперимента. Качество реагентов и растворителей. Стандартное оборудование. Ведение лабораторного журнала. Методы выделения и очистки органических веществ. Определение важнейших констант органических соединений. Правила безопасной работы в химической лаборатории органического синтеза.</p>	<ul style="list-style-type: none"> • лекция • лабораторная работа в химической лаборатории • решение задач и упражнений • проверка домашних заданий 	<ul style="list-style-type: none"> • традиционные (фронтальная лекция, решение упражнений), • информационные (показ презентаций) • технология исследовательской деятельности (химический эксперимент) • технология модульного и блочно-модульного обучения • здоровьесберегающие технологии
<p>Тема 4. Выполнение синтетических работ по основным направлениям органического синтеза. Нуклеофильное замещение в алифатическом ряду. Реакции ацилирования. Электрофильное замещение в ароматическом ряду. Реакции диазотирования и азосочетания. Синтезы с помощью реактива Гриньяра.</p>	<ul style="list-style-type: none"> • лекция • лабораторная работа в химической лаборатории • решение задач и упражнений • проверка домашних заданий 	<ul style="list-style-type: none"> • традиционные (фронтальная лекция, решение упражнений), • информационные (показ презентаций) • технология исследовательской деятельности (химический эксперимент) • технология модульного и блочно-модульного обучения • здоровьесберегающие технологии

Рейтинговая система дисциплины

Распределение тем дисциплины, форм оценивания работы студентов
по модулям
Максимальное количество баллов – 100
Модуль 1

Формы работы	Баллы за работу	Общее кол-во баллов
Лекции 1-2	5	30
Контрольное задание №1 «Ретросинтетический анализ»	5	
Контрольное задание №2 «Конструктивные и деструктивные реакции. Составление схем синтезов»	10	
Самостоятельная работа. Решение упражнений по ретросинтетическому анализу. Составление схем синтезов. Расчет синтеза.	10	

Модуль 2

Формы работы	Баллы за работу	Общее кол-во баллов
Лекции 8-9	-	30
Лабораторная работа №1 «Планирование синтеза» (Индивидуальное задание)	5	
Лабораторная работа №2 «Подготовка исходных соединений и оборудования» (Работа в парах)	5	
Лабораторная работа №3 «Синтез органического соединения» (Работа в парах по заданиям)	5	
Лабораторная работа №4 «Выделение, очистка и идентификация полученного соединения» (Работа в парах)	5	
Самостоятельная работа. Аналитические обзоры литературы по современным направлениям органического синтеза	10	

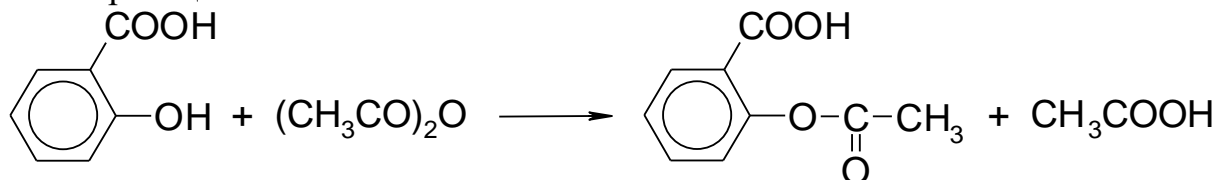
Экзамен – 40 баллов

Методические рекомендации по выполнению синтетических работ

Пример

Работа 1 Реакции ацилирования Синтез ацетилсалициловой кислоты

Основная реакция:



Реактивы:

Салициловая кислота
Уксусный ангидрид
Серная кислота
Этанол для перекристаллизации
Диэтиловый эфир

Посуда и приборы:

Колба трёхгорлая (100 мл)
Холодильник обратный
Воронка капельная
Механическая мешалка
Стеклянная мешалка с затвором
Трубка хлоркальциевая
Водяная баня
Электроплитка
Подъёмный столик
Колба Бунзена
Воронка Бюхнера

Таблица 1

Расчет синтеза на 0,13 моль салициловой кислоты

Исходные вещества					Количество вещества			Избыток		
Формула вещества	M, г/моль	T _{кип} , °C	n' _D	ρ, г/мл	п, моль	м, г	V, мл	%	п, моль	V, мл

Загрузка:

Салициловая кислота —
Уксусный ангидрид —
Серная кислота —

Методика работы

1. Собирают прибор для синтеза, состоящий из трёхгорлой колбы, механической мешалки, обратного холодильника и капельной воронки.

Прибор помещают в водяную баню. Проверяют работу мешалки.

2. В колбу помещают салициловую кислоту. Уксусный ангидрид помещают в капельную воронку. Включают мешалку и осторожно по каплям (одна капля в секунду) начинают добавлять уксусный ангидрид. После добавления всего ангидрида, капельную воронку вынимают и добавляют к смеси серную кислоту.
3. Реакционную колбу помещают в тёплую водяную баню (60 – 70°C), смесь постепенно становится прозрачной (если этого не происходит, температуру бани повышают), выдерживают при этой температуре 30 минут. После этого доводят температуру до 90 – 95°C и выдерживают реакционную смесь при перемешивании 1,5 часа.
4. При перемешивании дают жидкости остыть до комнатной температуры. После охлаждения жидкость выливают в стакан с холодной водой, перемешивают стеклянной палочкой, выдерживают до образования кристаллов и фильтруют продукт на воронке Бюхнера. Кристаллы промывают сначала холодной водой для удаления уксусного ангидрида и уксусной кислоты, затем небольшим количеством холодного эфира.
5. Ацетилсалициловую кислоту перекристаллизовывают из этанола и сушат в эксикаторе над хлоридом кальция.

