

Министерство науки и высшего образования Российской Федерации
НАЦИОНАЛЬНЫЙ ИССЛЕДОВАТЕЛЬСКИЙ
ТОМСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ (НИ ТГУ)

Химический факультет

УТВЕРЖДЕНО:

И.о. декана

А. С. Князев

Оценочные материалы по дисциплине

Синтез химико-фармацевтических препаратов

по специальности

04.05.01 Фундаментальная и прикладная химия

Специализация:

Фундаментальная и прикладная химия

Форма обучения

Очная

Квалификация

Химик / Химик-специалист. Преподаватель химии

Год приема

2024

СОГЛАСОВАНО:

Руководитель ОП

В.В. Шелковников

Председатель УМК

В.В. Шелковников

Томск – 2024

1. Компетенции и индикаторы их достижения, проверяемые данными оценочными материалами

Целью освоения дисциплины является формирование следующих компетенций:

ОПК-1. Способен анализировать и интерпретировать результаты химических экспериментов, наблюдений и измерений в различных областях химии;

ОПК-2. Способен проводить синтез, анализ, изучение структуры и свойств веществ и материалов, исследовать процессы с их участием;

ОПК-3. Способен применять расчетно-теоретические методы для изучения свойств веществ и процессов с их участием, используя современное программное обеспечение и базы данных профессионального назначения;

ПК-1. Способен планировать работу и выбирать адекватные методы решения научно-исследовательских задач в выбранной области химии, химической технологии или смежных с химией науках.

Результатами освоения дисциплины являются следующие индикаторы достижения компетенций:

РООПК 1.1 Знает теоретические основы неорганической, органической, физической и аналитической химии, применяет их при решении профессиональных задач в других областях химии.

РООПК 1.2 Умеет систематизировать и интерпретировать результаты экспериментов и расчетно-теоретических работ с использованием теоретических основ традиционных и новых разделов химии

РООПК 1.3 Умеет грамотно формулировать заключения и выводы по результатам работы

РООПК 2.1 Знает стандартные приемы и операции, используемые при получении веществ неорганической и органической природы

РООПК 2.2 Знает теоретические основы методов изучения состава, структуры и свойств для грамотного выбора метода исследования

РООПК 2.3 Умеет проводить стандартные синтезы по готовым методикам, выполнять стандартные операции для определения химического и фазового состава веществ и материалов, а также использовать серийное научное оборудование для изучения их свойств

РООПК 3.1 Знает основы теоретической физики, математического анализа и квантовой химии; основные теоретические и полуэмпирические модели, применяемые при решении задач химической направленности

РОПК 1.1 Умеет разрабатывать стратегию научных исследований, составляет общий план и детальные планы отдельных стадий.

РОПК 1.2 Умеет выбирать экспериментальные и расчетно-теоретические методы решения поставленной задачи, используя достижения современной химической науки, и исходя из имеющихся, материальных, информационных и временных ресурсов.

2. Оценочные материалы текущего контроля и критерии оценивания

Элементы текущего контроля:

- устный опрос;
- отчет по лабораторной работе;
- индивидуальное задание

Устный опрос: (РООПК 1.1)

1. Что такое БАС, какими свойствами они обладают?
2. Какой стратегии придерживаются при создании новых лекарственных препаратов?
3. Какова схема разработки нового лекарственного средства?

4. Какие перспективы открывает направленная разработка новых лекарственных препаратов с заранее заданными свойствами?
5. Какими методами получают БАС в настоящее время?
6. Какие методы можно отнести к традиционным, а какие к современным и даже методам будущего?
7. Для каких целей получают БАС?

