

**МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНА МЕДИЧНА АКАДЕМІЯ ПІСЛЯДИПЛОМНОЇ ОСВІТИ
ІМЕНІ П. Л. ШУПИКА**

Кафедра контролю якості і стандартизації лікарських засобів

ЗАТВЕРДЖЕНО

Рішення вченої ради

Протокол 11.03.2020 № 3

Голова вченої ради

професор академік НАМН України, професор

Ю. В. Вороненко



РОБОЧА ПРОГРАМА НАВЧАЛЬНОЇ ДИСЦИПЛІНИ

«ТЕОРЕТИЧНІ ОСНОВИ СИНТЕЗУ»

**підготовки фахівців другого (магістерського) рівня вищої освіти
галузі знань 22 «Охорона здоров'я»
спеціальності 226 «Фармація, промислова фармація»**

Київ – 2020

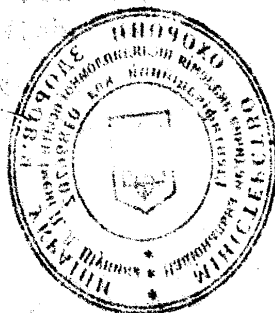
ПОГОДЖЕНО

Рішенням вченої ради медико-профілактичного
і фармацевтичного факультету

протокол 04.03.2020 № 3

Голова вченої ради медико-профілактичного
і фармацевтичного факультету

професор В. Трохимчук Трохимчук В. В.



Робоча програма навчальної дисципліни (курс за вибором) «Теоретичні основи синтезу» підготовки фахівців другого (магістерського) рівня **вищої** освіти галузі знань 22 «Охорона здоров'я» спеціальності 226 «Фармація, промислова фармація» розроблена співробітниками кафедри контролю якості і стандартизації лікарських засобів Національної медичної академії післядипломної освіти імені П. Л. Шупика (завідувач кафедри – д. фарм. н., доцент Убогов С. Г.).

Рецензенти:

Трохимчук В. В.

декан медико-профілактичного і фармацевтичного факультету НМАПО імені П.Л. Шупика, д. фарм. н., професор

Склад робочої групи

1. Убогов Сергій Геннадійович – завідувач кафедри контролю якості і стандартизації лікарських засобів НМАПО імені П. Л. Шупика, доктор фармацевтичних наук, доцент
2. Тодорова Віолетта Іванівна – доцент кафедри контролю якості і стандартизації лікарських засобів НМАПО імені П. Л. Шупика, кандидат фармацевтичних наук, доцент
3. Пилипчук Любов Борисівна – доцент кафедри контролю якості і стандартизації лікарських засобів НМАПО імені П. Л. Шупика, кандидат фармацевтичних наук, доцент
4. Федорова Людмила Олександрівна – старший викладач кафедри контролю якості і стандартизації лікарських засобів НМАПО імені П. Л. Шупика, кандидат фармацевтичних наук
5. Радченко Алла Павлівна – старший викладач кафедри контролю якості і стандартизації лікарських засобів НМАПО імені П. Л. Шупика

ВСТУП

Програма вивчення навчальної дисципліни (курс за вибором) «Теоретичні основи синтезу» складена відповідно до Стандарту вищої освіти України (далі – Стандарт)

МАГІСТР

(назва рівня вищої освіти)

галузі знань 22 «Охорона здоров'я»
(шифр і назва галузі знань)
спеціальності 226 «Фармація, промислова фармація»
(код і найменування спеціальності)
освітньої програми «Фармація»
(найменування освітньої програми)

Опис навчальної дисципліни.

Навчальна дисципліна «Теоретичні основи синтезу» належить до дисциплін вільного вибору циклу професійно-орієнтованої підготовки фахівців спеціальності «Фармація», базується на знаннях органічної хімії і безпосередньо пов'язана з практичною діяльністю в рамках напрацювання існуючих і одержання нових лікарських субстанцій. Систематичне вивчення закономірностей хімічної поведінки органічних сполук у взаємозв'язку з їх будовою і формування на цій основі творчого хімічного мислення необхідне для успішного засвоєння профільних дисциплін, а також для практичної діяльності. На сучасному етапі без знання теоретичних основ та практичних умінь з органічного синтезу неможливий відбір та пошук нових ліків, розуміння аспектів їх молекулярної фармакології. Ознайомлення з теоретичними основами органічного синтезу дає можливість зрозуміти стратегію і тактику цілеспрямованого синтезу біологічно активних речовин органічної природи, що складають основний потенціал сучасних лікарських засобів.

Згідно «Примірного навчального плану підготовки фахівців другого (магістерського) рівня вищої освіти галузі знань 22 «Охорона здоров'я» у вищих навчальних закладах МОЗ України за спеціальністю 226 «Фармація, промислова фармація» освітньої кваліфікації «Магістр фармації» від 26.07.2016 р. вивчення навчальної дисципліни «Теоретичні основи синтезу» здійснюється на 1 курсі, 2 семестрі, на вивчення якої відводиться на очній (денній) формі навчання: 90 годин (лекції – 10 годин, семінарські заняття – 10 годин, практичні заняття – 10 годин, самостійна робота – 60 годин); на заочній формі навчання: 90 годин (лекції – 2 години, семінарські заняття – 2 годин, практичні заняття – 10 годин, самостійна робота – 76 годин).

Форма навчання: очна (денна), термін навчання: 1 рік 10 місяців.

Орієнтовна структура навчальної дисципліни	Кількість кредитів, годин, з них					Рік навчання семестр	Вид контролю
	Всього	Аудиторних			СРС		
		Лекцій	Семінарських занять	Практичних занять			
Теоретичні основи синтезу (курс за вибором)	3,0 кредити ECTS / 90 год.	10	10	10	60	1 курс (II семестр)	Залік
за семестрами							
	3,0 кредити ECTS / 90 год.	10	10	10	60	1 курс (II семестр)	Залік

Форма навчання: заочна, термін навчання: 2 роки 6 місяців.

Орієнтовна структура навчальної дисципліни	Кількість кредитів, годин, з них					Рік навчання семестр	Вид контролю
	Всього	Аудиторних			СРС		
		Лекцій	Семінарських занять	Практичних занять			
Теоретичні основи синтезу (курс за вибором)	3,0 кредити ECTS / 90 год.	2	2	10	76	1 курс (II семестр)	Залік
за семестрами							
	3,0 кредити ECTS / 90 год.	2	2	10	76	1 курс (II семестр)	Залік

Предметом вивчення навчальної дисципліни «Теоретичні основи синтезу» є методологія сучасного органічного синтезу, підходи до планування та виконання синтезу органічних сполук, виділення та очистки кінцевих продуктів.

Міждисциплінарні зв'язки

Теоретичні основи синтезу закладають базу для подальшого оволодіння біологічною, фармацевтичною, медичною хіміями, технологією парфумерно-косметичних засобів, технологією ліків аптечного і промислового виробництва.

Практичні навички, яких набувають здобувачі вищої освіти під час вивчення дисципліни «Теоретичні основи синтезу», є важливою передумовою

оволодіння іншими практичними аспектами прикладних фармацевтичних дисциплін, зокрема технологією фармацевтичного синтезу.

Крім того, знання основ органічного синтезу забезпечує універсальність та фундаментальність освіти сучасного провізора, яка є необхідною у сфері створення нових лікарських засобів.

