

DRUGI ZAKLJUČNI KOLOKVIJ PRI VAJAH IZ FARMACEVTSKE KEMIJE III
27. 6. 2011
B

Ime in priimek.....
Vpisna številka.....

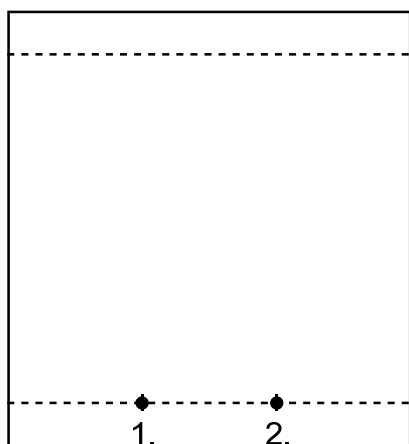
Število točk:

1.	/20	2.	/20	3.	/20	4.	/20	5.	/20	Σ	/100
----	-----	----	-----	----	-----	----	-----	----	-----	---	------

1. Opišite in s pomočjo splošne strukturne formule pojasnite odnos med strukturo in delovanjem pri sulfonamidih kot kemoterapevtikih. Katera vrednost pK_a je optimalna in s katerimi strukturnimi spremembami lahko vplivamo nanjo? Pojasnite! (20t)

2. Zapišite reakciji sinteze etilbiskumacetata v dveh stopnjah iz 4-hidroksikumarina in ustreznih reagentov, ki smo jih uporabili na vajah. (8t)

Skicirajte kromatogram (TLC) produkta prve in druge stopnje sinteze etilbiskumacetata (SF:silikagel; MF: kloroform/metanol=9:1) in pojasnite razliko med retencijskima faktorjema. (4t)



stopnja

Zapišite sintezo 4-hidroksikumarina iz fenola (po eni od možnih variant). (8t)

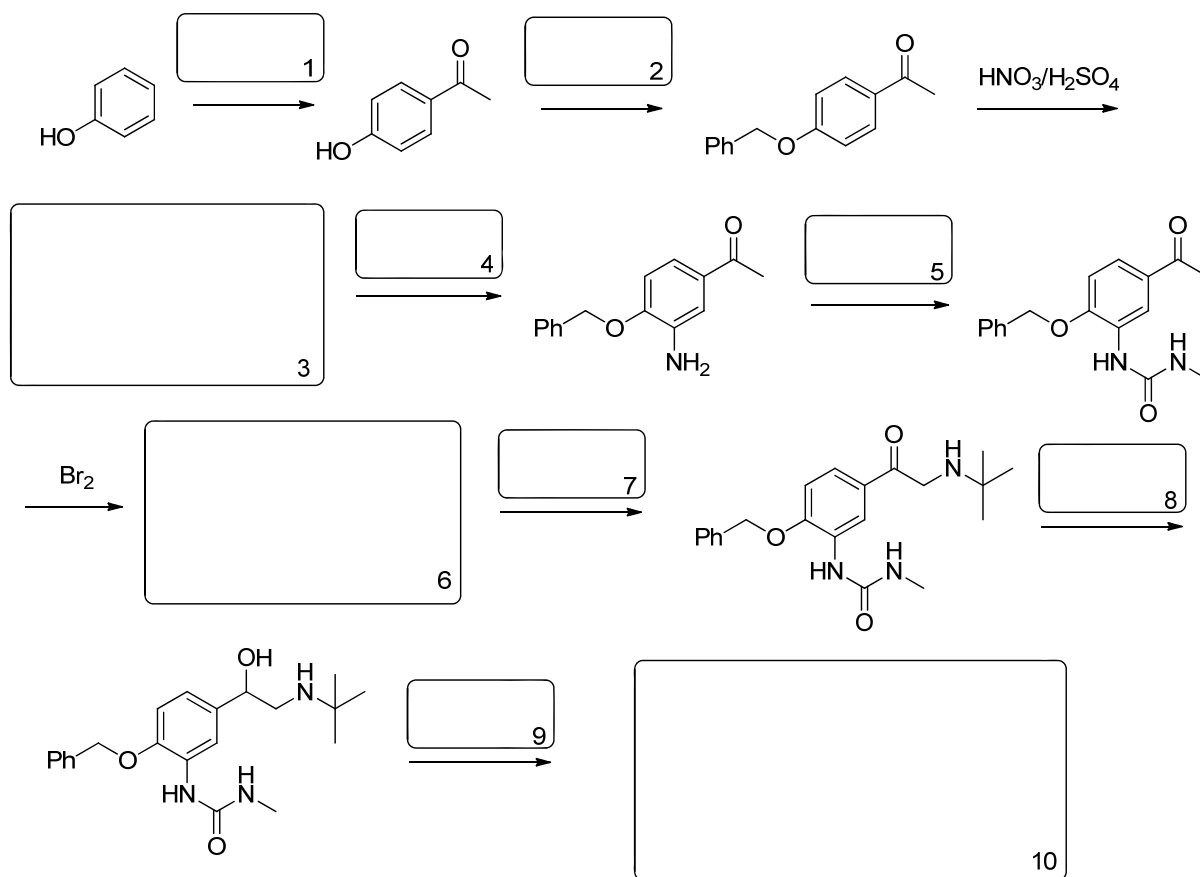
3. Zapišite sintezno shemo sinteze *t*-butil (1,1-bis(4-fluorofenil)-2-((1-oksil-2,2,6,6-tetrametilpiperidin-4-il)amino)-2-oksoetil)karbamata iz 4-fluorobenzaldehida in tempamina (ali 4-amino-2,2,6,6-tetrametilpiperidin-1-oksil). (16t)