Устный опрос критерии оценивания:

«зачет» – знание ключевых проблем и основного содержания вопроса, умение оперировать понятиями по своей тематике вопроса, в целом логически корректное, но не всегда точное и аргументированное изложение ответа;

«не зачет» – незнание либо отрывочное представление о материале вопроса, неумение оперировать понятиями дисциплины, неумение логически определенно и последовательно излагать ответ

Отчет по лабораторной работе: (РООПК 1.3, РООПК 2.1, РООПК 2.3, РОПК 1.1, РОПК 1.2)

Перечень тем лабораторных работ:

1. Синтез гликолурила, очистка и идентификация;
2. Синтез аллантаина, очистка и идентификация;
3. Синтез тетра-N-метилгликолурила, очистка и идентификация;
4. Экстракция бетулина из коры березы;
5. Получение аллобетулина – продукта перегруппировки бетулина.

Отчет студента по лабораторной работе должен содержать следующие пункты:

1. Название работы.
2. Цель работы.
3. Краткая теоретическая часть.
4. Приборы и реактивы.
5. Схема синтеза.
6. Расчетная часть.
7. Краткое описание установки.
8. Вывод.
9. Вопросы и задания.

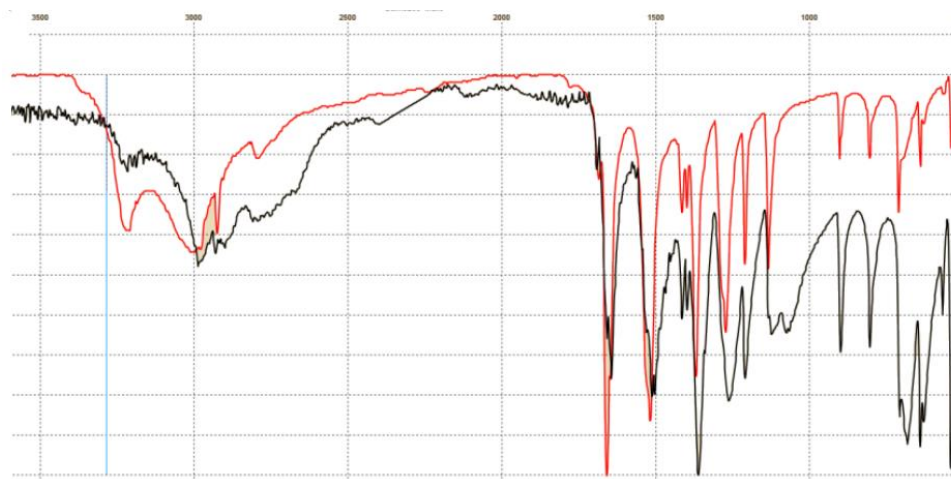
Индивидуальное задание (РООПК 1.1, РООПК 1.2, РООПК 3.1) состоит из двух заданий: 1 теоретический вопрос и 1 задача.

Примеры теоретических вопросов:

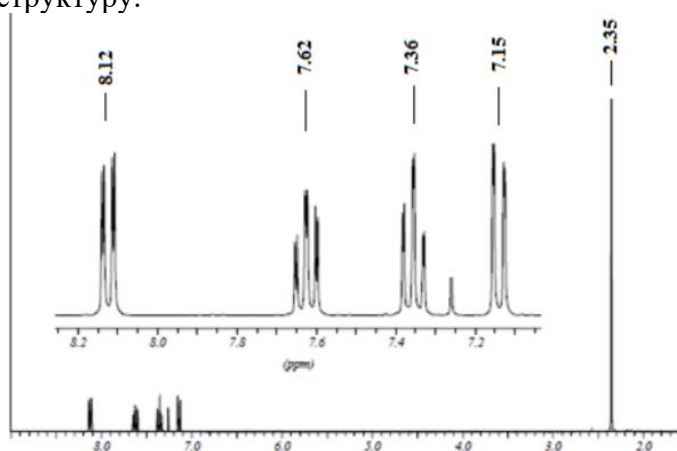
1. Как осуществляется поиск новых источников БАС?
2. Как связаны химическая структура вещества с его биологическим действием?

Примеры задач:

1. Была проведена реакция с применением 2-амино-4-тиазолинона в качестве субстрата. По окончанию реакции записали ИК-спектр выделенного соединения, который наложили на спектр-образец вещества – 2-амино-4-тиазолинона. Определите, был ли модифицирован субстрат, ответ аргументируйте.



