

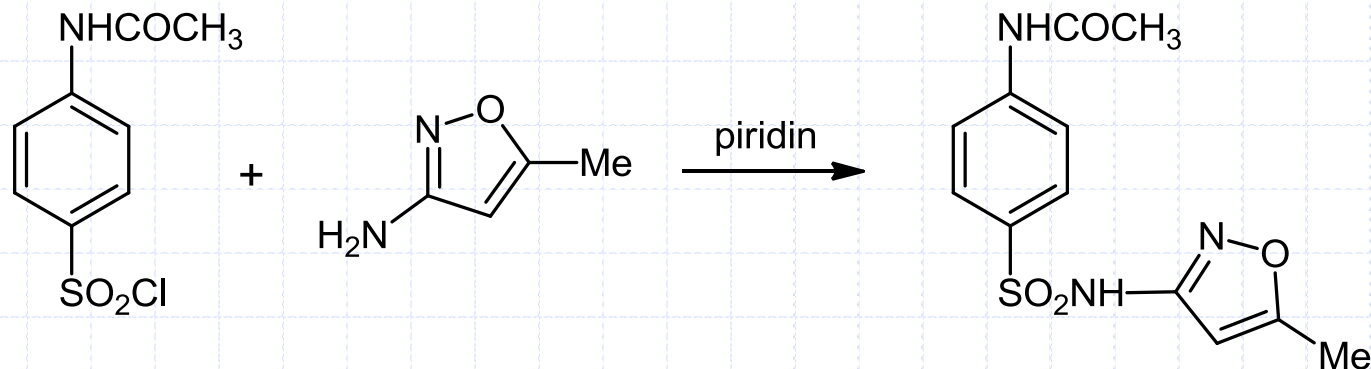


Katedra za farmacevtsko kemijo

Sulfametoksazol II

9. vaja

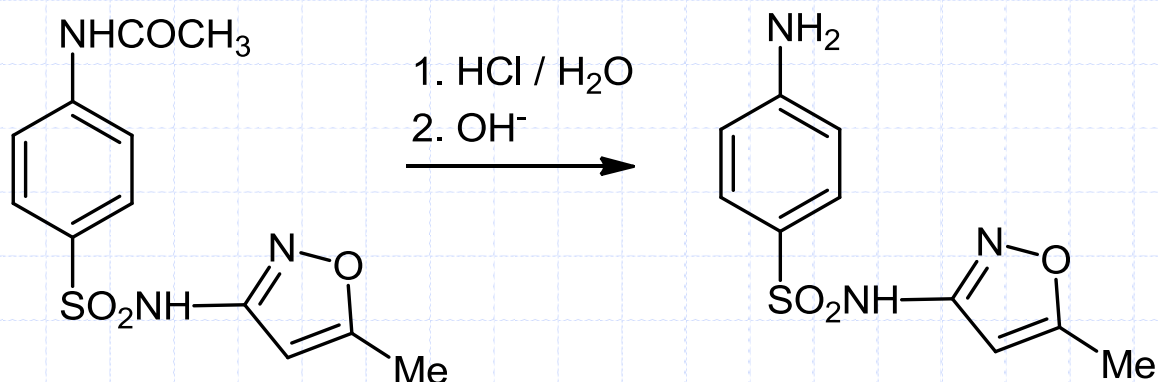
Sulfametoksazol – izolacija produkta 2. stopnje



- ◆ Kako se znebimo piridina?
- ◆ Kaj se zgodi, ko raztopino naalkalimo do $\text{pH} = 12-13$? Kaj bi se zgodilo v primeru, da tega ne bi storili?
- ◆ Zakaj nakisamo do $\text{pH} = 2-3$?
- ◆ Kaj bi se lahko zgodilo, če nakisanja ne bi izvajali na ledeni kopeli in bi raztopino preveč nakisali ($\text{pH} < 1$)?

Sulfametoksazol – 3. stopnja

- ◆ Selektivna! hidroliza amida

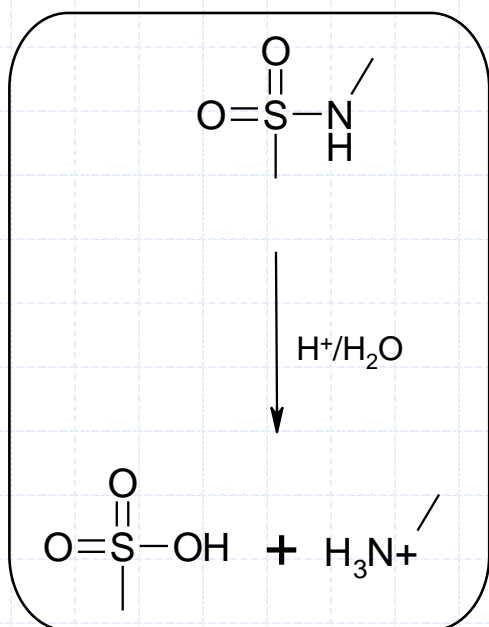


- ◆ Kaj tvegamo?
- ◆ Alternativna pot?
- ◆ Zakaj uravnamo pH do 3 s 3 M NaOH?
- ◆ Kaj se zgodi, če pretirano naalkalimo vodno raztopino?
- ◆ Predlagajte orositveni reagent za detekcijo poteka reakcije.