1. Мета та завдання навчальної дисципліни

1.1. Метою викладання навчальної дисципліни «Теоретичні основи синтезу» є: формування уяви про стратегію органічного синтезу; розкриття практичних аспектів органічного синтезу, шляхів і методів використання цих досягнень у фармацевтичній практиці; систематичне вивчення закономірностей хімічної поведінки органічних сполук у взаємозв'язку з їх будовою і формування на цій основі хімічного мислення, необхідного для подальшого оволодіння спеціальністю «Фармація».

1.2. Головними завданнями вивчення дисципліни «Теоретичні основи синтезу» є: розвиток теоретичних уявлень студентів про будову та закономірності хімічних перетворень органічних речовин та набуття здобувачами вищої освіти практичних навичок у виконанні хімічних перетворень, органічного синтезу та допоміжних операцій. Підготовка фахівців, яким потрібні знання органічної хімії, вимагає не лише теоретичних знань, але й різнобічних практичних навичок і вмій при проведенні хімічного експерименту.

1.3. Компетентності та результати навчання, формуванню яких сприяє дисципліна (взаємозв'язок з нормативним змістом підготовки здобувачів вищої освіти, сформульованим у термінах результатів навчання у Стандарті).

Дисципліна забезпечує набуття студентами *компетентностей*:

- загальні: ЗК2; ЗК6; ЗК12.

- фахові: ФК 19; ФК 20.

Деталізація компетентностей відповідно до дескрипторів НРК у формі «Матриці компетентностей».

Матриця компетентностей

№	Компетентність	Знання	Уміння	Комунікація	Автономія та відповідальність
1	ЗК 2. Здатність застосовувати знання у практичних ситуаціях	Знати методи реалізації знань у вирішенні практичних питань	Вміти використовувати фахові знання для вирішення практичних ситуацій	Встановлювати зв'язки із суб'єктами практичної діяльності	Нести відповідальність за своєчасність прийнятих рішень
2	ЗК 6. Знання та розуміння предметної області та розуміння професії.	Знати структуру та особливості професійної діяльності	Вміти здійснювати професійну діяльність, що потребує оновлення та інтеграції знань	Формувати комунікаційну стратегію у професійній діяльності	Нести відповідальність за професійний розвиток з високим рівнем автономності

3	<p>ЗК 12. Здатність проведення досліджень на відповідному рівні</p>	<p>Знати компоненти системи охорони здоров'я, планування та оцінку наукового дослідження</p>	<p>Здійснювати пошук наукових джерел інформації; здійснювати вибір методик проведення наукового дослідження; використовувати методи математичного аналізу і моделювання, теоретичного і експериментального дослідження у фармації.</p>	<p>Використовувати інформаційні дані з наукових джерел</p>	<p>Нести відповідальність за розробку та реалізацію запланованих проектів</p>
4	<p>ФК 19. Здатність організувати та здійснювати контроль якості лікарських засобів у відповідності з вимогами Державної фармакопеї України та належних практик, визначати способи відбору проб для контролю лікарських засобів та проводити їх стандартизацію відповідно до діючих вимог, запобігати розповсюдженню фальсифікованих лікарських засобів</p>	<p>Знати:</p> <ul style="list-style-type: none"> - державне нормування якості лікарських засобів; - кінетику хімічних реакцій та каталіз; - швидкість хімічних реакцій та хімічну рівновагу; - фізико-хімічні властивості лікарських речовин; - методи якісного та кількісного аналізу лікарських речовин; - аналіз лікарських форм у процесі виробництва; - випробування на чистоту лікарських засобів; - потенціометричний аналіз; - показники якості парентеральних, твердих, м'яких та аерозольних лікарських форм, - стабільність та терміни зберігання лікарських засобів; - аналіз води очищеної, високо очищеної та води ін'єкції; - очищення, переробка та захоронення відходів виробництва 	<ul style="list-style-type: none"> - визначати наявність сторонніх речовин (домішок) у сировині, матеріалах та готовій продукції; - визначати основні фізичні характеристики лікарських речовин (температуру топлення, температуру кипіння і температуру застигання) фізичними методами; - визначати основні показники готових лікарських засобів отриманих з лікарських та допоміжних речовин, візуальними та інструментальними методами: прозорість; забарвленість; рН; показник заломлення; кут обертання та густину ін'єкційних розчинів, - проводити контроль води очищеної, для ін'єкцій, отриманої з питної води, хімічними та інструментальними методами, а також інших розчинників; - визначати концентрацію спирту у водно-спиртових розчинах, користуючись різними розрахунковими методами, приладами; - відбирати проби та зразки лікарських речовин, лікарської рослинної сировини, 	<p>Здійснювати контроль якості лікарських засобів та їх сертифікацію</p>	<p>Нести відповідальність за проведення сертифікації та запобігання розповсюдження фальсифікованих лікарських засобів</p>

			<p>допоміжних матеріалів, напівфабрикатів для аналізу у тому числі на апірогенність та бактеріологічний аналіз;</p> <ul style="list-style-type: none"> - оформляти відповідний паспорт якості, здійснювати вибірковий посерійний контроль готової продукції на відповідність її якості аналітичній документації з метою запобігання браку; - визначати стабільність лікарських засобів та виробів медичного призначення при зберіганні протягом встановлених строків придатності. 		
5	<p>ФК 20. Здатність здійснювати розробку методик контролю якості лікарських засобів, у тому числі активних фармацевтичних інгредієнтів, лікарської рослинної сировини і допоміжних речовин з використанням фізичних, хімічних, фізико-хімічних, біологічних, мікробіологічних, фармакотехнологічних та фармакоорганолептичних методів контролю</p>	<p>Знати: - якісний аналіз катіонів та аніонів;</p> <ul style="list-style-type: none"> - лікарські засоби неорганічної природи; - елементний аналіз та аналіз за функціональними групами; - функціональний аналіз органічних сполук за функціональними групами; - загальні методи аналізу неорганічних та органічних лікарських сполук; - хімічні титриметричні методи аналізу; - хроматографічні методи ідентифікації, дослідження чистоти та кількісного вмісту лікарських засобів; - оптична активність і питома обертання; - гравіметричний метод аналізу; 	<ul style="list-style-type: none"> - визначати катіони і аніони діючих речовин неорганічної природи у сировині, матеріалах, напівпродуктах та готовій продукції хімічними методами; - визначати функціональні групи діючих речовин органічної природи у сировині, матеріалах, напівпродуктах, готовій продукції; - готувати титровані, робочі розчини і розчини індикаторів з хімічних реактивів та встановлювати процентну концентрацію і молярність титриметричними та фізико-хімічними методами 	<p>Розробляти методики контролю якості фармацевтичної продукції</p>	<p>Нести відповідальність за валідність розроблених методик контролю якості</p>

		<ul style="list-style-type: none"> - функціональний аналіз органічних сполук; - основні поняття титриметричного аналізу; - спектральні методи аналізу 			
--	--	--	--	--	--

Результати навчання:

Інтегративні кінцеві програмні результати навчання, формуванню яких сприяє навчальна дисципліна:

ПРН 1 Проводити професійну діяльність у соціальній взаємодії оснований на гуманістичних і етичних засадах; ідентифікувати майбутню професійну діяльність як соціально значущу для здоров'я людини.

