

МИНИСТЕРСТВО НАУКИ И ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ  
федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение  
высшего образования  
«Тольяттинский государственный университет»

Б1.В.ДВ.03.01  
(индекс дисциплины)

**РАБОЧАЯ ПРОГРАММА ДИСЦИПЛИНЫ**

Ретросинтетический анализ

(наименование дисциплины)

по направлению подготовки  
04.03.01 Химия

направленность (профиль)  
Медицинская и фармацевтическая химия

Форма обучения: очная

Год набора: 2026

Общая трудоемкость: 5 ЗЕ

**Распределение часов дисциплины по семестрам**

Семестр	7	Итого
Форма контроля	зачет	
Вид занятий		
Лекции	16	<b>16</b>
Лабораторные	96	<b>96</b>
Практические		
Руководство: курсовые работы (проекты) / РГР		
Промежуточная аттестация	0,25	<b>0,25</b>
Контактная работа	112,25	<b>112,25</b>
Самостоятельная работа	67,75	<b>67,75</b>
Контроль		
<b>Итого</b>	<b>180</b>	<b>180</b>

Рабочую программу составил(и):

доцент, Бунев А.С.  
доцент, к.х.н., Варакина Е.В.

---

(должность, ученое звание, степень, Фамилия И.О.)

Рецензирование рабочей программы дисциплины:



Отсутствует



Рецензент

---

(должность, ученое звание, степень, Фамилия И.О.)

Рабочая программа дисциплины составлена на основании ФГОС ВО и учебного плана  
направления подготовки

04.03.01 Химия

---

**Срок действия рабочей программы дисциплины до «31» августа 2030 г.**

УТВЕРЖДЕНО

На заседании Центра медицинской химии  
(протокол заседания № 1 от «28» августа 2025 г.).

### 1. Цель освоения дисциплины

Цель – формирование системных знаний об основных методологических подходах органического синтеза, используемых в полном синтезе сложных органических и природных соединений.

### 2. Место дисциплины в структуре ОПОП ВО

Дисциплины и практики, на освоении которых базируется данная дисциплина: «Органическая химия и основы органического синтеза», «Химия гетероциклических соединений».

Дисциплины и практики, для которых освоение данной дисциплины необходимо как предшествующее: «Медицинская химия 2, 3», «Основы молекулярного моделирования биологически активных соединений», «Производственная практика (преддипломная практика)», «Подготовка к процедуре защиты и процедура защиты ВКР».

### 3. Планируемые результаты обучения

Формируемые и контролируемые компетенции (код и наименование)	Индикаторы достижения компетенций (код и наименование)	Планируемые результаты обучения
ПК-2 Способен планировать и осуществлять направленный синтез органических соединений с высоким уровнем молекулярной сложности с применением современных подходов асимметрического, атом-эффективного синтеза, а также методологии современного ретросинтетического анализа под руководством специалиста более высокой квалификации	ПК-2.1 Планирует и осуществляет асимметрический и атом-эффективный синтез органических соединений.	Знать: - Основные защитные группы, используемые в органическом синтезе. - Основные виды моно- и бифункциональных ретронов.
		Уметь: - Выделять в молекуле реакционные центры. - Сопоставлять каждому ретрону соответствующий синтон.
		Владеть: - Методиками выбора оптимальных схем синтеза задан. - Основными методами введения защитных групп.
	ПК-2.2 Владеет методологией ретросинтетического анализа и использует её для решения поставленных задач НИР.	Знать: - Основные понятия ретросинтетического анализа. - Основные методики анализа кинетических, термодинамических и других экспериментальных данных (в химическом эксперименте). Уметь: - Использовать основные трансформы в ретросинтетическом анализе.

Формируемые и контролируемые компетенции (код и наименование)	Индикаторы достижения компетенций (код и наименование)	Планируемые результаты обучения
		Владеть: - Основными методами трансформации функциональных групп. - Ретронным подходом.
	ПК-2.3 Предлагает и реализует методику стереоселективного синтеза органического соединения заданной структуры, в том числе используя подходы ретросинтетического анализа для решения поставленных задач НИР.	Знать: - Основные ретросинтетические подходы используемые в ряде классических полных синтезов
		Уметь: - Использовать основные подходы к созданию а,b-ретрону. - Интерпретировать экспериментальные данные на основе системного анализа (природа реагирующих веществ, структура-свойства и др.)- Владеть: - Основными методологическими подходами, базирующими на глубоких теоретических знаниях о механизмах и реакционной способности органических соединений, интерпретации экспериментальных результатов.

#### 4. Структура и содержание дисциплины

Модуль (раздел)	Вид учебной работы	Наименование тем занятий (учебной работы)	Семестр	Объем, ч.	Баллы	Интерактив, ч.	Формы текущего контроля (наименование оценочного средства)
Модуль 1.	Лек 1	Защитные группы в органическом синтезе	7	2	-	-	-
	Лаб 1	Получение TMS-циклогексанола	7	6	-	-	-
	Лаб 2	Получение Вос-бензиламина	7	6	-	-	-
	Лаб 3	Получение тиазолсодержащей аминокислоты на основе аспарагина. Часть 1	7	6	-	-	-
	Ср	Изучение лекционного материала и оригинальной литературы	7	5	-	-	-
	Лек 2	Основные понятия ретросинтетического анализа	7	2	-	-	-
	Лаб 4	Получение тиазолсодержащей аминокислоты на основе аспарагина. Часть 2	7	6	-	-	-
	Ср	Изучение лекционного материала и оригинальной литературы	7	5	-	-	-

