

TRETJI ZAKLJUČNI KOLOKVIJ PRI VAJAH IZ FARMACEVTSKE KEMIJE III
31. 8. 2012

Ime in priimek.....

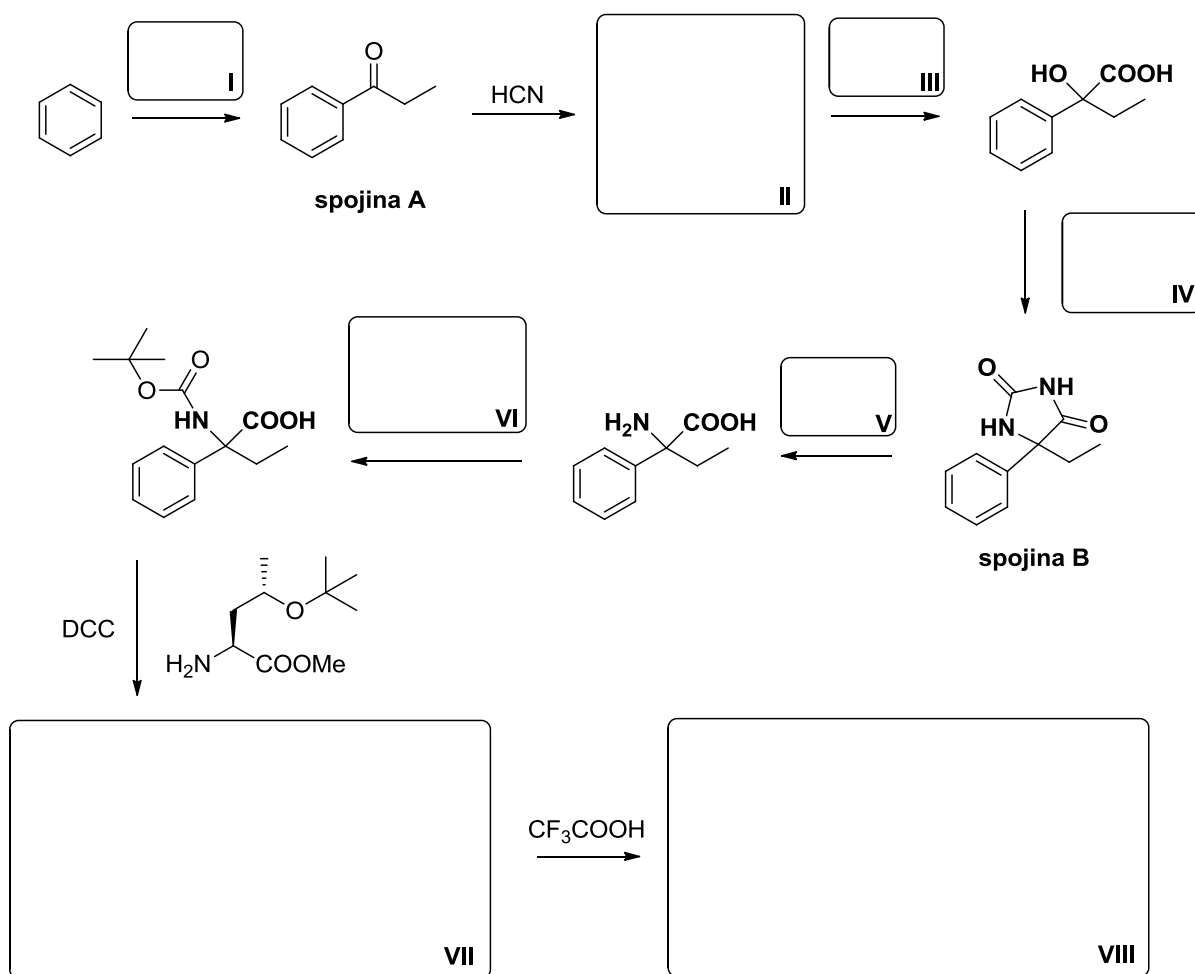
Vpisna številka.....

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 koksibih. (20t)

2.1. Dopolnite manjkajoče produkte in reagente I-VIII! (16t)



2.2. Koliko lis bi detektirali pri spojini **VIII**, če bi jo nanesli na kiralni reverznofazni silikagel in ploščico razvili v mobilni fazi acetonitril/metanol/voda= 3/1/1? (2t)

2.3 Obkrožite črko pred pravilno trditvijo/trditvami! (2t)

- Spojina **B** ima 2 kislila protona, ki ju lahko odcepimo z NaH.
- Spojina **B** daje obarvanje po orositvi z ninhidrinom in 2,4-dinitrofenilhidrazinom.
- Pri uvajanju zaščitne skupine pri spojini **A**, ki se bo odcepila pri kislih pogojih, lahko uporabimo etilenglikol in *para*-toluensulfonsko kislino.
- Stranski produkt pri sintezi spojine **VII** je diciklofenilsečnina.
- Spojina **B** znižuje intracelularno koncentracijo natrijevih ionov v živčnih celicah in ima antikonvulzivno delovanje.