ПРН 2 Застосовувати знання з загальних та фахових дисциплін у професійній діяльності.

ПРН 6 Аргументувати інформацію для прийняття рішень, нести відповідальність за них у стандартних і нестандартних професійних ситуаціях; дотримуватися принципів деонтології та етики у професійній діяльності.

ПРН 8 Здійснювати професійне спілкування державною мовою, використовувати навички усної комунікації іноземною мовою, аналізуючи тексти фахової спрямованості та перекладати іншомовні інформаційні джерела.

ПРН 12 Аналізувати інформацію, отриману в результаті наукових досліджень, узагальнювати, систематизувати й використовувати її у професійній діяльності

ПРН 14 Визначати переваги та недоліки лікарських засобів різних фармакологічних груп з урахуванням їхніх хімічних, фізико-хімічних, біофармацевтичних, фармакокінетичних та фармакодинамічних особливостей. Рекомендувати споживачам безрецептурні лікарські засоби та інші товари аптечного асортименту з наданням консультативної допомоги та фармацевтичної опіки .

ПРН 16 Визначати вплив факторів, що впливають на процеси всмоктування, розподілу, депонування, метаболізму та виведення лікарського засобу і обумовлені станом, особливостями організму людини та фізико-хімічними властивостями лікарських засобів.

ПРН 24 Планувати та реалізовувати професійну діяльність на основі нормативно-правових актів України та рекомендацій належних фармацевтичних практик.

ПРН 30 Забезпечувати контроль якості лікарських засобів та документувати його результати. Здійснювати управління ризиками якості на усіх етапах життєвого циклу лікарських засобів.

ПРН 31 Здійснювати усі види контролю якості лікарських засобів; складати сертифікати якості серії лікарського засобу та сертифікату аналізу враховуючи вимоги чинних нормативних документів, Державної фармакопеї України та

результати проведеного контролю якості. Розробляти специфікації та методики контролю якості відповідно до вимог чинної Державної фармакопеї України.

ПРН 32 Визначати основні органолептичні, фізичні, хімічні, фізико-хімічні, та фармако-технологічні показники лікарських засобів, обґрунтовувати та обирати методи їх стандартизації, здійснювати статистичну обробку результатів згідно з вимогами Державної фармакопеї України.

Результати навчання:

Інтегративні кінцеві програмні результати навчання, формуванню яких сприяє навчальна дисципліна

1. Базові знання та розуміння основ хімії і суміжних галузей знань.
2. Знання стандартного хімічного обладнання та приладів.
3. Уміння готувати необхідні розчини та реагенти, планувати та проводити експерименти.
4. Здатність класифікувати основні типи хімічних реакцій, описувати їх основні характеристики.
5. Здатність установлювати зв'язок між будовою та властивостями речовин.
6. Знання основних аспектів хімічної термінології та номенклатури, здатність виражати (або описувати) хімічні дані у символічному вигляді.
7. Знання базових принципів проведення хімічного синтезу, аналізу, характеристик хімічних сполук та лікарських препаратів.
8. Здатність описувати властивості аліфатичних, ароматичних, гетероциклічних та природних сполук, пояснювати будову та поведінку функціональних груп в органічних молекулах.
9. Уміння показувати генетичний зв'язок між класами органічних сполук.
10. Володіння практичними навичками пошуку наукової та професійної інформації з використанням сучасних комп'ютерних засобів, мережевих технологій і баз даних; технологіями самостійної діяльності та самоконтролю; узагальнення та систематизація інформації, яку отримано в результаті наукових досліджень, для вирішення типових завдань професійної діяльності.
11. Здатність самостійно застосовувати методи і засоби навчання та самоконтролю для придбання нових знань і умінь.
12. Володіння навичками проведення наукових досліджень як у складі групи, так і самостійно.
13. Володіння теоретичними та практичними аспектами органічного синтезу для використання у синтетичній практиці, знати хімічні властивості речовин; уміння передбачати можливості їх взаємодії як між собою, так і з продуктами хімічних реакцій; володіння методами визначення умов зберігання органічних речовин залежно від їх природи.

Результати навчання для дисципліни:

Знати:

– класифікацію органічних реакцій та реагентів: енергетичні умови перебігу

реакцій, типи органічних реакцій, типи механізмів реакцій, проміжні активні частинки (карбокатиони, карбаніони, вільні радикали);

- проблеми селективності органічних реакцій та шляхи їх подолання;
- каталіз в органічному синтезі;
- володіти навичками ретросинтетичного аналізу, поняття про синтони;
- методи побудови карбоциклічних та гетероциклічних сполук;
- методи введення, заміни, захисту та регенерації функціональних груп;
- основні типи перегрупування в органічному синтезі;
- методи встановлення будови органічних сполук: хімічні, інструментальні (ІЧ-спектроскопія, УФ-спектроскопія, спектроскопія ядерного магнітного резонансу, мас-спектрометрія).

Уміти:

- користуватися основним лабораторним хімічним посудом і допоміжними пристроями;
- застосовувати окремі елементи техніки лабораторних робіт, складання окремих установок, нагрівання, охолодження, перемішування, зважування, відмірювання речовин;
- виконувати синтез з розумінням процесів, які відбуваються, пояснювати суть конкретних реакцій;
- застосовувати способи виділення та очищення речовин (фільтрування, перекристалізація, перегонка, сублимація, екстракція, хроматографія);
- визначати важливі фізичні константи (температура плавлення, температура кипіння, питоме обертання, густина);
- використовувати методи встановлення будови органічних сполук (якісний елементний аналіз, хімічні та інструментальні методи дослідження);
- проводити синтези органічних сполук, зокрема і лікарських субстанцій, як приклад для здобувачів вищої освіти, дотримуватись методики виконання, виконувати вихідні обчислення і підсумкові розрахунки;
- оформляти звітну документацію за експериментальними даними;
- дотримуватись правил техніки безпеки;
- самостійно працювати з науковою і довідковою літературою з органічної хімії.

2. Інформаційний обсяг навчальної дисципліни

На вивчення навчальної дисципліни відводиться **90 годин, тобто 3 кредити ЄКТС.**

МОДУЛЬ 1. Методологія сучасного органічного синтезу

Тема 1. Задачі та методи органічного синтезу. Стратегія і тактика органічного синтезу. Ретросинтетичний аналіз. Синтони. Методи побудови зв'язків С–С як головне завдання синтезу органічних речовин. Побудова циклічних сполук

Основи ретросинтетичного аналізу. Основні типи стратегій в ретросинтетичному аналізі. Синтони – донори та акцептори. Основні принципи

планування синтезу із заданої вихідної сполуки: визначення основа вихідної сполуки, способи спрощення структури шляхом розчленення зв'язків, аналіз синтонів, підбір реагентів, що відповідають конкретним синтонам, вибір найкращої комбінації синтонів, обернення ретросинтетичної процедури та написання схеми синтезу.

Тема 2. Введення в молекули та взаємне перетворенні функціональних груп

Обладнання, що використовують в органічному синтезі та основні типи операцій. Нагрівання, охолодження та перемішування. Введення в реакційне середовище газів та рідин. Робота під тиском та при зниженому тиску. Виділення органічних речовин з реакційного середовища (кристалізація, випаровування, фільтрування, екстракція, перегонка, хроматографічні методи). Очистка твердих та рідких органічних речовин.