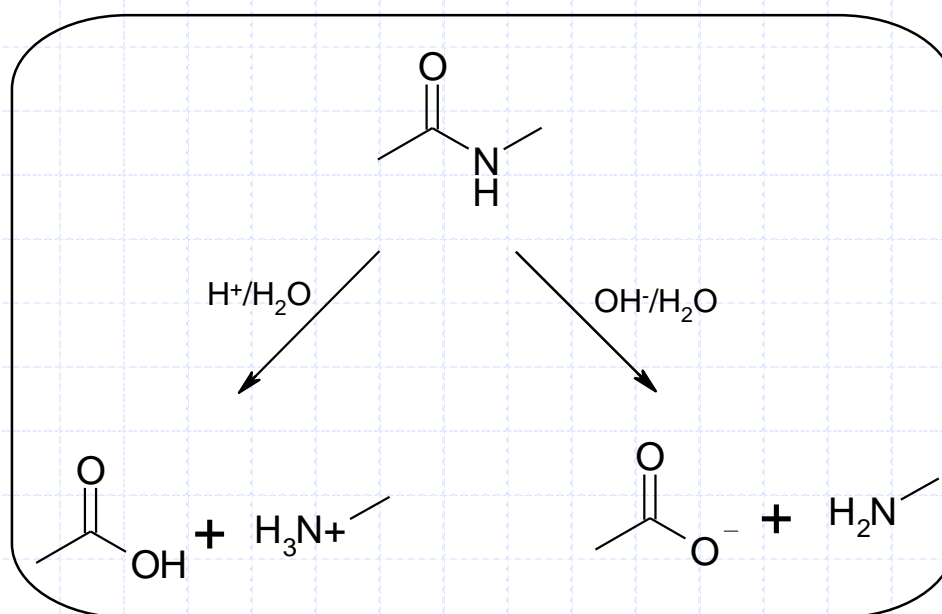


Hidroliza

◆ sulfonamid



◆ karboksamid



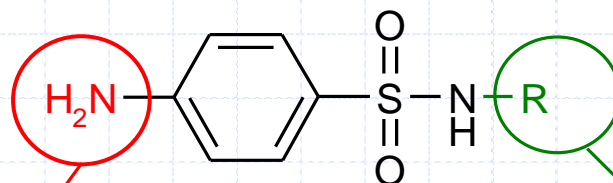
Mehanizem? Lastnosti amidov, sulfonamidov?

Sinteza sulfonilurej

- ◆ sulfonamid + baza + izocianat
- ◆ sulfonamid + baza + etilkloroformat + amin
- ◆ sečnina + baza + sulfonil klorid

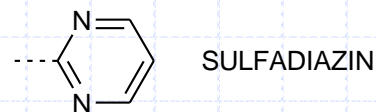
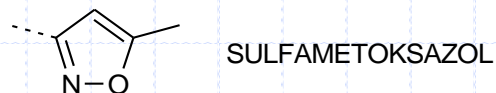
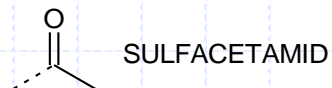
Katere učinkovine vsebujejo sulfonilureidni fragment?

SAR sulfanilamidov



nesubstituirana amino-skupina
na *p*-mestu, *o*- in *m*- sta manj učinkovita

različni substituenti - vpliv na pKa spojin in
razpolovni čas



Sintezne naloge

Amidefrin

N-[-3-{-1-hidroksi-2-(metilamino)etil}
fenil]metansulfonamid

iz: metansulfoniklorida, 3-
aminoacetofenona, benzilmetilamina

Sintezne naloge

Bumetanid

3-(butilamino)-4-fenoksi-5-sulfamoil
benzojska kislina

iz: *p*-klorotoluena

Sintezne naloge

Furosemid

5-(aminosulfonil)-4-kloro-2-[(2-furilmetil)amino]benzojska kislina

iz *p*-klorotoluena in 2-(klorometil)furana