Модуль (раздел)	Вид учебной работы	Наименование тем занятий (учебной работы)	Семестр	Объем, ч.	Баллы	Интерактив, ч.	Формы текущего контроля (наименование оценочного средства)
	Лек 3	Ретроны, предполагающие расчленение двух связей углерод-гетероатом (X, Y-ретроны)	7	2	-	-	-
	Лаб 5	Получение тиазолсодержащей аминокислоты на основе аспарагина. Часть 3	7	6	25	-	Контрольная работа №1
	Лаб 6	Получение 1-бром-1-изопропилциклогексанола. Часть 1	7	6	-	-	-
	Лаб 7	Получение 1-бром-1-изопропилциклогексанола. Часть 2	7	6	-	-	-
	Ср	Изучение лекционного материала и оригинальной литературы	7	5	-	-	-
	Лек 4	Ретроны, предполагающие расчленение связей углерод-углерод и углерод-гетероатом. Бифункциональные ретроны с одной связью углерод-гетероатом	7	2	-	-	-
	Лаб 8	Получение 1-бром-1-изопропилциклогексанола. Часть 3	7	6	-	-	-

Модуль (раздел)	Вид учебной работы	Наименование тем занятий (учебной работы)	Семестр	Объем, ч.	Баллы	Интерактив, ч.	Формы текущего контроля (наименование оценочного средства)
	Лаб 9	Синтез азепаана	7	6	25	-	Контрольная работа №2
	Ср	Изучение лекционного материала и оригинальной литературы	7	5	-	-	-
	Лек 5	Ретрон Дильса-Альдера	7	2	-	-	Коллоквиум
	Лаб 10	Получение аддуктов на основе циклопентадиена. Часть 1	7	6	-	-	-
	Ср	Изучение лекционного материала и оригинальной литературы	7	5	-	-	-
	Лек 6	Бифункциональные ретроны, предполагающие расчленение одной связи углерод-углерод (1, n-ретроны)	7	2	-	-	-

Модуль (раздел)	Вид учебной работы	Наименование тем занятий (учебной работы)	Семестр	Объем, ч.	Баллы	Интерактив, ч.	Формы текущего контроля (наименование оценочного средства)
	Лаб 11	Получение аддуктов на основе циклопентадиена. Часть 2	7	6	-	-	-
	Лаб 12	Получение аддуктов на основе циклопентадиена. Часть 3	7	6	-	-	-
	Ср	Изучение лекционного материала и оригинальной литературы	7	5	-	-	-
	Лек 7	Расчленение С-С-связи на базе бифункциональных соединений: 1, 2-, 1, 3-, 1, 4-, 1, 5- и 1, 6-ретроны	7	2	-	-	-
	Лаб 13	Ретросинтетический анализ сложной структуры и ее 4-стадийный синтез. Часть 1	7	6	25	-	Контрольная работа №3
	Лаб 14	Ретросинтетический анализ сложной структуры и ее 4-стадийный синтез. Часть 2	7	6	25	-	Контрольная работа №4
	Ср	Изучение лекционного материала и оригинальной литературы	7	5	-	-	-



Модуль (раздел)	Вид учебной работы	Наименование тем занятий (учебной работы)	Семестр	Объем, ч.	Баллы	Интерактив, ч.	Формы текущего контроля (наименование оценочного средства)
	Лек 8	Подходы к созданию циклических структур	7	2	-	-	-
	Лаб 15	Ретросинтетический анализ сложной структуры и ее 4-стадийный синтез. Часть 3	7	6	-	-	-
	Лаб 16	Ретросинтетический анализ сложной структуры и ее 4-стадийный синтез. Часть 4	7	6	-	-	-
	Ср	Изучение лекционного материала и оригинальной литературы. Подготовка к зачету	7	32,75	-	-	-
	ПА	Промежуточная аттестация (зачет)	7	0,25	-	-	Вопросы к зачету №1-60
<b>Итого:</b>				<b>180</b>			

## **5. Образовательные технологии**

В процессе изучения дисциплины используется технология традиционного обучения (лекции, лабораторные занятия, самостоятельная работа). В соответствии с ФГОС ВО при изучении этого курса предусмотрены лекционные, лабораторные работы и самостоятельная работа. Лекции и самостоятельная работа направлены на теоретическую подготовку, лабораторные занятия ориентированы на практическую подготовку студентов.

## **6. Методические указания по освоению дисциплины**

### **Методические рекомендации студенту по изучению дисциплины**

#### **Методические рекомендации по изучению темы**

«Защитные группы в органическом синтезе»

При освоении темы необходимо:

- изучить учебный материал по соответствующему разделу дисциплины, используя лекционный материал и литературу по данной тематике (включая оригинальную литературу, указанную на лекции).

#### **Методические рекомендации по изучению темы**

«Основные понятия ретросинтетического анализа»

При освоении темы необходимо:

- изучить учебный материал по соответствующему разделу дисциплины, используя лекционный материал и литературу по данной тематике (включая оригинальную литературу, указанную на лекции).

#### **Методические рекомендации по изучению темы**

«Ретроны, предполагающие расчленение двух и более связей. Бифункциональные ретроны»

При освоении темы необходимо:

- изучить учебный материал по соответствующему разделу дисциплины, используя лекционный материал и литературу по данной тематике (включая оригинальную литературу, указанную на лекции).

#### **Методические рекомендации по изучению темы**

«Бифункциональные ретроны на основе двух связей углерод-гетероатом: 1,1- и 1,2-ретроны, их сведение к ацетальм, эпоксидам и карбонильным соединениям»

При освоении темы необходимо:

- изучить учебный материал по соответствующему разделу дисциплины, используя лекционный материал и литературу по данной тематике (включая оригинальную литературу, указанную на лекции).

#### **Методические рекомендации по изучению темы**

«Расчленение 1,3-Х,У-ретрона»

При освоении темы необходимо:

- изучить учебный материал по соответствующему разделу дисциплины, используя лекционный материал и литературу по данной тематике (включая оригинальную литературу, указанную на лекции).

#### **Методические рекомендации по изучению темы**

«Ретрон Дильса-Альдера»

При освоении темы необходимо:

- изучить учебный материал по соответствующему разделу дисциплины, используя лекционный материал и литературу по данной тематике (включая оригинальную литературу, указанную на лекции).

#### **Методические рекомендации по изучению темы**

«Расчленение С-С-связи на базе бифункциональных соединений: 1,2-, 1,3-, 1,4-, 1,5- и 1,6-ретроны»

При освоении темы необходимо:

- изучить учебный материал по соответствующему разделу дисциплины, используя лекционный материал и литературу по данной тематике (включая оригинальную литературу, указанную на лекции).