Тема 3. Нові технології органічного синтезу. Способи ініціювання органічних реакцій. Каталізатори органічних реакцій

Способи ініціювання органічних реакцій: механо-хімічний, ультразвуковий, мікрохвильовий та інші. Механохімія, основні принципи та підходи. Мікрохвильовий синтез. Апаратура, розчинники, обладнання. Твердофазні реакції. Реакції на поверхні кристалів. Поняття про іонні рідини та їх використання в органічному синтезі. Властивості іонних рідин. Реакції електрофільного ароматичного заміщення з використанням іонних рідин: алкілювання, ацилювання, карбонілювання, нітрування, сульфування, амінування. Каталіз органічних реакцій: міцелярний, мікрогетерогенний, міжфазний, металокомплексний, ферментативний. Підходи до вибору каталізаторів.

Тема 4. Сучасні підходи до синтезу органічних сполук. Однореакторні мультикомпонентні реакції. Тандемні (доміно-) реакції. Клік-реакції. Каскадні перетворення

Сучасні підходи до синтезу органічних сполук. Однореакторні мультикомпонентні реакції. Доміно-реакції. Каскадні перетворення. Вплив різноманітних факторів на проходження каскадних перетворень. Катіонні, аніонні та перициклічні доміно-реакції. Фотохімічно індуковані доміно-реакції. Каталіз доміно-реакцій перехідними металами. Багатокомпонентні реакції. Використання спеціальних технологій в тандемних реакціях. Клік-реакції.

Тема 5. Поняття про комбінаторну хімію. Синтез паралельний та комбінаторний. Синтез на полімерних носіях. Способи виділення та очистки органічних сполук

Поняття про комбінаторну хімію. Підходи до створення комбінаторних спеціалізованих бібліотек органічних сполук. Синтез паралельний та комбінаторний. Поняття скафолда або темплейта. Вибір рандомізуючих реагентів. Синтез на полімерних носіях. Синтез пептидів з використанням полімерних носіїв. Твердофазні методи комбінаторного синтезу (паралельний синтез, метод «чайних пакетиків», метод змішування та розподілу). Типи полімерних смол (полістирол, поліамідні та тентагелеві смоли). Способи іммобілізації вихідних сполук на твердих носіях. Прилади і обладнання для

комбінаторного синтезу (лінкери для кріплення похідних кислот, спиртів, амінів, альдегідів).

Тема 6. Розробка альтернативних шляхів синтезу цільової молекули при невизначених вихідних сполуках

Синтез даної цільової молекули, використовуючи задану сполуку. Синтез даної цільової молекули при невизначених вихідних сполуках. Ретросинтетичний аналіз заданої молекули. Вибір адаптованих методик синтезу заданої сполуки. Вибір необхідного посуду та обладнання для проведення синтезу. Проведення розрахунку кількості реагентів, каталізаторів та розчинників.

Тема 7. Проведення синтезу цільової молекули з виділенням та очисткою кінцевого продукту

Підготовка необхідного обладнання для проведення синтезу. Проведення синтезу цільової сполуки. Виділення кінцевого продукту з реагентного середовища. Очищення синтезованої речовини. Визначення практичного виходу реакції. Підтвердження хімічної будови синтезованої речовини.

3. Структура навчальної дисципліни

Форма навчання: очна (денна), термін навчання: 1 рік 10 місяців.

Назви змістовних модулів і тем	Кількість годин				
	Очна (денна) форма навчання				
	усього	у тому числі			
		лекції	семінарські заняття	практичні заняття	самостійна робота
1	2	3	4	5	6
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу					
Тема 1. Задачі та методи органічного синтезу. Стратегія і тактика органічного синтезу. Ретросинтетичний аналіз. Синтони. Методи побудови зв'язків С–С як головне завдання синтезу органічних речовин. Побудова циклічних сполук.	10	2	2	0	6
Тема 2. Введення в молекули та взаємне перетворення функціональних груп.	8	2	2	0	4
Тема 3. Нові технології органічного синтезу. Способи ініціювання органічних реакцій. Каталізатори органічних реакцій.	13	2	2	2	7

Тема 4. Сучасні підходи до синтезу органічних сполук. Однореакторні мультикомпонентні реакції. Тандемні (доміно-) реакції. Клік-реакції. Каскадні перетворення.	12	0	2	2	8
Тема 5. Поняття про комбінаторну хімію. Синтез паралельний та комбінаторний. Синтез на полімерних носіях. Способи виділення та очистки органічних сполук.	13	2	2	2	7
Тема 6. Розробка альтернативних шляхів синтезу цільової молекули при невизначених вихідних сполуках.	17	2	0	2	13
Тема 7. Проведення синтезу цільової молекули з виділенням та очисткою кінцевого продукта.	17	0	0	2	15
Разом	90	10	10	10	60
Підсумковий контроль	залік				

4. Тематичний план лекцій

№ з/п	Назва теми	Кількість годин
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу		
1	Задачі та методи органічного синтезу. Стратегія і тактика органічного синтезу. Ретросинтетичний аналіз. Синтони. Методи побудови зв'язків С–С як головне завдання синтезу органічних речовин. Побудова циклічних сполук	2
2	Введення в молекули та взаємне перетворення функціональних груп	2
3	Нові технології органічного синтезу. Способи ініціювання органічних реакцій. Каталізатори органічних реакцій	2
4	Поняття про комбінаторну хімію. Синтез паралельний та комбінаторний. Синтез на полімерних носіях. Способи виділення та очистки органічних сполук	2
5	Розробка альтернативних шляхів синтезу цільової молекули при невизначених вихідних сполуках	2
	РАЗОМ	10

5. Тематичний план семінарських занять

№ з/п	Назва теми	Кількість годин
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу		
1	Задачі та методи органічного синтезу. Стратегія і тактика органічного синтезу. Ретросинтетичний аналіз. Синтони. Методи побудови зв'язків С–С як головне завдання синтезу органічних речовин. Побудова циклічних сполук	2
2	Введення в молекули та взаємне перетворення функціональних груп.	2
3	Нові технології органічного синтезу, способи ініціювання органічних реакцій: механо-хімічний, ультразвуковий, мікрохвильовий та інші. Твердофазні реакції. Каталізатори органічних реакцій	2
4	Сучасні підходи до синтезу органічних сполук. Однореакторні мультикомпонентні реакції. Тандемні (доміно-) реакції. Клік-реакції. Каскадні перетворення.	2
5	Поняття про комбінаторну хімію. Синтез паралельний та комбінаторний. Синтез на полімерних носіях. Способи виділення та очистки органічних сполук	2
	РАЗОМ	10

6. Тематичний план практичних занять

№ з/п	Назва теми	Кількість годин
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу		
1	Нові технології органічного синтезу. Способи ініціювання органічних реакцій. Каталізатори органічних реакцій.	2
2	Сучасні підходи до синтезу органічних сполук. Однореакторні мультикомпонентні реакції. Тандемні (доміно-) реакції. Клік-реакції. Каскадні перетворення.	2
3	Поняття про комбінаторну хімію. Синтез паралельний та комбінаторний. Синтез на полімерних носіях. Способи виділення та очистки органічних сполук.	2
4	Розробка альтернативних шляхів синтезу цільової молекули при невизначених вихідних сполуках.	2
5	Проведення синтезу цільової молекули з виділенням та очисткою кінцевого продукту Підсумковий модульний контроль	2
	РАЗОМ	10