2. Ароматическому лекарственному соединению с брутто-формулой $C_9H_8O_4$ соответствуют нижеприведенные спектры ИК и ЯМР (растворитель $CDCl_3$). Определите его структуру.



Спектр ЯМР 1H

Оценочные материалы в полном объеме содержатся в электронном учебном курсе на платформе MOODLE <https://moodle.tsu.ru/course/view.php?id=33430>

3. Оценочные материалы итогового контроля (промежуточной аттестации) и критерии оценивания

3.1 Порядок проведения экзамена

Экзамен в седьмом семестре проводится в письменной форме по билетам.

Экзаменационный билет состоит из трех частей. Продолжительность экзамена 1,5 часа.

Билет состоит из трех вопросов: 2 теоретических вопроса и 1 задача. Продолжительность зачета 1,5 часа. Каждый теоретический вопрос оценивается в 5 баллов, а задача – 10 баллов. Максимальный балл – 20.

Два теоретических вопроса проверяют РООПК 1.1, РООПК 1.2, РООПК 2.2, РОПК 1.1. Задача проверяет ОПК-3, РООПК 1.2, РООПК 3.1, РОПК 1.2.

3.2 Примеры экзаменационных билетов

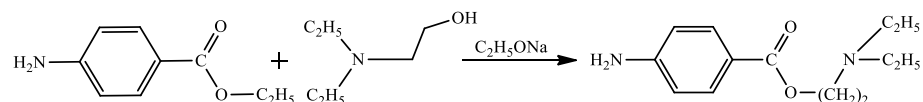
Билет 1

1. В синтезе ряда лекарственных препаратов в химико-фармацевтической промышленности используется каталитический метод хлорирования молекулярным

хлором ароматических соединений. Укажите какой из нижеприведенных катализаторов применяется для эффективного синтеза *p*-хлортолуола при хлорировании молекулярным хлором толуола:

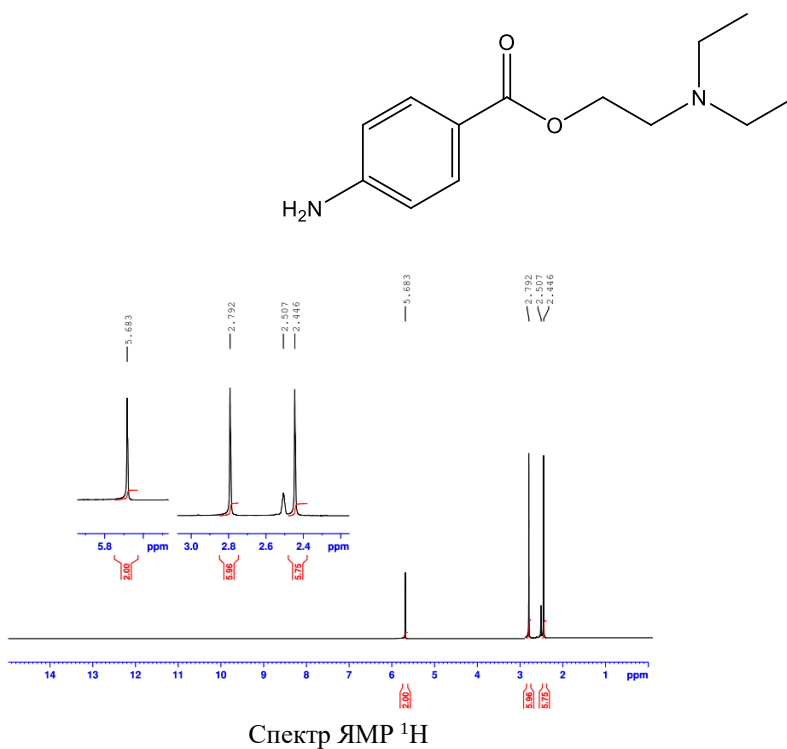
- A. H_2SO_4
- B. ZnCl_2
- C. Графит(сажа)
- D. Fe
- E. BF_3