#### **Методические рекомендации по изучению темы**

«Выдающиеся полные синтезы»

При освоении темы необходимо:

- изучить учебный материал по соответствующему разделу дисциплины, используя лекционный материал и литературу по данной тематике (включая оригинальную литературу, указанную на лекции).

### **7. Оценочные средства**

#### **7.1. Паспорт оценочных средств**

Семестр	Код контролируемой компетенции (или ее части)	Наименование оценочного средства
7	ПК-2	Контрольные работы №№1-4 Вопросы к коллоквиуму №№1-30 Вопросы к зачету №№1-60

#### **7.2. Типовые задания или иные материалы, необходимые для текущего контроля**

##### **7.2.1. Контрольная работа**

##### **Типовые примеры заданий**

##### **Задача 1**

Укажите продукты для нижеприведенных химических реакций.

##### **Задача 2**

Изобразите структурные формулы для следующих соединений: MEMCl, BocCl, TIPSCl, TMSCl, FmocCl, TBDPSOTf, NAPCl

##### **Задача 3**

В чем заключается сущность подхода активации карбоновой кислоты через образование её хлорангидрида. Для защиты каких функциональных групп может данный подход использоваться? Приведите примеры. **ВАЖНО!** На данный вопрос дайте как можно более развернутый ответ.

##### **Задача 4**

Перерисуйте нижеприведенную формулу изобразив сокращения защитных групп в виде соответствующего фрагмента структурной формулы. Для хиральных центров определите относительную конфигурацию.

#### **Задача 5**

Изобразите структурные формулы продуктов А, В, С в нижеприведённой цепочке превращений.

#### **Вариант 9**

##### **Задача 1**

Укажите продукты для нижеприведенных химических реакций.

##### **Задача 2**

Изобразите структурные формулы для следующих соединений: TESCl, DMAP, DCC, CDI,  $\text{Boc}_2\text{O}$ , PMBCl, TrCl, TBSCl.

##### **Задача 3**

В чем заключается сущность подхода активации карбоновой кислоты с помощью реагентов Кори и Мукамы. Для защиты каких функциональных групп может данный подход использоваться? Приведите примеры. **ВАЖНО!** На данный вопрос дайте как можно более развернутый ответ.

##### **Задача 4**

Перерисуйте нижеприведенную формулу изобразив сокращения защитных групп в виде соответствующего фрагмента структурной формулы. Для хиральных центров определите относительную конфигурацию.

##### **Задача 5**

Изобразите структурные формулы продуктов А, В, С в нижеприведённой цепочке превращений.

#### **Вариант 10**

##### **Задача 1**

Проведите ретросинтетический анализ целевой молекулы и предложите схему синтеза ТМ на основе заданного исходного соединения.

#### **Вариант 11**

##### **Задача 1**

Проведите ретросинтетический анализ целевой молекулы и предложите схему синтеза ТМ на основе заданного исходного соединения.

#### **Критерии оценки:**

Максимальное количество баллов за каждую контрольную 25 баллов, всего за семестр 100 баллов. Допуском к зачету является набор студентом более 75 баллов:

- оценка «отлично» (25 баллов) выставляется студенту, если студент выполняет все задания контрольной работы без ошибок;
- оценка «хорошо» (20 баллов) выставляется студенту, если студент допускает ошибку в одном из заданий контрольной работы;
- оценка «удовлетворительно» (15 баллов) выставляется студенту, если студент допускает ошибку в двух и более заданиях, но при этом правильно решает одно задание контрольной работы;

- оценка «неудовлетворительно» (0 баллов) выставляется студенту, если студент не выполняет ни одного задания контрольной работы, либо же в ответе на каждое задание контрольной работы допущена ошибка.

### 7.2.2. Вопросы к коллоквиуму

№ п/п	Вопросы к коллоквиуму
1	Защита HO-группы в спиртах. Ацетильная, пивалоильная, бензильная (Bn), <i>n</i> -метоксибензильная (PMB) и тетрагидропиранильная (THP) группы. Особенности удаления Bn- и PMB- защитных групп. Сравнение устойчивости этих защитных групп по отношению к окислителям, Li-, Mg-органическим соединениям, алюмогидриду лития и к гидролизу.
2	Кремнийорганические защитные группы: триметилсилильная (TMS), <i>трет</i> -бутилдиметилсилильная (TBS). Сравнение устойчивости этих защитных групп по отношению к окислителям, Li-, Mg-органическим соединениям, алюмогидриду лития и к гидролизу.
3	Ретросинтетический анализ циклов. Первичные циклы и “конверт” полициклических систем. Расчленения по стратегическим связям. Кинетические и термодинамические факторы, способствующие реакциям циклизации. Внутримолекулярные конденсации карбонильных соединений, приводящие к циклизации. Запрет Бредта.
4	Тактика анализа трехчленных циклов на базе диазоалканов, илидов серы (Кори-Чайковский) и реакции диметилсульфоксоний-метилида с $\alpha,\beta$ -енонами.
5	Металлы платиновой группы в качестве катализаторов гидрирования: оксид платины (катализатор Адамса), палладиевые катализаторы Линдлара и Розенмунда, никель Ренея. Приготовление этих катализаторов. Гидрирование кратных связей, его регио- и стереоселективность. Представление о механизме гидрирования, понятие о гаптофильности. Гидрогенолиз связей углерод-гетероатом и гетероатом-гетероатом. Каталитические яды.
6	Создание спирановых карбоциклических систем на основе пинаколиновой перегруппировки и перегруппировки спиро-эпоксидов в циклобутаноны (Б. Трост).
7	1,2-Ретрон в $\beta$ -аминоспиртах и в $\alpha$ -аминокислотах. Анализ этого ретрона путем перехода к 1,1-ретрону на основе эпоксидов, реакций Анри, Штреккера, циангидринного синтеза. Варианты синтеза 1-(нитрометил)циклогексанола.
8	Внешнее расчленение C3-монокарбонильного ретрона: трансформ Михаэля. Синтез 3-диалкиламинопропанолов, 3-алкоксипропиламинов и реагента Бюхи (этиленацеталь 3-бромпропионового альдегида). Магнийорганическое соединение на основе реагента Бюхи и его использование в синтезе.
9	Диизобутилалюминий-гидрид (ДИБАЛ-Н), его получение в промышленности. Гидроалюминирование кратных связей углерод-углерод с помощью ДИБАЛ-Н. Обратимость и стереоселективность гидроалюминирования. Превращения продуктов гидроалюминирования связи $C\equiv C$ под действием электрофильных агентов.
10	Восстановление нитрилов, сложных эфиров и $\alpha,\beta$ -енонов с помощью ДИБАЛ-Н. Зависимость результата реакции от температуры и соотношения реагентов.
11	Синтоны, возникающие при внутреннем расчленении 1,2-бифункционального ретрона: “логичный” (естественный) и “нелогичный” (неестественный). Концепция “Umpolung”. Генерирование ацил-анионов при низкой температуре, их нестабильность и методы фиксации.
12	Реализация Umpolung в бензоиновой конденсации и реакции Штеттера. Синтетические эквиваленты ацил-анионов: литиевые производные 1,3-дитианов и