7. Тематичний план самостійної роботи студентів

№ з/п	Назва теми	Кількість годин
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу		
1	Задачі та методи органічного синтезу. Стратегія і тактика органічного синтезу. Ретросинтетичний аналіз. Синтони. Методи побудови зв'язків С–С як головне завдання синтезу органічних речовин. Побудова циклічних сполук.	6
2	Введення в молекули та взаємне перетворення функціональних груп.	4
3	Нові технології органічного синтезу. Способи ініціювання органічних реакцій. Каталізатори органічних реакцій.	7
4	Сучасні підходи до синтезу органічних сполук. Однореакторні мультикомпонентні реакції. Тандемні (доміно-) реакції. Клік-реакції. Каскадні перетворення.	8
5	Поняття про комбінаторну хімію. Синтез паралельний та комбінаторний. Синтез на полімерних носіях. Способи виділення та очистки органічних сполук.	7
6	Розробка альтернативних шляхів синтезу цільової молекули при невизначених вихідних сполуках.	13
7	Проведення синтезу цільової молекули з виділенням та очисткою кінцевого продукту.	15
РАЗОМ		60

3. Структура навчальної дисципліни

Форма навчання: заочна, термін навчання: 2 роки 6 місяців.

Назви змістовних модулів і тем	Кількість годин				
	Заочна форма навчання				
	усього	у тому числі			
		лекції	семінарь кі заняття	практичні заняття	самостійна робота
1	2	3	4	5	6
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу					
Тема 1. Задачі та методи органічного синтезу. Стратегія і тактика органічного синтезу. Ретросинтетичний аналіз. Синтони. Методи побудови зв'язків С–С як	10	2	0	0	8

головне завдання синтезу органічних речовин. Побудова циклічних сполук.					
Тема 2. Введення в молекули та взаємне перетворення функціональних груп.	8	0	2	0	6
Тема 3. Нові технології органічного синтезу. Способи ініціювання органічних реакцій. Каталізатори органічних реакцій.	13	0	0	2	11
Тема 4. Сучасні підходи до синтезу органічних сполук. Однореакторні мультикомпонентні реакції. Тандемні (доміно-) реакції. Клік-реакції. Каскадні перетворення.	12	0	0	2	10
Тема 5. Поняття про комбінаторну хімію. Синтез паралельний та комбінаторний. Синтез на полімерних носіях. Способи виділення та очистки органічних сполук.	13	0	0	2	11
Тема 6. Розробка альтернативних шляхів синтезу цільової молекули при невизначених вихідних сполуках.	17	0	0	2	15
Тема 7. Проведення синтезу цільової молекули з виділенням та очисткою кінцевого продукта.	17	0	0	2	15
Разом	90	2	2	10	76
Підсумковий контроль	залік				

4. Тематичний план лекцій

№ з/п	Назва теми	Кількість годин
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу		
1	Задачі та методи органічного синтезу. Стратегія і тактика органічного синтезу. Ретросинтетичний аналіз. Синтони. Методи побудови зв'язків С–С як головне завдання синтезу органічних речовин. Побудова циклічних сполук	2
	РАЗОМ	2

5. Тематичний план семінарських занять

№ з/п	Назва теми	Кількість годин
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу		
1	Введення в молекули та взаємне перетворення функціональних груп.	2
	РАЗОМ	2

6. Тематичний план практичних занять

№ з/п	Назва теми	Кількість годин
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу		
1	Нові технології органічного синтезу. Способи ініціювання органічних реакцій. Каталізатори органічних реакцій.	2
2	Сучасні підходи до синтезу органічних сполук. Однореакторні мультикомпонентні реакції. Тандемні (доміно-) реакції. Клік-реакції. Каскадні перетворення.	2
3	Поняття про комбінаторну хімію. Синтез паралельний та комбінаторний. Синтез на полімерних носіях. Способи виділення та очистки органічних сполук.	2
4	Розробка альтернативних шляхів синтезу цільової молекули при невизначених вихідних сполуках.	2
5	Проведення синтезу цільової молекули з виділенням та очисткою кінцевого продукту. Підсумковий модульний контроль.	2
	РАЗОМ	10

7. Тематичний план самостійної роботи студентів

№ з/п	Назва теми	Кількість годин
Модуль 1. Методологія сучасного органічного синтезу		
1	Задачі та методи органічного синтезу. Стратегія і тактика органічного синтезу. Ретросинтетичний аналіз. Синтони. Методи побудови зв'язків С–С як головне завдання синтезу органічних речовин. Побудова циклічних сполук.	8
2	Введення в молекули та взаємне перетворення функціональних груп.	6
3	Нові технології органічного синтезу. Способи ініціювання органічних реакцій. Каталізатори органічних реакцій.	11

4	Сучасні підходи до синтезу органічних сполук. Однореакторні мультикомпонентні реакції. Тандемні (доміно-) реакції. Клік-реакції. Каскадні перетворення.	10
5	Поняття про комбінаторну хімію. Синтез паралельний та комбінаторний. Синтез на полімерних носіях. Способи виділення та очистки органічних сполук.	11
6	Розробка альтернативних шляхів синтезу цільової молекули при невизначених вихідних сполуках.	15
7	Проведення синтезу цільової молекули з виділенням та очисткою кінцевого продукту.	15
	РАЗОМ	76

8. Методи навчання

У викладанні дисципліни «Теоретичні основи синтезу» використовуються такі методи навчання:

- за типом пізнавальної діяльності: пояснювально-ілюстративний, дедуктивний, репродуктивний, логіки пізнання (аналітичний, індуктивний), проблемного викладу;
- за основними етапами процесу: формування, закріплення та застосування знань; узагальнення знань; формування умінь і навичок;
- за системним підходом: стимулювання та мотивація; контроль та самоконтроль;
- за джерелами знань: словесні – лекція, пояснення; наочні – демонстрування, ілюстрування; текстові – наукові видання;
- за рівнем самостійної розумової діяльності: частково-пошуковий; дослідницький; метод проблемного викладання.

9. Методи контролю

Види контролю: вихідний, поточний і підсумковий.

Форма підсумкового контролю відповідно до навчального плану: залік.

Вихідний контроль теоретичної підготовки здійснюється на початку кожного заняття.

Поточний контроль здійснюється на кожному занятті відповідно до конкретних цілей, а також під час індивідуальної роботи викладача зі студентом для тих тем, які студент опрацьовує самостійно і вони не входять до структури практичного заняття. Використовується стандартизована форма контролю теоретичної та практичної підготовки студентів. На кожному практичному занятті студент відповідає на тестові завдання, питання за темою практичного заняття, знання яких необхідні для розуміння поточної теми, питання лекційного курсу і

самостійної роботи, які стосуються поточного заняття, демонструє знання та вміння практичних навичок згідно з темою лабораторного заняття.

Самостійна робота студентів оцінюється під час поточного контролю теми на відповідному занятті. Засвоєння тем, які виносяться лише на самостійну роботу, контролюється при підсумковому контролі. Оцінка практичної підготовки студентів – за результатом виконання практичної частини – оформлюється у вигляді протоколу.

