

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 направлению подготовки

04.03.01 Химия

Направленность (профиль) подготовки:

Химия

Форма обучения

Очная

Квалификация

Бакалавр

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.

ОПК-2 Способен проводить с соблюдением норм техники безопасности химический эксперимент, включая синтез, анализ, изучение структуры и свойств веществ и материалов, исследование процессов с их участием.

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

Результатами освоения дисциплины являются следующие индикаторы достижения компетенций:

ИОПК 1.1 Систематизирует и анализирует результаты химических экспериментов, наблюдений, измерений, а также результаты расчетов свойств веществ и материалов.

ИОПК 1.2 Предлагает интерпретацию результатов собственных экспериментов и расчетно-теоретических работ с использованием теоретических основ традиционных и новых разделов химии.

ИОПК 1.3 Формулирует заключения и выводы по результатам анализа литературных данных, собственных экспериментальных и расчетно-теоретических работ химической направленности.

ИОПК 2.1 Работает с химическими веществами с соблюдением норм техники безопасности.

ИОПК 2.2 Проводит синтез веществ и материалов разной природы с использованием имеющихся методик.

ИОПК 2.3 Проводит стандартные операции для определения химического и фазового состава веществ и материалов на их основе.

ИОПК 2.4 Проводит исследования свойств веществ и материалов с использованием серийного научного оборудования.

ИПК 1.1 Планирует отдельные стадии исследования при наличии общего плана НИР.

ИПК 1.2 Готовит элементы документации, проекты планов и программ отдельных этапов НИР.

ИПК 1.3 Выбирает технические средства и методы испытаний (из набора имеющихся) для решения поставленных задач НИР.

ИПК 1.4 Готовит объекты исследования.

2. Оценочные материалы текущего контроля и критерии оценивания

Элементы текущего контроля:

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

Устный опрос: (ИОПК 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: (ИОПК 1.3, ИОПК 2.1, ИОПК 2.3, ИОПК 2.4, ИПК 1.1, ИПК 1.2, ИПК 1.3., ИПК 1.4)

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.

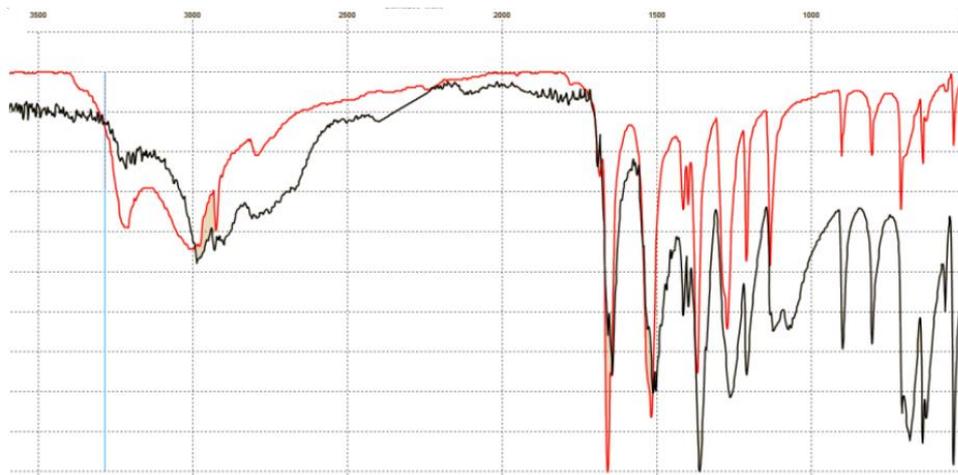
Индивидуальное задание (ИОПК 1.1, ИОПК 1.2) состоит из двух заданий: 1 теоретический вопрос и 1 задача.