Ацетилсалициловая кислота — бесцветные кристаллы в виде игл или пластинок слабокислого вкуса; плохо растворяется в воде, хорошо — в водных растворах щелочей, в 100 г этанола растворяется 20 г ацетилсалициловой кислоты, в 100 г диэтилового эфира — 3,75 г.

$M=180,16$ г/моль, $T_{пл}=136,5^{\circ}C$, $T_{кип}=140^{\circ}C$ (с разложением).

Подготовка исходных соединений

1. Перекристаллизация салициловой кислоты.

Салициловую кислоту очищают методом микровакуумной перекристаллизации из подходящего растворителя.

Этапы работы:

- а) подобрать растворитель для перекристаллизации салициловой кислоты;
 - б) очистить салициловую кислоту методом микровакуумной перекристаллизации;
 - в) высушить продукт и определить температуру плавления.
2. Уксусный ангидрид используют без дополнительной подготовки.
 3. Серную кислоту используют без дополнительной подготовки.
 4. Растворители – этанол и диэтиловый эфир перегоняют при атмосферном давлении.

Схемы установок

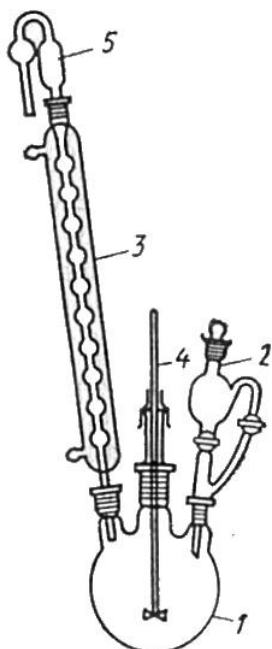


Рис.1. Установка для синтеза ацетилсалициловой кислоты:
1 – трёхгорлая колба, 2 – капельная воронка, 3 – холодильник,
4 – мешалка с затвором, 5 – хлоркальциевая трубка.

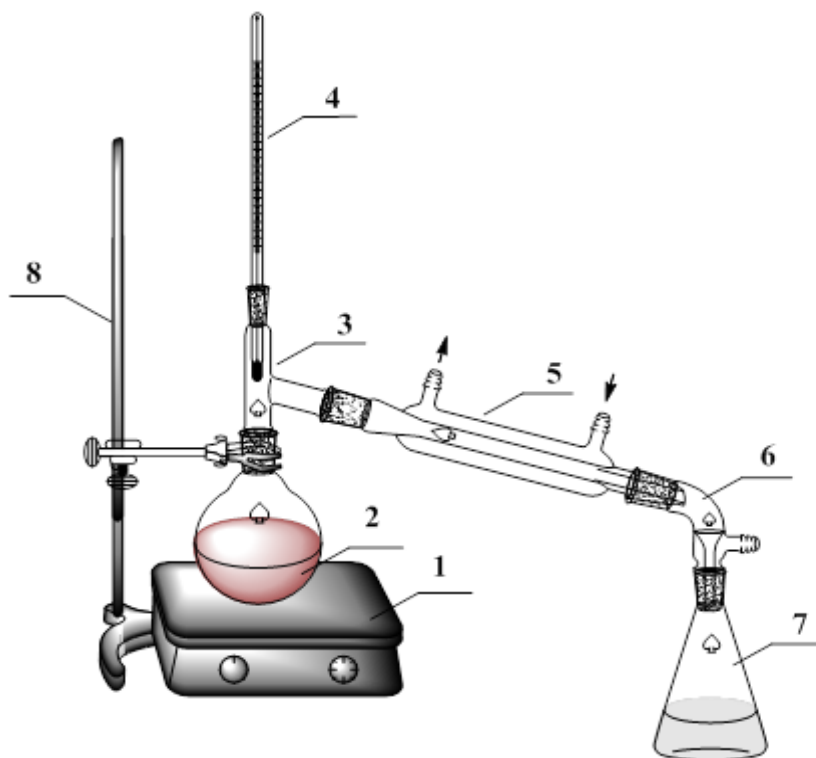


Рис.2. Установка для простой перегонки:
 1 – электроплитка, 2 – круглодонная колба, 3 – насадка Вюрца, 4 – термометр, 5 – прямой холодильник, 6 – алонж, 7 – приемник, 8 – штатив.