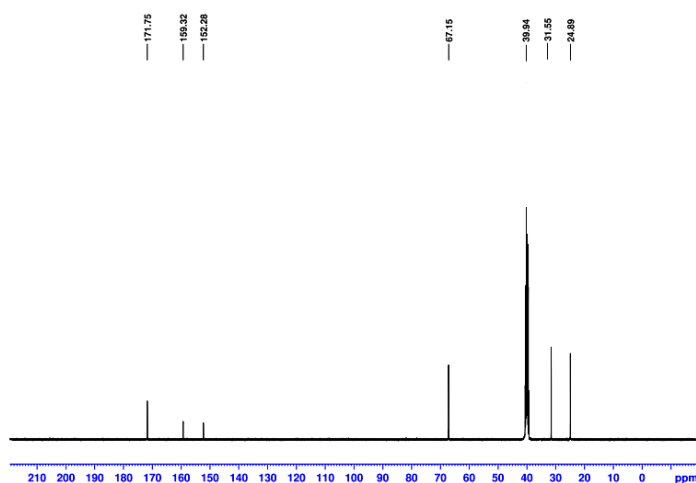
2. В терапевтической практике широко применяется лекарственный препарат Новокаин (Диэтиламино)-этил-4-аминобензоат анестетического действия, схема синтеза которого приведена ниже.



К какому типу химических реакций относится этот процесс? Приведите механизм этой реакции и какие методы идентификации новокаина Вы можете предложить.

3. На основании данных ИК - и ЯМР - спектров сделайте вывод о чистоте субстанции новокаина

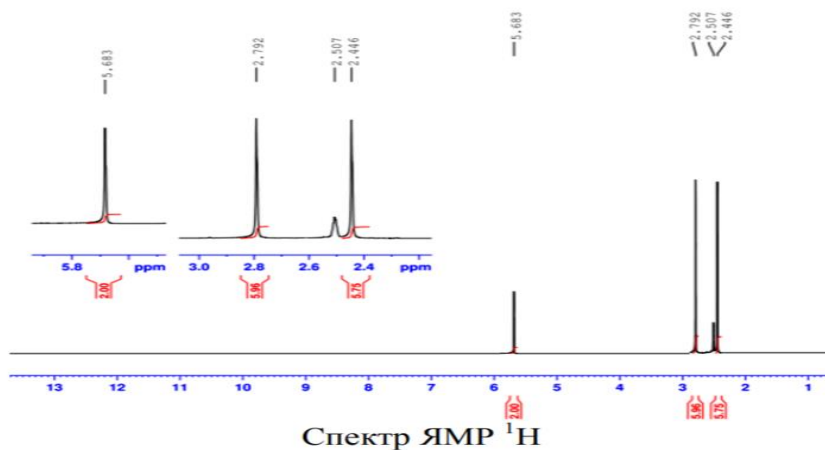




Спектр ЯМР ^{13}C

Билет 7

- Какие преимущества имеются у терапевтических лекарственных систем?
- Образование фиолетового раствора со спиртовым раствором хлорида железа (III) свидетельствует о наличии в структуре парацетамола
 - спиртовой гидроксильной группы
 - карбоксильной группы
 - амидной группы
 - фенольной гидроксильной группы.
- Соотнесите ПМР-спектры (растворитель DMSO-d_6) новокаина с его структурной формулой. Используя шкалы химических сдвигов, предположите какие сигналы могут наблюдаться в спектре ЯМР ^{13}C для данного препарата. Ответ аргументируйте.



Спектр ЯМР ^1H

3.3. Критерии оценивания

Результаты дисциплины определяются оценками «отлично», «хорошо», «удовлетворительно», «неудовлетворительно».

1 и 2 вопросы в билете оцениваются 5 баллов, 3 вопрос – 10. Максимальная сумма баллов за 3 вопроса – 20 баллов. Учитывается полнота и содержание ответа.

Оценка «отлично»: студент набрал 17-20 баллов.

