

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/

«30» августа 2019 г.

**РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ (МОДУЛЯ)
ХИМИЯ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ СОЕДИНЕНИЙ**

Уровень высшего образования:
Магистратура

Направление подготовки (специальность):

04.04.01 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 (модуля) разработана в соответствии с самостоятельно установленным МГУ образовательным стандартом (ОС МГУ) для реализуемых основных профессиональных образовательных программ высшего образования по направлению подготовки 04.04.01 «Химия» (программа магистратуры) в редакции приказа МГУ от 30 августа 2019 г., №1033.

Год (годы) приема на обучение 2019/2020, 2020/2021

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

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

Компетенция	Индикаторы достижения	Планируемые результаты обучения по дисциплине (модулю)
СПК-1. Способен использовать фундаментальные разделы органической химии, современные методы органической и элементоорганической химии, физико-химического и структурного анализа органических веществ при проведении научных исследований по органической и элементоорганической химии	СПК-1.М.1 Оптимизирует схему органического синтеза на основе знаний фундаментальных разделов органической химии и представлений о природе реакционной способности органических соединений	Знать: фундаментальные понятия органической химии; Уметь: выбрать наиболее рациональные реагенты для осуществления заданных превращений органических соединений
	СПК-1.М.2 Предлагает методы идентификации состава и структуры органических соединений	Владеть основными физико-химическими методами анализа органических соединений

3. Объем дисциплины (модуля) составляет 2 зачетных единицы, всего 72 часа, из которых 42 часа составляет контактная работа студента с преподавателем (19 часов занятия лекционного типа, 19 часов – занятия семинарского типа, 2 часа - групповые консультации, 2 часа – промежуточный контроль успеваемости), 30 часов составляет самостоятельная работа студента.

4. Для того чтобы формирование данной компетенции было возможно, 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 промежу-	Всего (часы)	В том числе	
		Контактная работа (работа во взаимодействии с преподавателем)	Самостоятельная работа

точной аттестации по дисциплине (модулю)		давателем), часы из них					та 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)	14	4	4				8	6		6
Раздел 2. Методы синтеза и химические свойства конденсированных пятичленных гетероциклических соединений с одним гетероатомом (индолы, бензофураны, бензотиотфены)	14	4	4				8	6		6
Раздел 3. Методы синтеза и химические свойства 1,2- и 1,3-азолов	14	4	4				7	6		6
Раздел 4. Методы синтеза шестичленных гетероциклических соединений с одним гетероатомом	14	4	4				8	6		6

(пиридины, хинолины, Изохинолины)										
Раздел 5. Методы синтеза и химические свойства пиримидинов и пуринов	12	3	3				6	6	0	6
Промежуточная аттестация <u>зачет</u>	4			2		2	4			
Итого	72	19	19	2		2	42	30	0	30

(*) текущий контроль успеваемости осуществляется во время семинарских занятий

6. Образовательные технологии:

- применение компьютерных баз данных
- 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 обеспеч-

печение, 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

Со всех компьютеров МГУ организован доступ к полным текстам научных журналов и книг на русском и иностранных языках. Доступ открыт по IP-адресам, логин и пароль не требуются: <http://nbmgu.ru/>

Материально-техническое обеспечение: для проведения занятий необходима аудитория с доской и, при необходимости, с техникой для презентаций

11. Язык преподавания – русский

12. Преподаватели: в.н.с., д.х.н., профессор М.А. Юровская (+7) 495 939 53 76 yumar@org.chem.msu.ru

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 к зачету

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 кислотно-катализируемая 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*-аминобензилкетон [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 тиазолов 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 пиридов – 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-оксазина, 2-(1H)-пиразина, оксазола)
27. Синтзы пиридинов с образованием связи C₍₃₎-C₍₄₎ (синтез из 1,3-дикарбонильных и β-енаминокрбонильных соединений, синтез пиридонов-2 из β-дикарбонильных соединений и цианацетамида [синтез Гуареши], трансформация 5-нитропиримидина под действием нитрилов, использование реакции Дильса-Альдера).
28. Синтзы пиридинов с образованием связи C₍₃₎-C₍₄₎ (синтез из 1,3-дикарбонильных и β-енаминокрбонильных 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, нуклофильные трансформации пиридинового ядра – реакция Коста-Сагитуллина).
30. Синтезы витамина В₆ – 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 Фридлендера], 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 нитрилиевых 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-карбоксамиды с муравьиной кислотой, производными карбодиимида, взаимодействие 5-аминоимидазол-4-карбонитрила с тииоимидатами, циклизация 5-аминоимидазол-4-карбоксамиды 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	2	3	4	5
Результат				
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 непринципиального 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
--	-------------------------

Знать: фундаментальные понятия органической химии;	мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на зачете
Уметь: выбрать наиболее рациональные реагенты для осуществления заданных превращений органических соединений	мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на зачете
Владеть основными физико-химическими методами анализа органических соединений	мероприятия текущего контроля успеваемости, устный опрос на зачете