Характеристики синтезированной ацетилсалициловой кислоты

Таблица 2

Константы и выход продукта

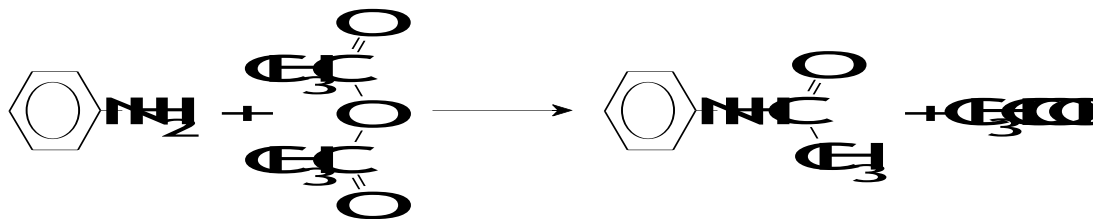
Название и формула полученного вещества	Константы вещества			Выход вещества	
	константы	установленные в работе	литературные данные	в граммах	в процентах, % от теоретического

Итоги работы

- 1.
- 2.
- 3.

Работа 2
Синтез ацетанилида

Основная реакция:



Реактивы:

Анилин свежеперегнанный ($\rho=1,0217$ г/мл) — 4,5 мл;

Уксусный ангидрид ($\rho=1,082$ г/мл) — 6 мл;

Толуол абсолютный или вода — 20 мл

Этанол для перекристаллизации

Приборы и оборудование:

Колба круглодонная (100 мл), холодильник обратный, термометр, воронка капельная, стакан (100 мл), колба Бунзена, воронка Бюхнера, баня водяная, мешалка с электромотором, электроплитка.

Выполнение синтеза:

Собирают прибор, состоящий из круглодонной колбы, обратного холодильника, капельной воронки. Настраивают работу механической мешалки.

В круглодонной колбе смешивают анилин и растворитель (безводный толуол). Содержимое колбы тщательно перемешивают. К полученной эмульсии осторожно, по каплям, при постоянном перемешивании прибавляют из капельной воронки уксусный ангидрид. Реакционную массу нагревают на водяной бане (температура воды 70-80°C) постоянно перемешивая. Нагрев ведут до тех пор, пока содержимое колбы не перейдет в жидкое состояние. После этого колбу охлаждают сначала на воздухе, затем в бане с ледяной водой. Выделившийся ацетанилид отфильтровывают на воронке Бюхнера, промывают на фильтре небольшим количеством ледяной воды и сушат на воздухе между листами фильтровальной бумаги.

Ацетанилид перекристаллизовывают из воды или 50%-ного этилового спирта.

Выход продукта составляет 69% от теоретического.

Идентифицируют полученное соединение по температуре плавления.

Ацетанилид (N-фенилацетамид, N-ацетиланилин, фениламид уксусной кислоты, антифебрин) – бесцветное кристаллическое вещество без запаха. Из воды кристаллизуется в виде ромбических листочков. Растворяется в диэтиловом эфире, хлороформе, этаноле (36,9 г в 100 мл этанола), умеренно растворим в воде (0,56 г в 100 мл воды при 25°C и 3,5 г в 100 мл при 80°C). Температура плавления – 114°C.

Результаты работы представляют в виде таблиц.

Таблица 1

Расчет синтеза

Исходные вещества					Количество вещества			Избыток		
Формула вещества	М, г/моль	T _{кип} , °C	n _D ^t	ρ, г/мл	n, моль	m, г	V, мл	n, моль	m, г	V, мл
C ₆ H ₅ NH ₂					0,1			-	-	-
(CH ₃ CO) ₂ O					0,1			0,05		

Загрузка: анилин –
уксусный ангидрид –

Объем растворителя (вода или безводный толуол) — 30 мл.

Таблица 2

Константы и выход продукта

Название и формула полученного вещества	Константы вещества			Выход вещества	
	константы	установленные в работе	литературные данные	в граммах	в процентах, % от теоретического

Расчёт баллов по дисциплине

1 модуль

№	Результат (индикатор)	Вид работы / способ	Критерии оценивания
1	ПК-1.1	Лекции 1-2	5 баллов
2	ПК-1.1 ПК-1.3 ПК-2.1	Контрольное задание №1 «Ретросинтетический анализ»	5 баллов
3	ПК-2.2	Контрольное задание №2 «Конструктивные и деструктивные реакции. Составление схем синтезов. Расчёт синтеза»	10 баллов
4		Самостоятельная работа. Решение упражнений по ретросинтетическому анализу. Составление схем синтезов. Расчет синтеза.	10 баллов
		Итого за 1 модуль	30

2 модуль

№	Результат (индикатор)	Вид работы / способ	Критерии оценивания
1	ПК-1.1	Лекции 3-8	-
2	ПК-1.1 ПК-1.3 ПК-2.1 ПК-2.2	Лабораторная работа № 1 Лабораторная работа № 2 Лабораторная работа № 3 Лабораторная работа № 4	5 баллов 5 баллов 5 баллов 5 баллов
3		Самостоятельная работа. Аналитические обзоры литературы по современным направлениям органического синтеза	10 баллов
		Итого за 2 модуль	30
		Экзамен	40
		Итого за семестр	100 баллов

Текущий контроль успеваемости

Контрольные задания по теме «Ретросинтетический анализ»

Пример

Используя трансформации расчленения и изменения функциональных групп, составьте план синтеза следующих соединений:

- 2-фенилбутин-3-ол-2;
- гександион-2,5;
- 3-фенилпропановая кислота;
- 5-оксо-5-фенилпентаналь;
- 4-метилгексанол-3.