Примеры теоретических вопросов:

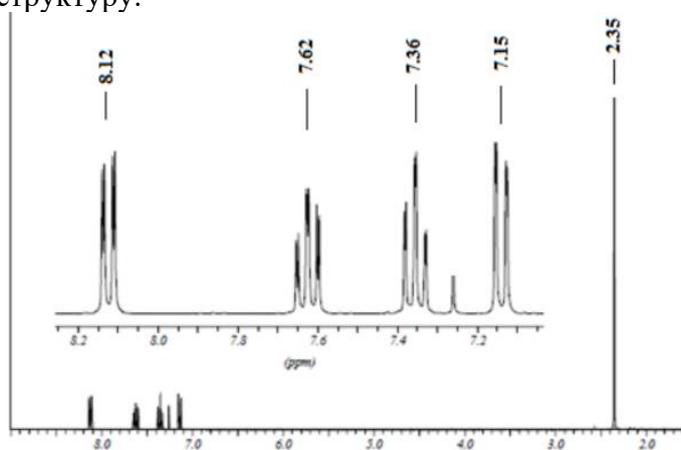
1. Как осуществляется поиск новых источников БАС?
2. Как связаны химическая структура вещества с его биологическим действием?

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 ИОПК 1.1, ИОПК 1.2, ИОПК 2.2, ИПК 1.1. Задача проверяет ИОПК 1.2, ИПК 1.2.

3.2 Примеры экзаменационных билетов

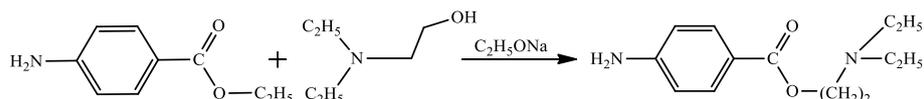
Билет 1

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 *m*-хлортолуола при хлорировании молекулярным хлором толуола:

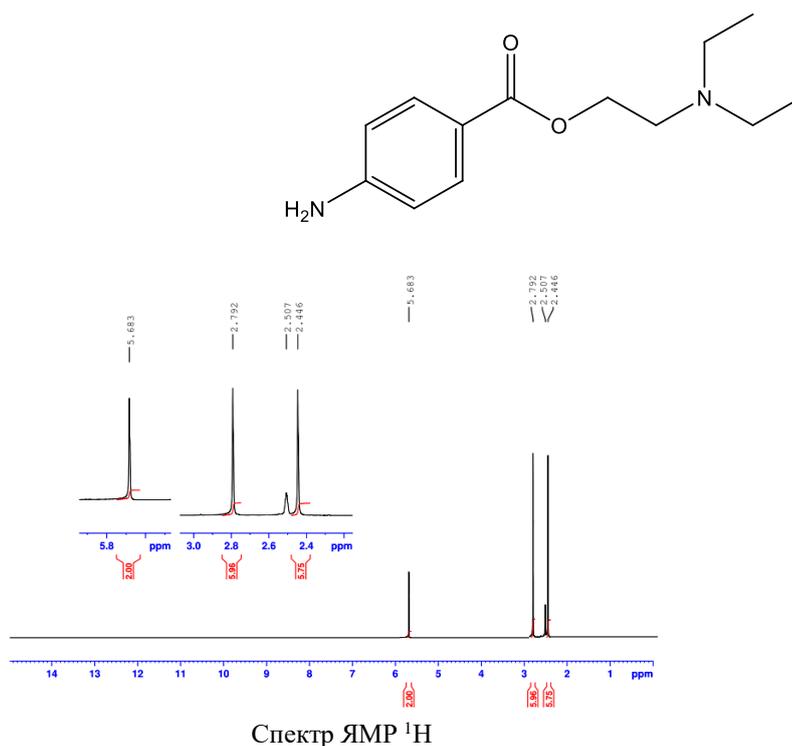
- A. H₂SO₄
- B. ZnCl₂
- C. Графит(сажа)
- D. Fe
- E. BF₃