Критерії оцінювання поточної навчальної діяльності:

Оцінку «**відмінно**» одержує студент, який брав активну участь в обговоренні найбільш складних питань з теми заняття, дав не менше 90% правильних відповідей на стандартизовані тестові завдання, без помилок відповів на письмові завдання, виконав практичну роботу та оформив протокол.

Оцінку «**добре**» одержує студент, який брав участь в обговоренні найбільш складних питань з теми, дав не менше 75% правильних відповідей на стандартизовані тестові завдання, припустився окремих незначних помилок у відповідях на письмові завдання, виконав практичну роботу та оформив протокол.

Оцінку «**задовільно**» одержує студент, який брав участь в обговоренні найбільш складних питань з теми, дав не менше 60% правильних відповідей на стандартизовані тестові завдання, припустився значних помилок у відповідях на письмові завдання, виконав практичну роботу та оформив протокол.

Оцінку «**незадовільно**» одержує студент, який не брав участь в обговоренні найбільш складних питань з теми, дав менше 60% правильних відповідей на стандартизовані тестові завдання, припустився грубих помилок у відповідях на письмові завдання або взагалі не дав відповідей на них, не виконав практичну роботу та не оформив протокол.

Підсумковий контроль здійснюється по завершенню семестру вивчення дисципліни у формі заліку.

10. Схема нарахування та розподіл балів, які отримують здобувачі вищої освіти

Максимальна кількість балів, яку може набрати студент за навчальну діяльність при вивченні дисципліни становить 200 балів.

Мінімальна кількість балів, яку повинен набрати студент за навчальну діяльність для зарахування дисципліни становить 120 балів.

Розрахунок кількості балів проводиться на підставі отриманих студентом оцінок за 4-ри бальною (національною) шкалою під час вивчення дисципліни, шляхом обчислення середнього арифметичного (СА), округленого до двох знаків після коми. Отримана величина конвертується у бали за багатобальною шкалою таким чином: $X = CA * 200 / 5$.

Оцінювання знань з дисципліни проводять за відповідною шкалою:

200 балів	Оцінка за шкалою ECTS	Оцінка за національною шкалою
70 - 200	A	5 (відмінно)
155 -169	B	4 (добре)
140 - 154	C	
130 -139	D	3 (задовільно)
120 - 129	E	
60 - 119	FX	2 (незадовільно)
1 - 59	F	

11. Методичне забезпечення

Навчальний контент (конспект або розширений план лекцій), робочі плани практичних (семінарських) занять, завдання для лабораторних робіт, самостійної роботи, питання для теоретичного матеріалу та практикуму, задачі у вигляді схем хімічних перетворень, та завдань для розвитку творчого мислення, завдання або кейси для поточного та підсумкового контролю знань й умінь здобувачів вищої освіти з навчальної дисципліни.

1. Робоча програма навчальної дисципліни.
2. Методичні матеріали мультимедійних презентацій лекцій.
3. Перелік теоретичних питань та практичних завдань до аудиторної контрольної роботи.
4. Комплекти тестових завдань в електронній та письмовій формах.
5. Перелік теоретичних питань до підсумкового модульного контролю.

Перелік питань що виносяться на підсумковий контроль

1. Цілі органічного синтезу.
2. Стратегія та тактика органічного синтезу. Приведіть приклади.
3. Етапи органічного синтезу.
4. Методи органічного синтезу.
5. Ретросинтетичний аналіз. Синтони.
6. Методи одержання 3-х-, 4-х-членних циклічних сполук.
7. Методи одержання 6-ти членних циклічних сполук.
8. Методи одержання вуглець-вуглецевих зв'язків в органічному синтезі.
9. Методи одержання 5-ти членних циклічних сполук.
10. Селективність органічних реакцій (хемо-, регіо-, стерео-).
11. Рентгеноструктурний аналіз, як метод встановлення структури.
12. Чим відрізняються терміни «селективність» і «специфічність» органічних реакцій?
13. Якими способами можливо досягти селективності протікання реакції?
14. Введення аміногрупи в органічні сполуки.
15. Методи захисту аміногрупи.
16. Одержання та застосування в органічному синтезі фенолів.

17. Введення атомів галогенів в органічні сполуки. Заміщення атомів галогенів на інші функціональні групи.

18. Методи захисту гідроксильної групи. Використання в органічному синтезі гідроксильних похідних.

19. Активація карбоксильної групи в органічному синтезі.

20. Одержання та застосування карбонільних сполук в органічному синтезі.

21. Методи захисту карбонільної групи.

22. Взаємні перетворення похідних карбонових кислот.

23. ТСХ, як метод ідентифікації та очищення органічних сполук.

24. Перегонка, її види та застосування.

25. Методи виділення органічних сполук з реакційного середовища.

26. Які методи аналізу Ви запропонуєте для визначення чистоти органічних сполук?

27. Перегонка, як метод розподілу та очистки органічних сполук.

28. Методи очистки органічних сполук.

29. Хроматографія, як метод ідентифікації та очищення органічних сполук.

30. Методи очищення кристалічних сполук.

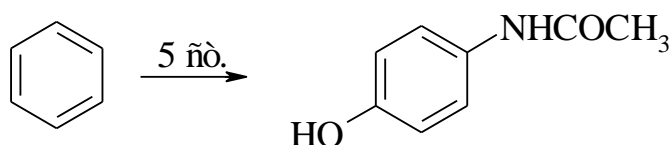
31. Які Ви знаєте методи очищення рідких органічних сполук?

32. Які Ви знаєте методи очищення кристалічних органічних сполук?

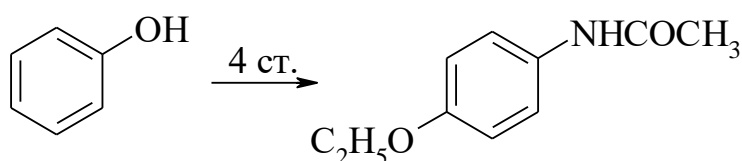
33. Чим відрізняються терміни «перегонка» та «возгонка»? Для чого використовують ці процеси?

34. Запропонуйте найбільш раціональну схему наведених речовин із вихідної сполуки (34 – 53). Для кожної стадії вкажіть необхідні реагенти, умови проведення реакції та особливості виділення продукту, можливі домішки:

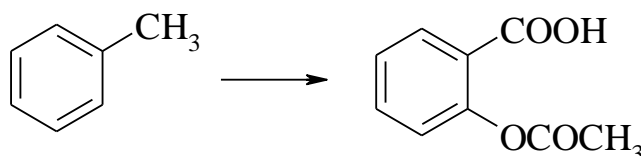
34.



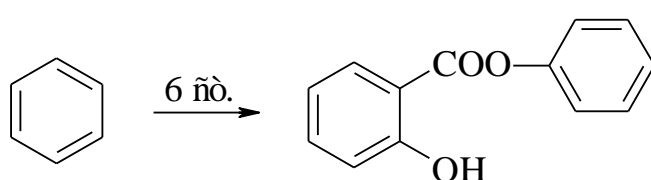
35.



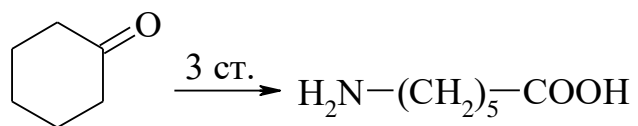
36.