Контрольные задания по теме «Расчет синтеза органического соединения»

Пример

1. Рассчитайте синтез 2,4,6-триброманилина и выход продукта на 0,02 моль анилина по приведённой ниже методике (Храмкина М.Н. Практикум по органической химии. Л.: Химия, 1988).

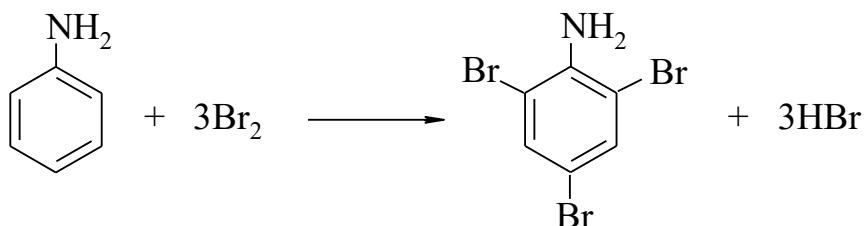
2. Рассчитайте синтез 2,4,6-триброманилина для получения 20 грамм вещества по приведённой ниже методике

Реакции электрофильного замещения в ароматическом ряду

Бромирование

Синтез 2,4,6-триброманилина

Основная реакция:



Реактивы, посуда и приборы:

Анилин	2,55 г	Колба плоскодонная широкогорлая (250 мл)
(свежеперегнанный)	(2,5 мл)	Стакан (100 мл)
Бром	15 г (4,8 мл)	Воронка капельная Баня водяная
Бромид калия	9 г	Колба коническая (150 мл)
Этанол	150 мл	Холодильник обратный
Соляная кислота ($\rho=1,19$ г/мл)		Колба Бунзена Воронка Бюхнера
Гидроксид калия (10%-ный раствор)		Баня песчаная

Сборка приборов:

1. Прибор для синтеза состоит из плоскодонной широкогорлой колбы и капельной воронки.
2. Прибор для кристаллизации, состоящий из конической колбы и обратного холодильника.

Выполнение синтеза: (Работу проводить в вытяжном шкафу!)

В широкогорлой плоскодонной колбе (прибор 1) вместимостью 250 мл растворяют 2,5 мл анилина в 75 мл воды, содержащей 2,5 мл концентрированной соляной кислоты. В стакане растворяют в 50 мл воды 9 г бромид калия и 4,8 мл брома при перемешивании. Полученный прозрачный раствор выливают в капельную воронку, помещенную над реакционной колбой. Постепенно, по каплям приливают его в течение 30 мин в реакционную смесь при энергичном помешивании. Реакция должна проходить при комнатной температуре. После окончания реакции окраска брома исчезает и выпадает осадок триброманилина. Его отделяют на воронке Бюхнера, промывают на фильтре 10%-ным раствором гидроксида калия, а затем большим количеством воды. Еще влажный триброманилин очищают от примесей кристаллизацией из горячего спирта (около 150 мл) (прибор 2). Для кристаллизации спиртовой раствор помещают в ледяную баню на 1 ч, а затем осадок отделяют на воронке Бюхнера и сушат на воздухе.

Выход 7 г (77% от теоретического).

2,4,6-Триброманилин — бесцветное кристаллическое вещество; растворим в эфире, хлороформе, трудно растворим в этиловом спирте, нерастворим в воде.
 $T_{ml}=119-120^{\circ}\text{C}$.

Оценочные материалы для проведения текущей и промежуточной аттестации

Расчёт баллов по дисциплине

1 модуль

№	Результат (индикатор)	Вид работы / способ	Критерии оценивания
1	ПК-1.1	Лекции 1-2	5 баллов
2	ПК-1.1 ПК-1.3	Контрольное задание №1 «Ретросинтетический анализ»	5 баллов
3	ПК-2.1 ПК-2.2	Контрольное задание №2 «Конструктивные и деструктивные реакции. Составление схем синтезов. Расчёт синтеза»	10 баллов
4		Самостоятельная работа. Решение упражнений по ретросинтетическому анализу. Составление схем синтезов. Расчет синтеза.	10 баллов
		Итого за 1 модуль	30

2 модуль

№	Результат (индикатор)	Вид работы / способ	Критерии оценивания
1	ПК-1.1	Лекции 3-8	-
2	ПК-1.1 ПК-1.3 ПК-2.1 ПК-2.2	Лабораторная работа № 1 Лабораторная работа № 2 Лабораторная работа № 3 Лабораторная работа № 4	5 баллов 5 баллов 5 баллов 5 баллов
3		Самостоятельная работа. Аналитические обзоры литературы по современным направлениям органического синтеза	10 баллов
		Итого за 2 модуль	30
		Экзамен	40
		Итого за семестр	100 баллов

Текущий контроль успеваемости

Контрольные задания по теме «Ретросинтетический анализ»

Пример

Используя трансформации расчленения и изменения функциональных групп, составьте план синтеза следующих соединений:

- 2-фенилбутин-3-ол-2;
- гександион-2,5;
- 3-фенилпропановая кислота;
- 5-оксо-5-фенилпентаналь;
- 4-метилгексанол-3.