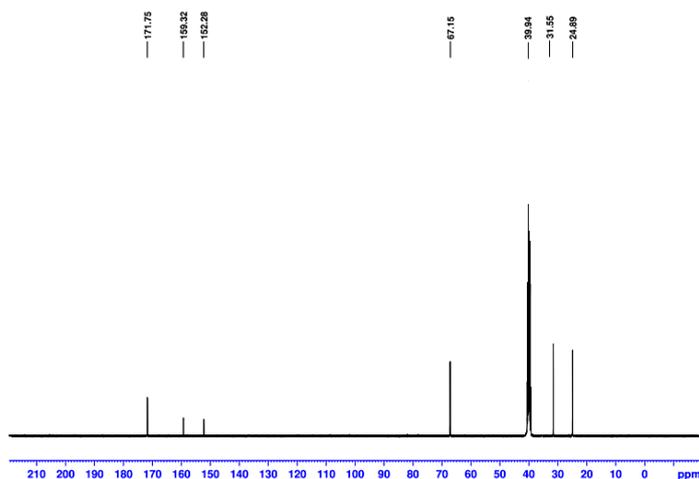
2. В терапевтической практике широко применяется лекарственный препарат Новокаин (Диэтиламино)-этил-4-аминобензоат анестетического действия, схема синтеза которого приведена ниже.



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

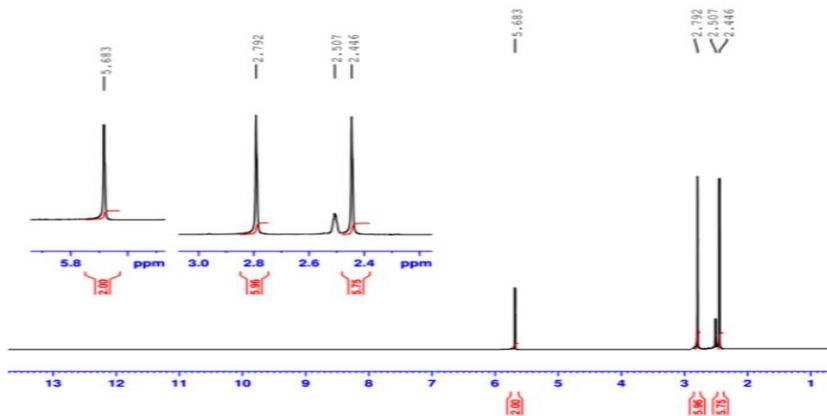




Спектр ЯМР ¹³С

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-d₆) новокаина с его структурной формулой. Используя шкалы химических сдвигов, предположите какие сигналы могут наблюдаться в спектре ЯМР ¹³С для данного препарата. Ответ аргументируйте.



Спектр ЯМР ¹Н

3.3. Критерии оценивания

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

1 и 2 вопроса 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.

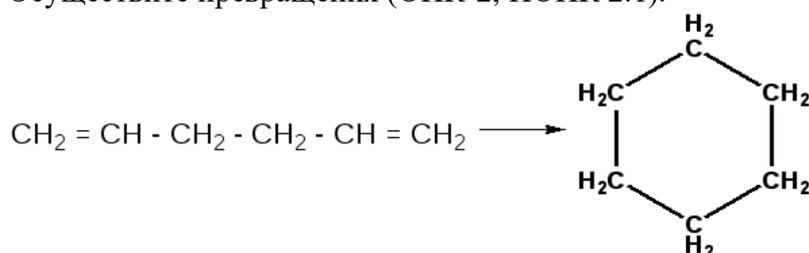
4. Оценочные материалы для проверки остаточных знаний (сформированности компетенций)

Тест

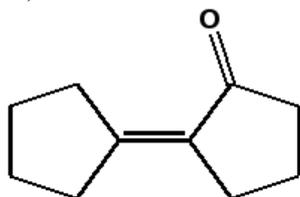
1. Требования, предъявляемые к методикам анализа (ОПК-2, ИОПК 2.2):
 - 1) воспроизводимость и правильность
 - 2) чувствительность
 - 3) избирательность (специфичность)
 - 4) унификация
 - 5) определение фармакологически активного лекарственного вещества
2. В основные задачи фармацевтической химии входят (ИОПК 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, ИОПК 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. (ИПК 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. (ПК-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 %. (ИОПК 1.2, ИОПК 1.3)

✓ 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, ИОПК 1.1, ИПК 1.1)
2. Основные этапы поиска новых потенциальных лекарств. (ИОПК 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.