3.1. Zapišite sintezno shemo sinteze benzodiazepina z IUPAC imenom:

1,3-dihidro-5-fenil-7-bromo-1-metil-1,4-benzodiazepin-2(3H)-on

iz 2-amino-5-bromobenzofenona. (8t)

3.2. Kako bi sintetizirali **2-amino-5-bromobenzofenon** iz benzena? Zapišite sintezno shemo.

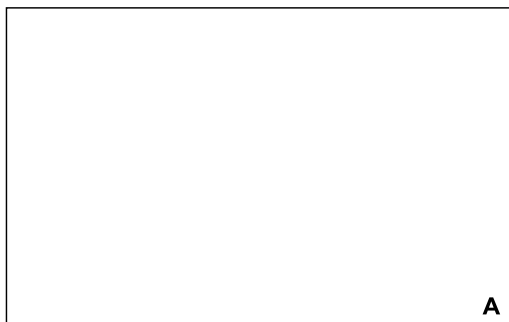
(8t)

3.3. Zapišite dve sintezni shemi dveh možnih derivatov iz benzodiazepina z IUPAC imenom

1,3-dihidro-5-fenil-1-metil-1,4-benzodiazepin-2(3H)-on,

ki jih najpogosteje zasledimo med benzodiazepini kot učinkovinami tako, da potečeta reakciji na dveh različnih mestih benzodiazepinskega skeleta. (4t)

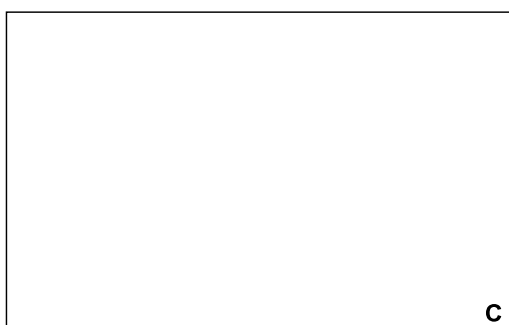
4.1. Narišite strukture učinkovin, ki smo jih sintetizirali pri vajah iz farmacevtske kemije 3. (10t)



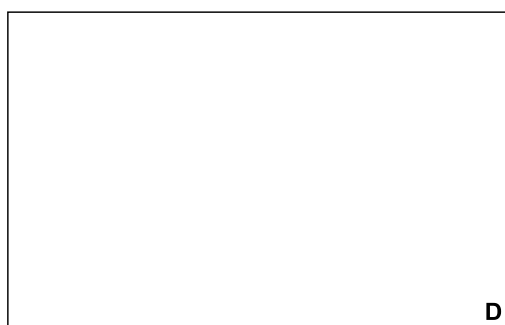
A
dietil 2,6-dimetil-4-(3-nitrofenil)-1,4-dihidropiridin-3,5-dikarboksilat



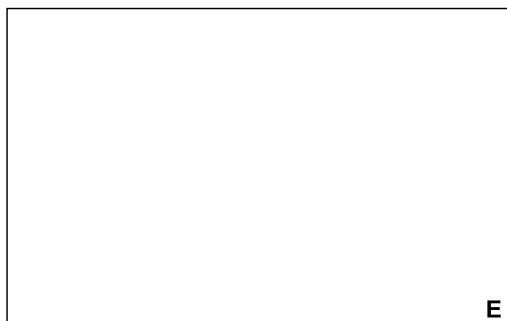
B
(R)-varfarin



C
4-(5-(*p*-tolil)-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il)benzensulfonamid



D
sulfametoksazol



E
5,5-difenil-2,4-imidazolidindion

4.2. Obkrožite črko pri učinkovini(ah), za katero(e) veljajo spodnje trditve: (10t)

Liso učinkovine lahko na kromatogramu detektiramo po orositvi z 2,4-dinitrofenilhidrazinom.

A B C D E nobena od naštetih

Učinkovina lahko tvori sol s K_2CO_3 .

A B C D E nobena od naštetih

Učinkovini lahko odcepimo proton z NaOMe.

A B C D E nobena od naštetih

Učinkovina lahko tvori sol z 1M HCl.

A B C D E nobena od naštetih

Učinkovina deluje kot hipnotik.

A B C D E nobena od naštetih

Učinkovino lahko z $LiAlH_4$ reduciramo do alkohola.

A B C D E nobena od naštetih

Učinkovina je inhibitor ciklooksigenaze-2 (COX-2).

A B C D E nobena od naštetih

Pri sintezi učinkovine je potekla Michaelova 1,4-adicija.

A B C D E nobena od naštetih

Učinkovina je neposredni antikoagulant.

A B C D E nobena od naštetih

Učinkovina deluje na kalcijeve kanale.

A B C D E nobena od naštetih

5.1. Sintetizirajte spojino **5** z IUPAC imenom

1-(2-etilfenoksi)-3-((1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)amino)propan-2-ol

iz benzena, epiklorhidrina ali 2-(klorometil)oksidana in 4-fenilbutanojske kisline! (18t)

5.2. Koliko kirlnih centrov ima spojina **5**?(2t)