Kako bi sintetizirali 4-fluorobenzaldehid iz benzena in ustreznih reagentov. (4t)

4. Preberite trditev in ustrezno obkrožite odgovor! (20t)

- a) DCC ne omogoča selektivne tvorbe amidne vezi, ker lahko hitro reagira z amini do ustreznih gvanidinskih derivatov. DA/NE
- b) Amidi so stabilnejši od estrov zaradi resonančne stabilizacije. DA/NE
- c) Lokalni anestetiki so zdravilne učinkovine, ki povzročajo prehodno in reverzibilno preobčutljivost omejenega dela telesa na bolečino tako, da stimulirajo nastanek in prevajanje akcijskega potenciala v živčnih vlaknih. DA/NE
- d) Fenitoin je pravzaprav idealni lokalni anestetik, saj je hkrati tudi vazokonstriktor, kar drugi lokalni anestetiki niso, zato jih kombiniramo z vazokonstriktorji. DA/NE
- e) Za barbiturate je značilna visoka incidenca tolerance, ki nastane kot posledica indukcije jetrnih mikrosomalnih encimov. DA/NE
- f) Aldolna kondenzacija je reakcija za tvorbo 1,3-dikarbonilnih spojin in poteče med dvema enakima molekulama ketona (simetrična) ter med različnimi ketoni ali ketoni in aldehidi (asimetrična ali mešana). DA/NE
- g) Antralin kot šibka kislina lahko odda proton, nastali antralin anion pa lahko reagira s tripletnim kisikom tako, da sprejme elektron, kisik pa se oksidira do superoksidnega radikala. DA/NE
- h) Propranolol je predstavnik neselektivnih antagonistov receptorjev beta. DA/NE
- i) Acetilsalicilna kislina spada v novejšo skupino učinkovin NSAID in v primerjavi z večino NSAID deluje selektivno zaviralno na COX-1, zato ne povzroča razjed želodčne sluznice. DA/NE
- j) Varfarin po mehanizmu delovanja uvrščajo med neposredne antikoagulate. DA/NE

5. Dopolnite sintezno shemo za sintezo *N*-metiliranega analoga karbuterola (spojina **10**: 1-{5-[2-(*tert*-butilamino)-1-hidroksietil]-2-hidroksifenil}-3-metilsečnina (15t)



5.2. Navedite vsaj dva orositvena reagenta za spojino **10**.

(2t)

5.3. Narišite strukturi, če spojini **10** dodamo:

a) 1M HCl

b) 3 ekvivalente NaH

(3t)