	1,3,5-третианов, анионы алкинов-1 и соли аци-форм 1-нитроалканов.
13	Комплексные гидриды металлов как восстановители: борогидрид натрия, цианоборогидрид натрия, алюмогидрид лития, алкокси-алюмогидриды. Механизмы восстановления карбонильных соединений алюмогидридом лития и борогидридом натрия. Хемоселективность восстановления карбонильной группы комплексными алкоксигидридами алюминия.
14	Восстановительное алкилирование аминов с использованием цианоборогидрида натрия в кислой среде. Восстановление $\alpha,\beta$ -енонов борогидридом натрия в присутствии трихлорида церия (Luche). Борогидрид цинка, его получение и использование для восстановления $\alpha,\beta$ -енонов.
15	Планирование многостадийного синтеза: линейная и конвергентная схемы. Целевая молекула (ТМ), трансформ, синтон, ретрон. Соответствие синтонов и реагентов. Ретроны частичные и полные. Примеры ретронов. Концепция формального альтернирования зарядов в насыщенной алкильной цепи, содержащей на одном из концов акцепторный заместитель (Д. Зеебах).
16	Синтоны «логичные» и «нелогичные». Синтетические эквиваленты ацил-анионов (органические производные серы, анионы алкинов-1 и соли аци-форм 1-нитроалканов).
17	Окисление спиртов с помощью диметилсульфоксида по Сверну (трифторуксусный ангидрид, оксалилхлорид). Взаимодействие непредельных карбоновых кислот с галогеном в присутствии основания (бromo- и иодолактонизация).
18	Синтез эпоксидов из алкенов. Регенты для эпоксидирования: надуксусная, трифторнадуксусная и м-хлорнадбензойная (МСРВА) кислоты. Особенности эпоксидирования непредельных кетонов. Отношение альдегидов к надкислотам.
19	Анализ одноатомных спиртов: C1-, C2- и C3-ретроны. Подходы к созданию этих ретронов. Анализ и синтез “спирта листьев” (цис-гексен-3-ол-1). Трансформ Михаэля в анализе монокарбонильного ретрона. Анализ и синтез нуциферала.
20	Получение и строение литий-диорганокупратов. Гомокупраты Гилмана. Гетерокупраты на основе алкилацетиленидов, алкоксидов и тиолятов меди. Их получение и использование в синтезе. Стереоселективность сочетания органокупратов с 1-алкенилгалогенидами.
21	Реакции органокупратов с галогенопроизводными различных типов, ацилгалогенидами, оксиранами, $\alpha,\beta$ -непредельными альдегидами и кетонами, с терминальными алкинами (карбокуприрование). Проведение реакций с органокупратами в каталитическом варианте.
22	Стереохимия реакции Дильса-Альдера, эндо-правило. Катализ в реакции Дильса-Альдера: влияние протонных кислот и кислот Льюиса на энергию граничных орбиталей. Сочетание трансформ Дильса-Альдера и трансформ “сочленение” (R) как одна из тактик анализа 1,6-дикарбонильного ретрона на примере лактона Эшенмозера.
23	Реакция Виттига как региоселективный метод синтеза алкенов. Илиды фосфора, их получение. Примеры стабилизированных, полустабилизированных и нестабилизированных илидов. Природа связи фосфор-углерод в илидах ( $p-\sigma^*$ -стабилизация). Гидролиз илидов. Механизм реакции Виттига. Сравнение реакционной способности стабилизированных и нестабилизированных илидов.
24	Сведение 1,4-дикарбонильного ретрона к производным фурана. Анализ и синтез цис-жасмона.
25	Генерирование енолятов из кетонов, $\alpha,\beta$ -енонов, силиловых эфиров енолов. Региоселективность процесса енолизации кетонов. Использование формильных (гидроксиметиленовых) производных для региоселективного алкилирования кетонов. Направленная альдольная конденсация с помощью енолятов лития.
26	Конденсация силиловых эфиров енолов с альдегидами и кетонами (Мукаяма).

	Направленная конденсация альдегидов с использованием оснований Шиффа (метод Виттига).
27	Реакция Дильса-Альдера как согласованный процесс [4+2]-циклоприсоединения. Диен и диенофил. Подходы к описанию реакции на основе анализа: 1) граничных орбиталей реагентов и 2) топологии базисного набора орбиталей реагентов. Типы реакции Дильса-Альдера: карбо-реакция, гетеро-реакция. Региоселективность этих реакций.
28	Ретро-реакция Дильса-Альдера. Примеры реакций. о-Хинодиметаны в качестве диенов, их генерирование из бензоциклобутенов и использование во внутримолекулярных процессах [4+2]-циклоприсоединения.
29	Конденсация по Михаэлю. Механизм реакции. Региоселективность присоединения нуклеофилов к $\alpha,\beta$ -непредельным карбонильным соединениям (1,2- или 1,4-присоединение). Доноры и акцепторы Михаэля. Катализаторы реакции, ее обратимость. Региоселективность реакции несимметричных кетонов. Использование енаминов в качестве доноров Михаэля.
30	Основания Манниха и $\beta$ -хлоркетоны как синтетические эквиваленты акцепторов Михаэля. Синтез $\beta$ -хлоркетонов реакцией Кондакова.