Контрольные задания по теме «Расчёт синтеза органического соединения»

Пример

1. Рассчитайте синтез 2,4,6-триброманилина и выход продукта на 0,02 моль анилина по приведённой ниже методике (Храмкина М.Н. Практикум по органической химии. Л.: Химия, 1988).

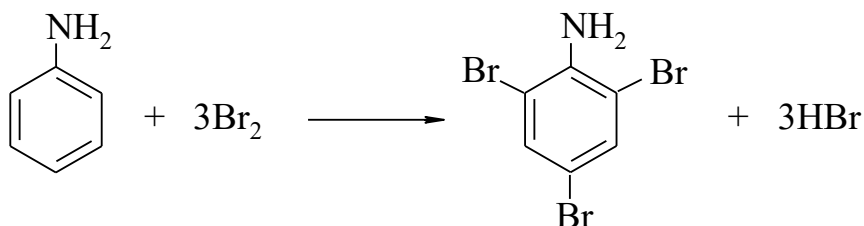
2. Рассчитайте синтез 2,4,6-триброманилина для получения 20 грамм вещества по приведённой ниже методике

Реакции электрофильного замещения в ароматическом ряду

Бромирование

Синтез 2,4,6-триброманилина

Основная реакция:



Реактивы, посуда и приборы:

Анилин	2,55 г	Колба плоскодонная широкогорлая (250 мл)
(свежеперегнаный)	(2,5 мл)	Стакан (100 мл)
Бром	15 г (4,8 мл)	Воронка капельная Баня водяная
Бромид калия	9 г	Колба коническая (150 мл)
Этанол	150 мл	Холодильник обратный
Соляная кислота ($\rho=1,19$ г/мл)		Колба Бунзена Воронка Бюхнера
Гидроксид калия (10%-ный раствор)		Баня песчаная

Сборка приборов:

1. Прибор для синтеза состоит из плоскодонной широкогорлой колбы и капельной воронки.
2. Прибор для кристаллизации, состоящий из конической колбы и обратного холодильника.

Выполнение синтеза: (Работу проводить в вытяжном шкафу!)

В широкогорлой плоскодонной колбе (прибор 1) вместимостью 250 мл растворяют 2,5 мл анилина в 75 мл воды, содержащей 2,5 мл концентрированной соляной кислоты. В стакане растворяют в 50 мл воды 9 г бромид калия и 4,8 мл брома при перемешивании. Полученный прозрачный раствор выливают в капельную воронку, помещенную над реакционной колбой. Постепенно, по каплям приливают его в течение 30 мин в реакционную смесь при энергичном помешивании. Реакция должна проходить при комнатной температуре. После окончания реакции окраска брома исчезает и выпадает осадок триброманилина. Его отделяют на воронке Бюхнера, промывают на фильтре 10%-ным раствором гидроксида калия, а затем большим количеством воды. Еще влажный триброманилин очищают от примесей кристаллизацией из горячего спирта (около 150 мл) (прибор 2). Для кристаллизации спиртовой раствор помещают в ледяную баню на 1 ч, а затем осадок отделяют на воронке Бюхнера и сушат на воздухе.

Выход 7 г (77% от теоретического).

2,4,6-Триброманилин — бесцветное кристаллическое вещество; растворим в эфире, хлороформе, трудно растворим в этиловом спирте, нерастворим в воде.
 $T_{ml}=119-120^{\circ}\text{C}$.

Примеры заданий для текущего контроля

Задание 1. Предложите варианты расчленения целевой молекулы 3-гидрокси-3-фенилпентина-1 по связям С–С. Выберите оптимальный путь и дайте объяснения.

Задание 2. Предложите схему синтеза *цис*-β-бензоилакриловой кислоты из метана и толуола.

Задание 3. Синтезы без изменения длины и строения углеродного скелета. Предложите схему синтеза: а) бутиламина из бутанола -1; б) пропаналя из 2-хлорпропана.

Задание 4. Синтезы с увеличением длины углеродной цепи на один атом углерода. Спланируйте синтез пропанола-1, используя в качестве исходного органического соединения этан и любые неорганические реагенты.

Задание 5. Синтезы с увеличением длины углеродной цепи на любое число атомов углерода.

Из 1-бромпропана синтезируйте дипропилкетон.

Задание 6. Синтезы ароматических соединений.

Из бензола и неорганических соединений синтезируйте *о*- и *м*-аминофенолы.

Задание 7. Синтезы ароматических соединений.

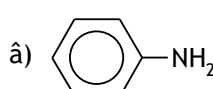
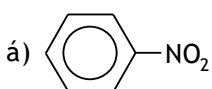
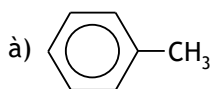
Из ацетилен и любых неорганических реагентов синтезируйте 2-амино-1-фенил-пропандиол-1,3 – промежуточный продукт синтеза антибиотика хлоромидетина. В ходе синтеза используйте один из вариантов конденсации ароматических альдегидов по типу реакции Кольбе-Шмидта.