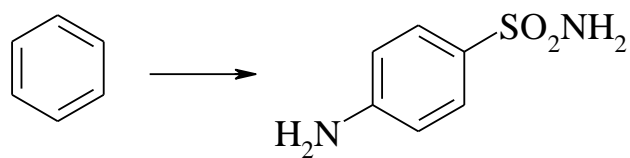
37.



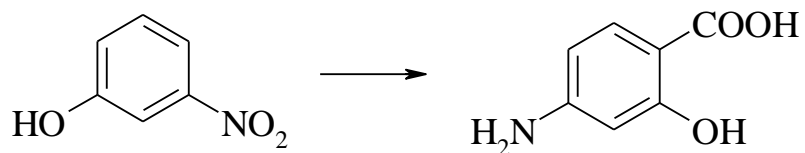
38.



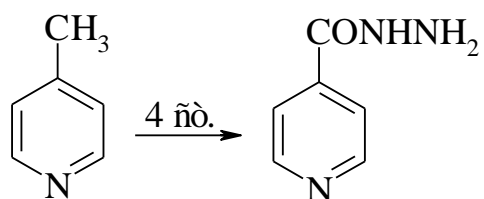
39.



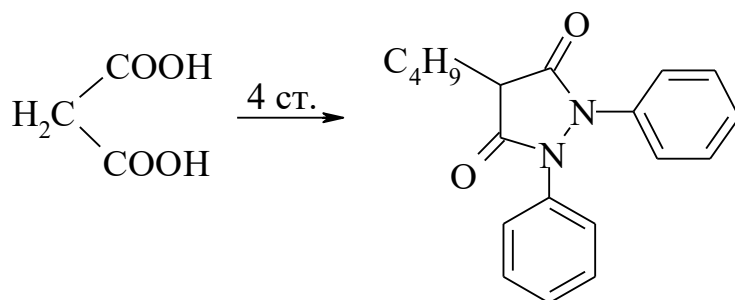
40.



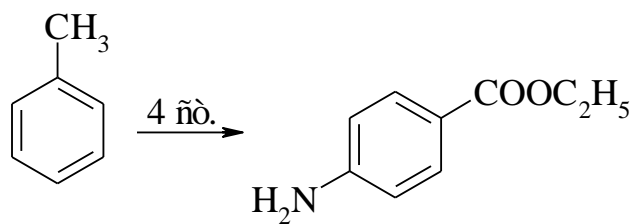
41.



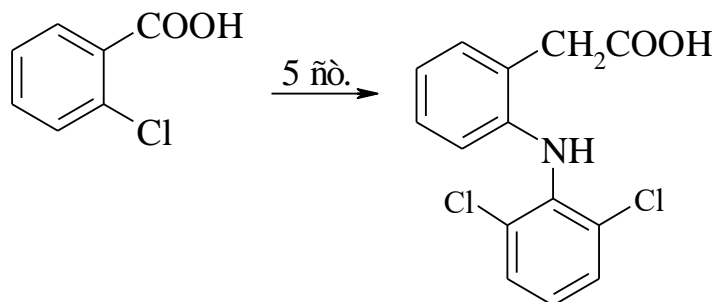
42.



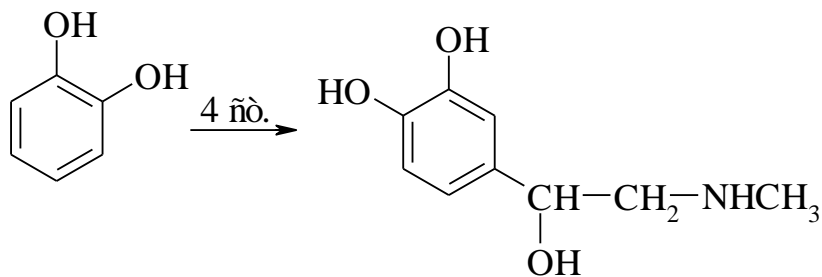
43.



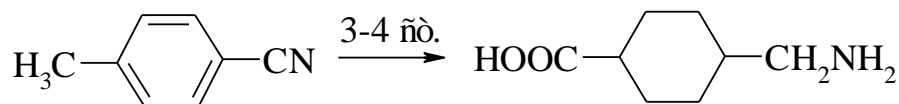
44.



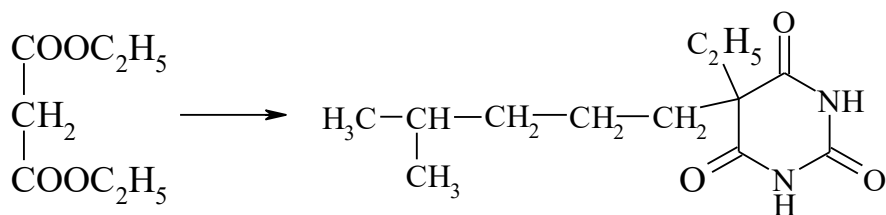
45.



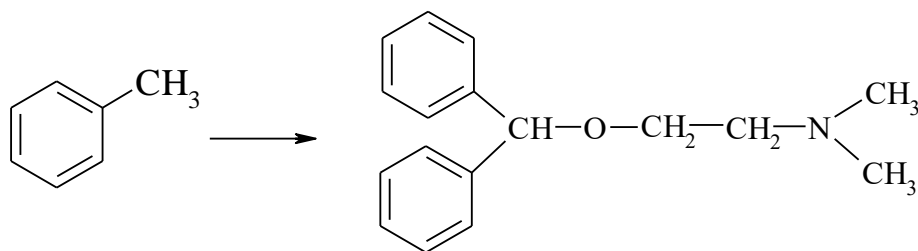
46.



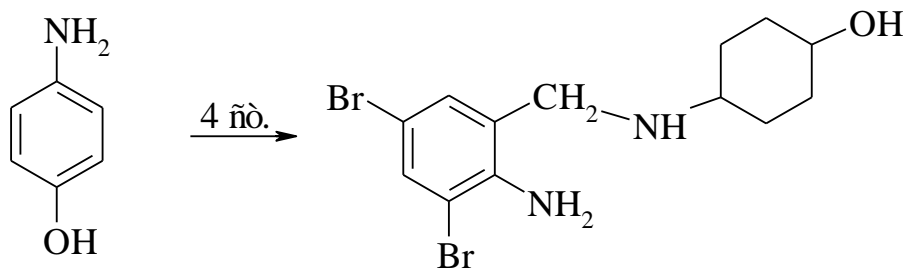
47.



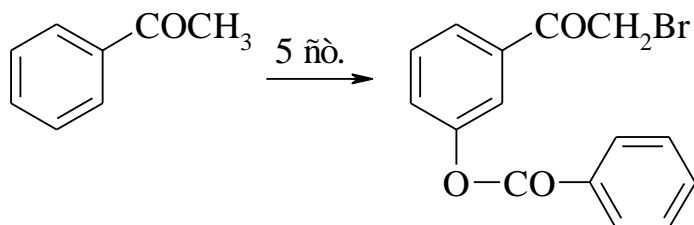
48.