### Критерии оценки:

Оценка «отлично» соответствует 0 баллов, и является допуском к зачету, если даны правильные ответы на поставленные вопросы.

Оценка «хорошо» соответствует (-10) баллов, если в ответах содержатся небольшие недочёты, и является допуском к зачету.

Оценка «удовлетворительно» соответствует (-20) баллов, если в некоторых ответах содержатся существенные ошибки, и является допуском к зачету.

Оценка «неудовлетворительно» соответствует (-40) баллов, если студент в целом не готов к коллоквиуму, но знаком с некоторыми терминами и определениями. Студент к зачету не допускается.

### 7.3. Оценочные средства для промежуточной аттестации по итогам освоения дисциплины

К зачету допускаются студенты, набравшие в общей сложности 75 и более баллов.

#### 7.3.1. Вопросы к промежуточной аттестации

Семестр 7

№ п/п	Вопросы к зачету
1	Защита НО-группы в спиртах. Ацетильная, пивалоильная, бензильная (Bn), <i>n</i> -метоксибензильная (PMB) и тетрагидропиранильная (THP) группы. Особенности удаления Bn- и PMB- защитных групп. Сравнение устойчивости этих защитных групп по отношению к окислителям, Li-, Mg-органическим соединениям, алюмогидриду лития и к гидролизу.
2	Кремнийорганические защитные группы: триметилсилильная (TMS), <i>трет</i> -бутилдиметилсилильная (TBS). Сравнение устойчивости этих защитных групп по отношению к окислителям, Li-, Mg-органическим соединениям, алюмогидриду лития и к гидролизу.
3	Ретросинтетический анализ циклов. Первичные циклы и “конверт” полициклических систем. Расчленения по стратегическим связям. Кинетические и

	термодинамические факторы, способствующие реакциям циклизации. Внутримолекулярные конденсации карбонильных соединений, приводящие к циклизации. Запрет Бредта.
4	Тактика анализа трехчленных циклов на базе диазоалканов, илидов серы (Кори-Чайковский) и реакции диметилсульфоксоний-метилюда с $\alpha,\beta$ -енонами.
5	Металлы платиновой группы в качестве катализаторов гидрирования: оксид платины (катализатор Адамса), палладиевые катализаторы Линдлара и Розенмунда, никель Ренея. Приготовление этих катализаторов. Гидрирование кратных связей, его регио- и стереоселективность. Представление о механизме гидрирования, понятие о гаптофильности. Гидрогенолиз связей углерод-гетероатом и гетероатом-гетероатом. Каталитические яды.
6	Создание спиранных карбоциклических систем на основе пинаколиновой перегруппировки и перегруппировки спиро-эпоксидов в циклобутаноны (Б. Трост).
7	1,2-Ретрон в $\beta$ -аминоспиртах и в $\alpha$ -аминокислотах. Анализ этого ретрона путем перехода к 1,1-ретрону на основе эпоксидов, реакций Анри, Штреккера, циангидринного синтеза. Варианты синтеза 1-(нитрометил)циклогексанола.
8	Внешнее расчленение C3-монокарбонильного ретрона: трансформ Михаэля. Синтез 3-диалкиламинопропанолов, 3-алкоксипропиламинов и реагента Бюхи (этиленацеталь 3-бромпропионового альдегида). Магнийорганическое соединение на основе реагента Бюхи и его использование в синтезе.
9	Диизобутилалюминий-гидрид (ДИБАЛ-Н), его получение в промышленности. Гидроалюминирование кратных связей углерод-углерод с помощью ДИБАЛ-Н. Обратимость и стереоселективность гидроалюминирования. Превращения продуктов гидроалюминирования связи $C\equiv C$ под действием электрофильных агентов.
10	Восстановление нитрилов, сложных эфиров и $\alpha,\beta$ -енонов с помощью ДИБАЛ-Н. Зависимость результата реакции от температуры и соотношения реагентов.
11	Синтоны, возникающие при внутреннем расчленении 1,2-бифункционального ретрона: “логичный” (естественный) и “нелогичный” (неестественный). Концепция “Umpolung”. Генерирование ацил-анионов при низкой температуре, их нестабильность и методы фиксации.
12	Реализация Umpolung в бензоиновой конденсации и реакции Штеттера. Синтетические эквиваленты ацил-анионов: литиевые производные 1,3-дитианов и 1,3,5-трיתיанов, анионы алкинов-1 и соли аци-форм 1-нитроалканов.
13	Комплексные гидриды металлов как восстановители: борогидрид натрия, цианоборогидрид натрия, алюмогидрид лития, алкокси-алюмогидриды. Механизмы восстановления карбонильных соединений алюмогидридом лития и борогидридом натрия. Хемоселективность восстановления карбонильной группы комплексными алкоксигидридами алюминия.
14	Восстановительное алкилирование аминов с использованием цианоборогидрида натрия в кислой среде. Восстановление $\alpha,\beta$ -енонов борогидридом натрия в присутствии трихлорида церия (Luche). Борогидрид цинка, его получение и использование для восстановления $\alpha,\beta$ -енонов.
15	Планирование многостадийного синтеза: линейная и конвергентная схемы. Целевая молекула (ТМ), трансформ, синтон, ретрон. Соответствие синтонов и реагентов. Ретроны частичные и полные. Примеры ретронов. Концепция формального альтернирования зарядов в насыщенной алкильной цепи, содержащей на одном из концов акцепторный заместитель (Д. Зеебах).
16	Синтоны “логичные” и “нелогичные”. Синтетические эквиваленты ацил-анионов (органические производные серы, анионы алкинов-1 и соли аци-форм 1-нитроалканов).
17	Окисление спиртов с помощью диметилсульфоксида по Сверну (трифторуксусный