Примеры заданий для рубежного контроля

I модуль

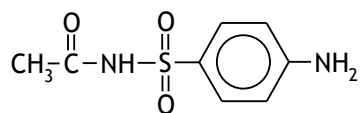
Методы получения сульфокислот и сульфохлоридов

1. Общие сведения о процессе сульфирования: определение, виды, исходные соединения, цели введения сульфогруппы в молекулу соединения.
2. Сульфирующие агенты. Преимущества и недостатки различных сульфирующих агентов.
3. Для приведенных ниже соединений предложите наиболее оптимальный сульфирующий агент, дайте объяснения:



Напишите уравнения реакций и назовите образующиеся соединения.

4. Предложите схему синтеза альбумида (*n*-аминобензол-сульфацетамида), исходя из бензола.



àëüáóöèä

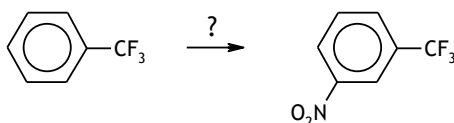
Укажите условия превращений, назовите все промежуточные соединения.

II модуль

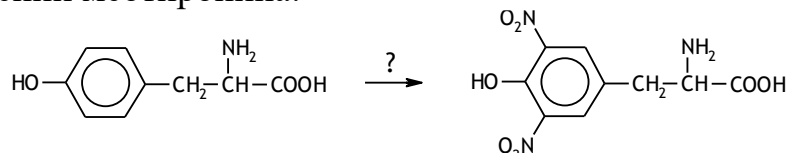
Методы получения органических нитросоединений и галогенидов

1. При получении химико-фармацевтических препаратов широко используют реакцию нитрования. Ниже приведены примеры получения промежуточных или целевых нитросоединений. Для каждого из них приведите наиболее эффективный, по вашему мнению, нитрующий агент.

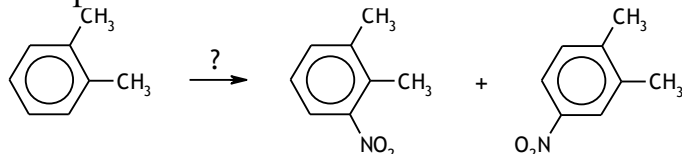
а) В производстве трифтазина:



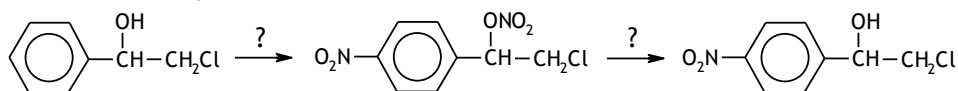
б) При получении меотиронина:



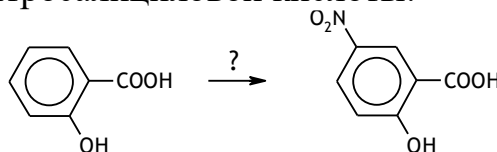
в) В производстве мефенамовой кислоты:



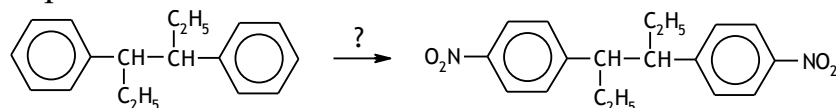
г) В синтезе левомецетина:



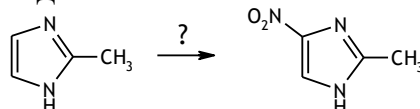
д) При получении 5-нитросалициловой кислоты:



е) В синтезе парамина:

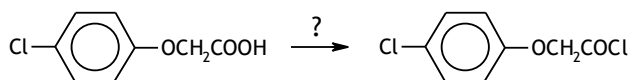


ж) При получении метронидазола:

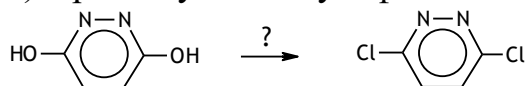


2. Высокая химическая активность органических галогенидов позволяет широко использовать их в качестве промежуточных продуктов при синтезе биологически-активных соединений. Для приведенных примеров напишите необходимый галогенирующий агент.

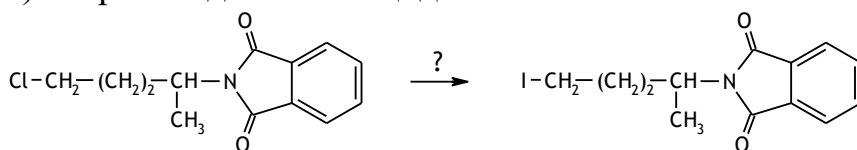
а) В производстве ацефена:



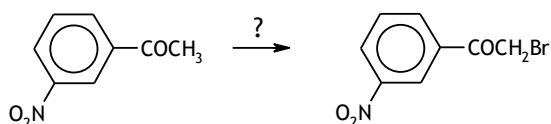
б) При получении сульфадиметоксина:



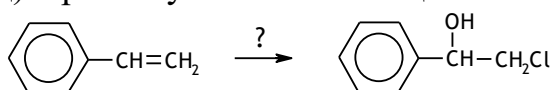
в) В производстве хиноцида:



г) В синтезе мезатона:



д) При получении левомецетина:



Промежуточная аттестация

Вопросы к экзамену

1. Основные тенденции развития органического синтеза.
2. Ретросинтетический анализ. Понятие о синтонах.
3. Роль планирования в синтезе. Линейный и конвергентный подходы.
4. Органические реакции и синтетические методы. Примеры.
5. Взаимопревращения функциональных групп. Примеры синтезов.
6. Защита функциональных групп. Примеры синтезов.
7. Селективность органических реакций.
8. Способы образования новой С–С связи.
9. Сокращение углеродной цепи.
10. Перегруппировки. Перегруппировки с сохранением углеродного скелета.
11. Перегруппировки с расщеплением углеродного скелета.
12. Построение циклических структур. Специфика задач при синтезе циклических структур.
13. Методы выделения и очистки органических веществ.
14. Стандартное оборудование для органического синтеза.
15. Способы идентификации органических соединений
16. Расчет синтеза органического соединения.

Оценочные материалы (фонд оценочных средств) для проведения промежуточной аттестации

ПК-1. Способен выбирать и использовать технические средства и методы испытаний для решения исследовательских задач химической направленности, поставленных специалистом более высокой квалификации.

Номер задания	Правильный ответ (ключ)	Содержание вопроса/задания	Критерии оценивания заданий
Задания закрытого типа с выбором одного правильного ответа			
1		<p>Для реакции этерификации необходимо использовать следующий набор реагентов:</p> <p>А. Уксусный ангидрид, пропанол-2, $H_2SO_{4\text{конц.}}$</p> <p>Б. Уксусная кислота, пропанол-2, $H_2SO_{4\text{конц.}}$</p> <p>В. Хлористый ацетил, уксусный альдегид, $H_2SO_{4\text{конц.}}$</p> <p>Г. Уксусная кислота, пропанол-2, $NaOH_{\text{конц.}}$</p>	1 балл за правильный ответ
2		<p>Для очистки и идентификации бензойной кислоты используют соответственно:</p> <p>А. Метод перегонки при атмосферном давлении и определение показателя преломления</p> <p>Б. Метод возгонки и определение показателя преломления</p> <p>В. Метод перекристаллизации и определение температуры плавления</p> <p>Г. Метод экстракции и определение молекулярной рефракции.</p>	1 балл за правильный ответ
3		<p>Для осуществления перегонки при атмосферном давлении необходимо использовать оборудование:</p> <p>А. Круглодонная колба, насадка Кляйзена, прямой холодильник, аллонж, приёмники, термометр</p> <p>Б. Колба Кляйзена, обратный холодильник, аллонж, приёмники, термометр</p> <p>В. Колба Вюрца, холодильник Либиха, насадка Дина-Старка, термометр, приёмники</p> <p>Г. Круглодонная колба, насадка Вюрца, холодильник Либиха, аллонж, приёмники, термометр</p>	1 балл за правильный ответ
4		Что такое ацилирование?	1 балл за правильный ответ
5		Дайте определение понятию «нуклеофил»	1 балл за правильный ответ
Задания открытого типа			
6		Рассчитайте, какое минимальное количество этанола потребуется для алкилирования бензола объемом 26,7 мл	3 балл

	(плотность бензола 0,8786 г/мл). Ответ укажите в граммах и с точностью до десятых.	
7	При восстановлении нитробензола массой 1,23 кг было получено 0,772 кг анилина. Рассчитайте массовую долю выхода продукта от теоретически возможного. Ответ укажите в процентах и с точностью до целого значения.	3 балла
8	Рассчитайте синтез ацетанилида на 0,2 моль анилина. В качестве ацилирующего реагента используйте уксусный ангидрид, который берется в избытке 30%. Используйте справочные данные: плотность анилина 1,0217 г/мл, плотность уксусного ангидрида 1,082 г/мл.	3 балла
9	Какая масса этилбензоата может быть получена из толуола массой 13,8 г, если выход на каждой стадии синтеза составляет 80%? Ответ укажите в граммах с точностью до десятых.	3 балла
10	Предложите схему синтеза иодбензола в три стадии исходя из нитробензола и используя реакцию diazotирования.	3 балла

ПК-2. Способен оказывать информационную поддержку специалистам, осуществляющим научно-исследовательские работы.