Оценка «хорошо»: студент набрал 14-16 баллов.

Оценка «удовлетворительно»: студент набрал 10-15 баллов.

Оценка «неудовлетворительно»: студент набрал 9 и менее баллов.

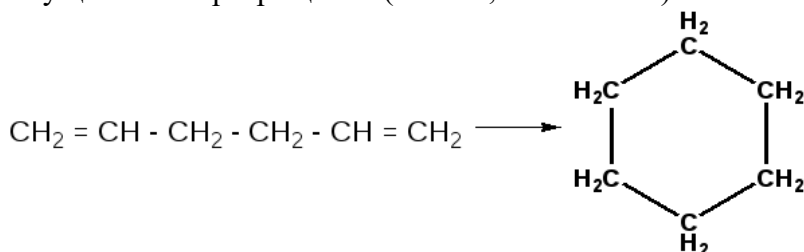
4. Оценочные материалы для проверки остаточных знаний (сформированности компетенций)

Тест

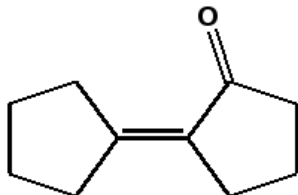
1. Требования, предъявляемые к методикам анализа (ОПК-2, РООПК 2.2):
 - 1) воспроизводимость и правильность
 - 2) чувствительность
 - 3) избирательность (специфичность)
 - 4) унификация
 - 5) определение фармакологически активного лекарственного вещества
2. В основные задачи фармацевтической химии входят (РООПК 1.1):
 - 1) организация управления фармацевтической службы
 - 2) поиск и создание лекарственных средств
 - 3) изучение флоры лекарственных растений
 - 4) изготовление лекарств аптечного и заводского производства
 - 5) осуществление контроля качества лекарственных средств

Задачи

1. Осуществите превращения (ОПК-2, РООПК 2.1).



2. Предложите синтетический путь получения соединения (ОПК-2, РООПК 2.1, РОПК 1.1)



3. Приведите реакции (отразив механизм) получения антибактериального препарата на основе пара-аминобензолсульфаниламида. (РОПК 1.1)
 4. Рассчитайте объем 0,1 М раствора серебра нитрата, который будет затрачен на титрование 1 мл лекарственного препарата: Раствора натрия бромида 0,5% 200,0 мл; Кофеина-бензоата натрия 0,5. (ОПК-3, ПК-1, РООПК 3.1)
 5. Количественное определение фармацевтической субстанции «Argenti nitras» по фармакопейной статье проводят следующим образом: около 0,3 г препарата (точная навеска) растворяют в 50 мл воды, прибавляют 5 мл разведенной азотной кислоты и титруют 0,1 М раствором аммония тиоцианата (индикатор – железоаммониевые квасцы). Серебра нитрата в фармацевтической субстанции должно быть не менее 99,75 %. (РООПК 1.2, РООПК 1.3, РООПК 3.1)
- ✓ Рассчитайте массовую долю фармацевтической субстанции в процентах, если навеска анализируемого образца 0,3026 г, М.м. серебра нитрата 169,87, объем раствора аммония тиоцианата ($K = 0,99$), пошедшего на титрование – 18,0 мл.
- ✓ На основе полученных данных сделайте заключение о соответствии исследуемого образца требованиям ФС.

Теоретические вопросы

1. Источники получения лекарственных средств – химический синтез, выделение из животных и растительных объектов, биотехнологические методы. Показать на примере тиреоидина, ампициллина, фенола. (ОПК-2, РООПК 1.1, РОПК 1.1)
2. Основные этапы поиска новых потенциальных лекарств. (РООПК 1.3)

Информация о разработчиках

Бакибаев Абдигали Абдиманатович, д-р. хим. наук, профессор кафедры природных соединений, фармацевтической и медицинской химии Национального исследовательского Томского государственного университета.

Разгуляева Юлия Дмитриевна, САЕ «Умные материалы и технологии» Национального исследовательского Томского государственного университета, ассистент.