	ангидрид, оксалилхлорид). Взаимодействие непредельных карбоновых кислот с галогеном в присутствии основания (бromo- и иодолактонизация).
18	Синтез эпоксидов из алкенов. Регенты для эпоксидирования: надуксусная, трифторнадуксусная и м-хлорнадбензойная (MCPBA) кислоты. Особенности эпоксидирования непредельных кетонов. Отношение альдегидов к надкислотам.
19	Анализ одноатомных спиртов: C1-, C2- и C3-ретроны. Подходы к созданию этих ретронов. Анализ и синтез “спирта листьев” (цис-гексен-3-ол-1). Трансформ Михаэля в анализе монокарбонильного ретрона. Анализ и синтез нуциферала.
20	Получение и строение литий-диорганокупратов. Гомокупраты Гилмана. Гетерокупраты на основе алкилацетиленидов, алкоксидов и тиолятов меди. Их получение и использование в синтезе. Стереоселективность сочетания органокупратов с 1-алкенилгалогенидами.
21	Реакции органокупратов с галогенопроизводными различных типов, ацилгалогенидами, оксиранами, $\alpha,\beta$ -непредельными альдегидами и кетонами, с терминальными алкинами (карбокуприрование). Проведение реакций с органокупратами в каталитическом варианте.
22	Стереохимия реакции Дильса-Альдера, эндо-правило. Катализ в реакции Дильса-Альдера: влияние протонных кислот и кислот Льюиса на энергию граничных орбиталей. Сочетание трансформ Дильса-Альдера и трансформ “сочленение” (R) как одна из тактик анализа 1,6-дикарбонильного ретрона на примере лактона Эшенмозера.
23	Реакция Виттига как региоселективный метод синтеза алкенов. Илиды фосфора, их получение. Примеры стабилизированных, полустабильных и нестабилизированных илидов. Природа связи фосфор-углерод в илидах ( $p-\sigma^*$ -стабилизация). Гидролиз илидов. Механизм реакции Виттига. Сравнение реакционной способности стабилизированных и нестабилизированных илидов.
24	Сведение 1,4-дикарбонильного ретрона к производным фурана. Анализ и синтез цис-жасмона.
25	Генерирование енолятов из кетонов, $\alpha,\beta$ -енонов, силиловых эфиров енолов. Региоселективность процесса енолизации кетонов. Использование формильных (гидроксиметиленовых) производных для региоселективного алкилирования кетонов. Направленная альдольная конденсация с помощью енолятов лития.
26	Конденсация силиловых эфиров енолов с альдегидами и кетонами (Мукаяма). Направленная конденсация альдегидов с использованием оснований Шиффа (метод Виттига).
27	Реакция Дильса-Альдера как согласованный процесс [4+2]-циклоприсоединения. Диен и диенофил. Подходы к описанию реакции на основе анализа: 1) граничных орбиталей реагентов и 2) топологии базисного набора орбиталей реагентов. Типы реакции Дильса-Альдера: карбо-реакция, гетеро-реакция. Региоселективность этих реакций.
28	Ретро-реакция Дильса-Альдера. Примеры реакций. о-Хинодиметаны в качестве диенов, их генерирование из бензоциклобутенов и использование во внутримолекулярных процессах [4+2]-циклоприсоединения.
29	Конденсация по Михаэлю. Механизм реакции. Региоселективность присоединения нуклеофилов к $\alpha,\beta$ -непредельным карбонильным соединениям (1,2- или 1,4-присоединение). Доноры и акцепторы Михаэля. Катализаторы реакции, ее обратимость. Региоселективность реакции несимметричных кетонов. Использование енаминов в качестве доноров Михаэля.
30	Основания Манниха и $\beta$ -хлоркетоны как синтетические эквиваленты акцепторов Михаэля. Синтез $\beta$ -хлоркетонов реакцией Кондакова.
31	Тактика анализа 1,6-дикарбонильного ретрона на базе енолятов и алкил-3-бромпропилкетонов (синтез этих бромкетонов из $\beta$ -кетозэфиров). Анализ 6-членных

	алициклов на базе трансформов “сочленение” (R) и озонлиза на примере изображенного соединения.
32	Реакции аннелирования. Вариант Робинсона. Побочные процессы в реакциях с $\alpha,\beta$ -енонами и способы сведения их к минимуму. Синтетические эквиваленты $\alpha,\beta$ -енонов: $\beta$ -хлоркетоны (их синтез реакцией Кондакова) и основания Манниха.
33	Енамины в реакциях аннелирования. Аннелирующий реагент Назарова (этиловый эфир 3-оксопентен-4-овой кислоты), его получение и использование в синтезе карбо- и гетероциклических систем. Спиро-аннелирование с помощью дифенилсульфоний-циклопропилида (с перегруппировкой эпоксида).
34	Аллилсиланы. Их получение из магний- и литийорганических соединений. Десилилирование аллилсиланов с перемещением связи C=C при действии электрофильных реагентов.
35	Получение силилированных диенов и их использование в синтезе карбоциклов. Этинилсиланы, их получение. Триметилсилильная защитная группа для связи C-H в терминальных алкинах.
36	1,3-Ретрон в составе дикарбонильных и $\beta$ -гидроксикарбонильных соединений. Трансформы сложноэфирной и альдольно-кетоновой конденсаций, реакций Михаэля, Манниха и Реформатского как тактические приемы, позволяющие проводить внутреннее расчленение 1,3-ретрона.
37	Тактика анализа шестичленных насыщенных гетероциклов на основе сочетания трансформов FGA, конденсации Кляйзена и реакции Михаэля. Примеры синтезов.
38	Оксигенофильность бора и алюминия. Восстановление нитрилов, сложных эфиров и $\alpha,\beta$ -енонов с помощью ДИБАЛ-Н. Зависимость результата реакции от температуры и соотношения реагентов.
39	Расчленения монокетонов. 1,2-Расчленение: “нелогичные” синтоны. 2,3-Расчленение: синтез кетонов через эфиры $\beta$ -кетокислот. Получение эфиров $\beta$ -кетокислот конденсацией сложных эфиров с диэтилкарбонатом и через моноэтиловый эфир малоновой кислоты (получение этого реагента).
40	Тактика FGA на примере анализа 5-бромпентанона-2. Расчленение по связи 3,4: трансформ Михаэля.
41	Анализ 1,4-дикарбонильного ретрона. Варианты Umpolung: применение $\alpha$ -галокарбонильных соединений и 1-нитроалканов (синтез кетонов по Мак-Мурри). Использование трансформа “сочленение” (R) и Tf конденсации при анализе 1,4-бифункциональных соединений.
42	Ретросинтетический анализ метиленомицина А: переход к 1,4-дикарбонильному ретрону и использование $\alpha$ -галокетона. Синтез метиленомицина А (в формуле указана абсолютная конфигурация стереоцентров).
43	Ретросинтетический анализ циклов. Первичные циклы и “конверт” полициклических систем. Расчленения по стратегическим связям. Кинетические и термодинамические факторы, способствующие реакциям циклизации.
44	Сигматропные перегруппировки, их порядок. Супра- и антараповерхностные перемещения. Описание перегруппировки Коупа на основе: 1) анализа граничных орбиталей и 2) анализа топологии базисного набора орбиталей.
45	Синтезы на основе [3,3]-сигматропных перегруппировок: аллиловых эфиров фенолов (Кляйзен) и енолов (Кляйзен-Коуп), 1,5-диенов (Коуп), аллиловых эфиров $\beta$ -кетокислот (Кэрролл). Распознавание ретронов сигматропных перегруппировок.
46	Термические реакции [2+2]-циклоприсоединения, их описание на основе анализа граничных орбиталей реагентов и анализа базисного набора орбиталей реагентов. Синтез кетенов и их реакции [2+2]-циклоприсоединения. Фотохимическое [2+2]-циклоприсоединение. Региоселективность термических и фотохимических реакций: нуклеофильный и электрофильный концы двойной связи.
47	Изопропилиденная, бензилиденная группы и циклические карбонаты в качестве