Номер задания	Правильный ответ (ключ)	Содержание вопроса/задания	Критерии оценивания заданий
Задания закрытого типа с выбором одного правильного ответа			
1		<p>Оцените реакционную способность анизола (метоксибензол) в реакциях электрофильного замещения по сравнению с бензолом:</p> <p>А. Анизол менее реакционноспособен, чем бензол вследствие электроноакцепторного действия метоксигруппы</p> <p>Б. Анизол более реакционноспособен, чем бензол вследствие электронодонорного действия метоксигруппы</p> <p>В. Анизол менее реакционноспособен, чем бензол вследствие дестабилизации промежуточно образующегося σ-комплекса</p> <p>Г. Анизол более реакционноспособен, чем бензол вследствие проявления метоксигруппой $-I$- и $-M$-эффектов.</p>	1 балл за правильный ответ
2		<p>Гидроксилирование алкенов осуществляют в условиях:</p> <p>А. H_2O, H_2SO_4 (конц.)</p> <p>Б. Водный раствор $KMnO_4$ при $t=0-20^\circ C$</p> <p>В. Кислый раствор $KMnO_4$ при нагревании</p> <p>Г. H_2, Ni</p>	1 балл за правильный ответ
3		<p>Для указания абсолютной конфигурации оптических изомеров используют номенклатуру:</p> <p>А. Рациональную</p> <p>Б. E,Z-номенклатуру</p> <p>В. R,S-номенклатуру</p> <p>Г. Радикало-функциональную.</p>	1 балл за правильный ответ
4		<p>Для идентификации жидких органических соединений используют:</p> <p>А. Показатель преломления</p> <p>Б. Молекулярную рефракцию</p> <p>В. Спектральные методы</p> <p>Г. Возгонку.</p>	1 балл за правильный ответ
5		<p>Дайте современную формулировку правила В.В. Марковникова.</p>	1 балл за правильный ответ
Задания открытого типа			
6		<p>Предложите не менее трёх способов алкилирования ароматических соединений, укажите условия процессов.</p>	3 балла

7	Для чего в органическом синтезе используют защиту функциональных групп, каковы требования к защитным группам? Приведите пример.	3 балла
8	Какие особенности строения и реакционной способности анилина необходимо учитывать, планируя синтезы с его участием? Назовите не менее трёх.	3 балла
9	Предложите схему получения <i>n</i>-нитро-бензойной кислоты исходя из бензола.	3 балла
10	Укажите особенности реакции этерификации. Дайте рекомендации по её практическому осуществлению.	3 балла

Учебно-методическое и информационное обеспечение дисциплины

Рекомендуемая литература

Основная литература:

1. Реутов О.А. Органическая химия: учебник для студентов вузов, обучающихся по направлению и специальности "Химия": в 4 ч. / О.А. Реутов, А.Л. Курц, К.П. Бутин; Моск. гос. ун-т им. М.В. Ломоносова. – 2-е изд., испр. – М: БИНОМ. Лаборатория знаний, 2011. – 722с., <http://82.179.130.21//Texts/1002354оно.pdf>
2. Перевалов В.П. Тонкий органический синтез: проектирование и оборудование производств: учебное пособие для вузов / В.П. Перевалов, Г.И. Колдобский. – 2-е изд. – Электрон. дан. – Москва: Юрайт, 2021. – 312 с. - (Высшее образование). – URL: <https://urait.ru/bcode/473022>
3. Ким Д.Г. Введение в теоретические основы органической химии [Электронный ресурс]: учебное пособие / Д.Г. Ким, М.В. Грищенко. – Челябинск: ЮУрГУ, 2021. – 175 с. – Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/323924>
4. Органическая химия. Базовый курс [Электронный ресурс] / Д.Б. Березин [и др.]. – 2-е изд., испр. и доп. – Санкт-Петербург: Лань, 2022. – 240 с. – Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/211490>

Дополнительная литература:

5. Галочкин А.И. Органическая химия. Книга 1. Теоретические основы. Ациклические углеводороды [Электронный ресурс]: учебное пособие для вузов / А.И. Галочкин, И.В. Ананьина; – 3-е изд., стер. – Санкт-Петербург: Лань, 2022. – 436 с. Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/201173>
6. Галочкин А.И. Органическая химия. Книга 2. Карбоциклические и элементоорганические соединения. Галогено- и гидроксипроизводные углеводородов [Электронный ресурс]: учебное пособие / А.И. Галочкин, И.В. Ананьина. - 2-е изд., испр. – Санкт-Петербург: Лань, 2022. – 404 с. – Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/206069>
7. Галочкин А.И. Органическая химия. Книга 3. Азотсодержащие и карбонильные соединения. Карбоновые кислоты и их производные [Электронный ресурс] / А.И. Галочкин, И.В. Ананьина. – 3-е изд., стер. – Санкт-Петербург: Лань, 2022. – 432 с. – Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/195480>
8. Щеголев А.Е. Органическая химия. Механизмы реакций [Электронный ресурс] / А.Е. Щеголев, Н.М. Чернов. – 3-е изд., стер. – Санкт-Петербург: Лань, 2022. – 132 с. Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/215771>
9. Шабаров Ю.С. Органическая химия [Электронный ресурс] / Ю.С. Шабаров; Шабаров Ю.С. – 5-е изд., стер. – Санкт-Петербург: Лань, 2022. – 848 с. – Режим доступа: <https://e.lanbook.com/book/210716>
10. Иванов В.Г. Органическая химия: учебник / В.Г. Иванов, В.А. Горленко, О.Н. Гева; Московский педагогический государственный университет. – Москва: ООО "Научно-издательский центр ИНФРА-М", 2022. – 560 с. – (Высшее образование: Магистратура). – ВО – Бакалавриат. – Режим доступа: <https://znanium.com/catalog/document?id=417873>

Сведения об обновлении рабочей программы дисциплины

№п.п.	Обновленный раздел рабочей программы дисциплины	Описание внесенных изменений	Реквизиты документа, утвердившего изменения
1.			
2.			
3.			