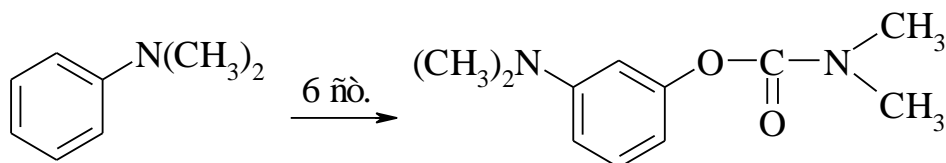
49.



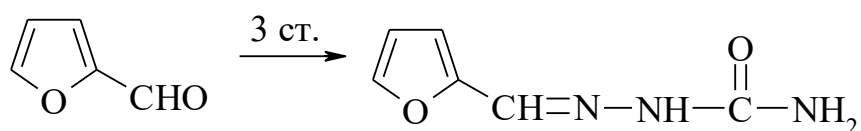
50.



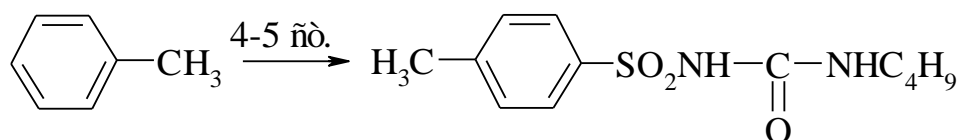
51.



52.



53.



12. Рекомендована література

Основна література

1. Смит, В. Органический синтез. Наука и искусство: Пер. с англ. / В. Смит, А. Бочков, Р. Кейпл. – М : Мир, 2001. – 573 с.
2. Смит, В. Основы современного органического синтеза / В. Смит, А. Д. Дильман. – М : БИНОМ, 2009. – 750 с.
3. Швайка, О. Основы синтезу лікарських речовин та їх проміжних продуктів / О. Швайка. – Донецьк, 2004. – 552 с.
4. Пассет, Б. В. Основные процессы химического синтеза биологически активных веществ (БАВ): Учебник. / Б. В. Пассет. – М: ГЭОТАР-МЕМ, 2002. – 376с.
5. Основы органической химии лекарственных веществ / А. Т. Солдатенков, Н. М. Колядина, И. В. Шендрик. – М : Химия, 2001.– 192 с.
6. Silverstain, R. M., Webster, F. X., Kiemle, D. J. Spectrometric identification of organic compounds John Wiley & sons, inc. 7th edition, 2005. – 502 p.
7. Титце, Л. Domino-реакции в органическом синтезе / Л. Титце, Г. Браше, К. Герике; пер. с англ. – 2-е изд. – М. : БИНОМ, 2015. – 674 с.
8. Лебедев, А. Т. Масс-спектрометрия в органической химии / А. Т. Лебедев. – Москва : БИНОМ. Лаборатория знаний, 2003. – 493 с.
9. Ласло, П. Логика органического синтеза: в 2-х томах: Пер. с франц. / П. Ласло. – М : Мир, 1998. – 229с. - 200с.
10. Титце, Л. Препаративная органическая химия: Реакции и синтезы в практикуме органической химии и научно-исследовательской лаборатории / Л. Титце, Т. Айхер. Пер. с нем. – М. : Мир, 1999.
11. Химическая энциклопедия: В 5 т. / Редкол. : Зефирова Н. С. и др. – М. : Большая Российская энцикл., т. 1-5, 1988-1998.
12. Безуглый, П. А. От субстанции к лекарству: Учебное пособие / П. А. Безуглый, В. В. Болотов, И. С. Гриценко и др. – Х. : Изд-во НФаУ: Золотые страницы, 2005. – 1244 с.
13. Шабаров, Ю. С. Органическая химия: В 2-х кн. Часть 1. Нециклические соединения / Ю. С. Шабаров. – М. : Химия, 1994. – 496 с.
14. Шабаров, Ю. С. Органическая химия: В 2-х кн. Часть 2. Циклические

соединения / Ю. С. Шабаров. – М. : Химия, 1994.– 352 с.

15. Воловенко, Ю. М. Ядерний магнітний резонанс / Ю. М. Воловенко, О. В. Туров. – К., Ірпінь ВТФ «Перун», 2007. – 480 с.

16. Кларидж, Т. Д. В. Сучасні методи ЯМР високого розділення в хімії / Т. Д. В. Кларидж; пер. з англ. Турова О. В. – Київ, 2006.

17. Березин, Б. Д. Курс современной органической химии : учеб. пособ. для вузов / Б. Д. Березин, Д. Б. Березин. – М. : Высш. шк., 2001. – 768 с.

Додаткова література

18. Туркевич М., Владзімірська О., Лесик Р. Фармацевтична хімія (стероїдні гормони, їх синтетичні замінники і гетероциклічні сполуки як лікарські засоби). Підручник. – Вінниця: Нова Книга, 2003. – 464 с.

19. В.Г. Беликов. Фармацевтическая химия. – М.: «МЕДпресс-информ», 2008. – 615 с.4.

20. Фармацевтическая химия: за ред. А.П. Арзамасцева. – 3-е изд. – М.: ГЭОТАРМедиа, 2006. – 635 с. 50

21. Скакун М.П., Посохова К.А. Фармакологія. Підручник. – Укрмедкнига, 2003. - 740 с.

22. Орлов В.Д., Липсон В.В., Иванов В. В. Медицинская химия // Фолио. – 2005.- 464 с.7.

Інформаційні ресурси

1. Organic Chemistry Reference Lectures [Електронний ресурс] // Haverford College. – Режим доступу: <http://bit.ly/2xCNQn3>. (Дата звернення 02.05.2017)

2. Neuman, R. Organic Chemistry Textbook [Електронний ресурс] / Robert Neuman. – Режим доступу: <http://bit.ly/2wWJ1rz>. (Дата звернення 02.05.2017)

3. Nowick, J. Chem 51a: Organic Chemistry [Електронний ресурс] / James Nowick. – Режим доступу: <http://bit.ly/2hyNqu8>. (Дата звернення 02.05.2017)

4. Virtual Textbook of Organic Chemistry [Електронний ресурс]. – Режим доступу: <http://bit.ly/2xyqtNV>. (Дата звернення 02.05.2017)

5. Курта, С. А. Хімія органічних сполук [Електронний ресурс] / С. А. Курта, Є. Р. Лучкевич, М. Р. Матківський. – 2012. – Режим доступу: <http://bit.ly/2yvdaKW>. (Дата звернення 02.05.2017)

6. Навчальний курс «Органічна хімія» [Електронний ресурс]. – Режим доступу: <http://bit.ly/2yuZGyW>. (Дата звернення 02.05.2017)

7. Principles of Organic Medicinal Chemistry [Електронний ресурс]. – Режим доступу: <http://bit.ly/2yux7BF>. (Дата звернення 02.05.2017)

8. Organic chemistry notes [Електронний ресурс]. – Режим доступу: <http://bit.ly/2yab2MS>. (Дата звернення 02.05.2017)

9. Essentials of Organic Chemistry: For Students of Pharmacy [Electronic resource]. – Режим доступу: <http://bit.ly/2fsPxv1>. (Дата звернення 02.05.2017)

10. Центр дистанционных технологий обучения [Електронний ресурс]. – Режим доступу : <http://pharmel.kharkiv.edu>. (Дата звернення 02.05.2017)

11. Domino-реакции в органическом синтезе [Electronic resource]. – Режим доступу: <https://bit.ly/2GiKIjG>. (Дата звернення 02.05.2017)