	защитных групп для гликолей. Условия создания и удаления этих защитных групп, их устойчивость к действию различных реагентов.
48	Защита карбонильной группы в альдегидах и кетонах: циклические ацетали и тиоацетали. Условия введения и удаления защитных групп, их устойчивость к действию различных реагентов.
49	Трет-бутилгидропероксид как эпоксирующий агент. Эпоксидирование аллиловых спиртов. Диастереоселективность реакции в присутствии комплексов ванадия.
50	Энантиоселективное эпоксидирование по Шарплессу (в присутствии изопропилата титана и эфира винной кислоты).
51	Получение эфиров алкилфосфоновых кислот (Михаэлис-Арбузов) и $\beta$ -кетофосфонатов. Синтез алкенов с использованием этих производных фосфора (реакция Хорнера-Уодсворта-Эммонса), а также трифторэтилфосфонатов (реакция Стилла-Геннари). Сравнение областей применения реакций Виттига и Хорнера-Уодсворта-Эммонса.
52	Реакция Михаэля как стратегическая реакция в полном синтезе
53	Эквиваленты ацил-анионов в реакциях образования углерод-углеродной связи: 1,3-дителианы
54	Эквиваленты ацил-анионов в реакциях образования углерод-углеродной связи: ациклические тиоацетали, монооксиды тиоацеталей кетена, трис(арилтио)ортомуравьиный эфир
55	$\alpha$ -Гетероатомные карбанионы в реакциях с карбонильными соединениями. Реакция Петерсона
56	Химия ацетоуксусного и малонового эфиров
57	Методы образования углерод-углеродной связи с использованием катализа комплексами палладия: реакция Хека
58	Методы образования углерод-углеродной связи с использованием катализа комплексами палладия: реакции аллилирования
59	Методы образования углерод-углеродной связи с использованием катализа комплексами палладия: реакции Стилле, Сузуки, Соногаширы
60	Использование ацетиленов в синтезе ациклических соединений. Терминальные ацетилеы как эквиваленты ацетиленид-анионов

### 7.3.2. Критерии и нормы оценки

Семестр	Форма проведения промежуточной аттестации	Критерии и нормы оценки	
7	зачет (устно)	«зачтено»	Студент хорошо владеет материалом и отвечает развернуто на два из трех вопросов перечня вопросов к зачету. Приводит примеры, практическое задание решено полностью с пояснениями.
		«не зачтено»	Студент плохо владеет или не владеет материалом и отвечает лишь на один из трех вопросов перечня вопросов к зачету. Затрудняется приводить примеры, практическое задание не решено или решено с

Семестр	Форма проведения промежуточной аттестации	Критерии и нормы оценки	
			ошибками.

## 8. Учебно-методическое и информационное обеспечение дисциплины

### 8.1. Обязательная литература

№ п/п	Авторы, составители	Заглавие (заголовок)	Тип (учебник, учебное пособие, учебно-методическое пособие, практикум, др.)	Год издания	Количество в научной библиотеке / Наименование ЭБС
1	Панькова, А. С.	Панькова, А. С. Стратегия органического синтеза : учебно-методическое пособие / А.С. Панькова, М.М. Ефремова, Н. В. Ростовский. – 2-е изд. – Санкт-Петербург : СПбГУ, 2021. – 94 с. – ISBN 978-5-288-06245-3.	Учебно-методическое пособие	2021	ЭБС «Znanium»
2	Смит В.А., Дильман А.Д.	Смит, В.А. Основы современного органического синтеза : Учебное пособие / В.А. Смит, А.Д. Дильман – Москва : Лаборатория знаний, 2024. – 746 с. – ISBN 978-5-93208-805-0	Учебное пособие	2024	ЭБС «IPRbooks»

### 8.2. Дополнительная литература

№ п/п	Авторы, составители	Заглавие (заголовок)	Тип (учебник, учебное пособие, учебно-методическое пособие, практикум, др.)	Год издания	Количество в научной библиотеке / Наименование ЭБС
----------	---------------------	----------------------	---	-------------	---

1	Межуев Я.О.	Ретросинтетический анализ в органической химии [Текст] : [в 2 т.] / Я. О. Межуев ; М-во образования и науки Российской Федерации, Российский химико-технологический ун-т им. Д. И. Менделеева. Т. 1. – Москва : Российский химико-технологический ун-т им. Д. И. Менделеева, 2013, 2013. – 252 с. : ил.; ISBN 978-5-7237-1068-9.	Учебное пособие	2013	НЭБ
2	Межуев Я.О.	Ретросинтетический анализ в органической химии [Текст] : [в 2 т.] / Я. О. Межуев ; М-во образования и науки Российской Федерации, Российский химико-технологический ун-т им. Д. И. Менделеева. – Москва : Российский химико-технологический ун-т им. Д. И. Менделеева, 2013. Т. 2. - 2013. - 236 с. : ил.; ISBN 978-5-7237-1069-6	Учебное пособие	2013	НЭБ

### 8.3. Перечень профессиональных баз данных и информационных справочных систем

- Бутлеровские сообщения [Электронный ресурс] : многопредмет. науч. журн. / ООО «Инновационно-издательский дом «Бутлеровское наследие». – Электрон. журнал. – Казань : ООО «Инновационно-издательский дом «Бутлеровское наследие», 1999- . Режим доступа к журн.: <http://butlerov.com/stat/reports/view.asp?lang=ru>
- Химия в интересах устойчивого развития [Электронный ресурс] : междунар. науч. журн. / Сибирское отделение РАН. – Электрон. журнал. – Новосибирск : Издательство СО РАН, 1999- . Режим доступа к журн. <http://www.sibran.ru/journals/Hviur/>
- WebofScience [Электронный ресурс]: мультидисциплинарная реферативная база данных. – Philadelphia: ClarivateAnalytics, 2016 – Режим доступа: [apps.webofknowledge.com](https://apps.webofknowledge.com). – Загл. с экрана. – Яз. рус., англ.
- Scopus [Электронный ресурс]: реферативная база данных. – Netherlands: Elsevier, 2004 – Режим доступа: [scopus.com](https://scopus.com). – Загл. с экрана. – Яз. рус., англ.
- Elibrary [Электронный ресурс]: научная электронная библиотека. – Москва: НЭБ, 2000. – Режим доступа: [elibrary.ru](http://elibrary.ru). – Загл. с экрана. – Яз. рус., англ.
- SpringerLink [Электронный ресурс]: [база данных]. – Switzerland: SpringerNature, 1842. – Режим доступа: [link.springer.com](http://link.springer.com). – Загл. с экрана. – Яз. англ.
- ScienceDirect [Электронный ресурс]: коллекция электронных книг издательства Elsevier. – Netherlands: Elsevier, 2018. – Режим доступа: [sciencedirect.com](https://sciencedirect.com). – Загл. с экрана. – Яз. англ.
- ЭБС «Лань» (права принадлежат ООО «ЭБС ЛАНЬ»), договор № 410 от 19.04.2021 г. с 07.05.2021. по 06.05.2022 (по адресу <http://www.e.lanbook.com>) включает в себя полнотекстовые электронные версии всех книг, вышедших в издательстве, а также коллекции полнотекстовых файлов других издательств. В базе представлены не только учебные издания, но и научная литература, а также словари.
- ЭБС «IPRbooks» (права принадлежат ООО Компания «Ай Пи Ар Медиа»), договор № 620 от 15.06.2021 г. с 01.08.2021 по 01.08.2022 (по адресу <http://www.iprbookshop.ru>) – содержит учебники и учебные пособия, монографии, производственно-практические, справочные издания, а также деловую литературу для практикующих специалистов. В ЭБС включены издания за последние 5 лет по гуманитарным, социальным и экономическим наукам, по остальным отраслям знания – за последние 10 лет.

### 8.4. Перечень программного обеспечения

№ п/п	Наименование ПО	Реквизиты договора (дата, номер, срок действия)
1	Windows: WinPro 10 RUS Upgrd OLP NL Acdmc	договор № 757 от 04.07.2018, срок действия – бессрочно; контракт № 1653 от 14.12.2018, срок действия – бессрочно
2	Office Standard: Office Stdandard 2013 Russian OLP NL AcademicEdition	договор № 690 от 19.05.2015, срок действия – бессрочно

**8.5. Описание материально-технической базы, необходимой для осуществления образовательного процесса по дисциплине**

№ п/ п	Наименование оборудованных учебных кабинетов, лабораторий, мастерских и др. объектов для проведения практических и лабораторных занятий, помещений для самостоятельной работы обучающихся (номер аудитории)	Перечень основного оборудования
1	Учебная аудитория для проведения занятий лекционного типа. Учебная аудитория для проведения занятий семинарского типа. Учебная аудитория для курсового проектирования (выполнения курсовых работ). Учебная аудитория для проведения групповых и индивидуальных консультаций. Учебная аудитория для проведения занятий текущего контроля и промежуточной аттестации А-215	Столы ученические двухместные (моноблоки), стол преподавательский, стул преподавательский, доска аудиторная (меловая)
2	«БОЛЬШАЯ ХИМИЧЕСКАЯ АУДИТОРИЯ» Учебная аудитория для проведения занятий лекционного типа. Учебная аудитория для проведения занятий семинарского типа. Учебная аудитория для курсового проектирования (выполнения курсовых работ). Учебная аудитория для проведения групповых и индивидуальных консультаций. Учебная аудитория для проведения занятий текущего контроля и промежуточной аттестации. А-125	Столы бенч-системы 6 местные, парты раскладные пластиковые, стулья для парт, кафедра – 1 шт., стол преподавательский, доска меловая, экран навесной, проектор, ПК
3	НИЛ «Функциональные гетероциклические соединения» Лаборатория органической химии. Учебная аудитория для проведения лабораторных работ А-203	Столы лабораторные островные, мойка двойная, столы лабораторные, столы письменные, шкаф для реактивов, полка для лабораторных принадлежностей, сушильный шкаф Экрос4610., вытяжные шкафы, доска меловая, мойка, тумбы для химической посуды, рефрактометр ИРФ454Б2М., Поляриметр СМ-3, стеллаж металлический, табуреты
4	Помещение для самостоятельной работы обучающихся Г-401	Столы, стулья, компьютеры