

Organická chemie

21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

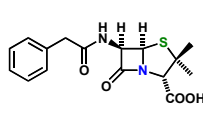




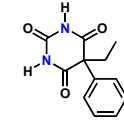
Doc. Ing. Pavel Bobál, CSc.

*Ústav chemických léčiv, Farmaceutická fakulta VFU,
Palackého 1/3, 642 12 Brno*

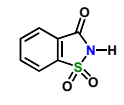
Úvod



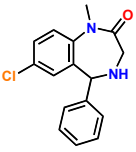
penicilin G



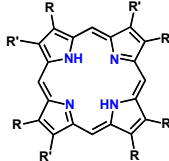
fenobarbital



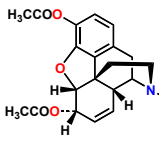
sacharin



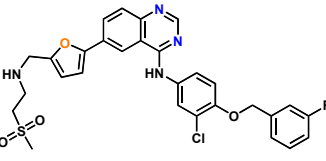
diazepam



porfyrin



heroin




lapatinib

2

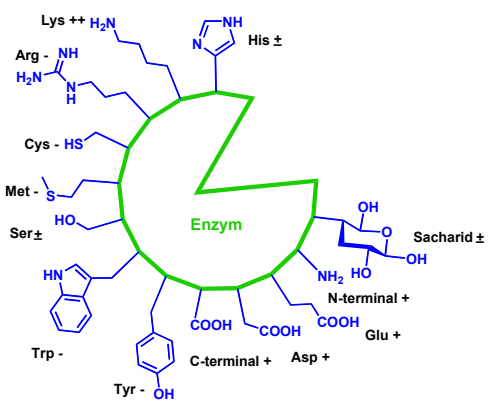
21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie



Úvod


Enzymy (bílkoviny)



3

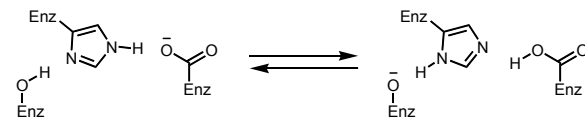
21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

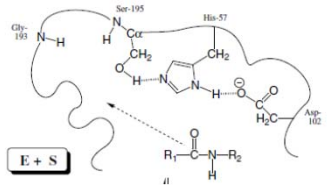
Organická chemie



Úvod

Chymotrypsin (hydroláza) – katalytická triáda Ser – His – Asp (Glu)






4

21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie



Úvod

Orlistat (tetrahydrolipstatin) -

Ser 152

5 21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné
Organická chemie

Heterocykly: Názvosloví

- Hantzschův-Widmanův systém**
nejčastěji u heterocyklů se 3, 4 a 7-10 články a pro heterocykly obsahující větší počet heteroatomů
- Záměnný princip názvosloví**
užívá se pro cykly větší než 10 a pro menší cykly obsahující Si, používáme jej také u bicyckických a polycyklických systémů
- Triviální názvosloví monocyklických heterocyklů**
u 5 a 6-ti článkových heterocyklů s jedním nebo dvěma heteroatomy
- Systematické názvosloví ortho-kondenzovaných heterocyklů**

6 21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné
Organická chemie

Heterocykly - názvosloví: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Záměnný princip názvosloví

penicilin G
(2*S*,5*R*,6*R*)-6-(2-fenylacetamido)-3,3-dimethyl-7-oxo-4-thia-1-azabicyklo[3.2.0]heptan-2-karboxylová kyselina

(2*S*)-7-oxo-4-thia-1-azabicyklo[3.2.0]heptan-2-karboxylová kyselina

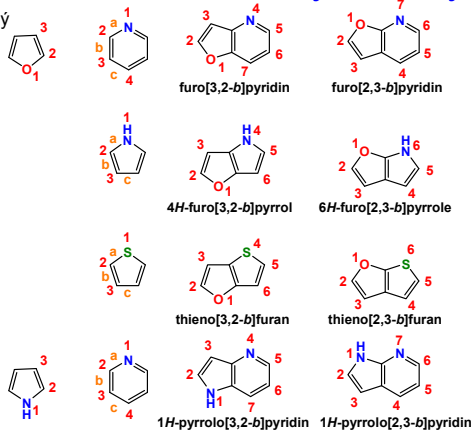
7 21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné
Organická chemie

Heterocykly: Názvosloví

8 21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné
Organická chemie

Heterocykly: Názvosloví ortho-kondenzovaných heterocyklů

- větší kruh nadřazený
- N > O > S



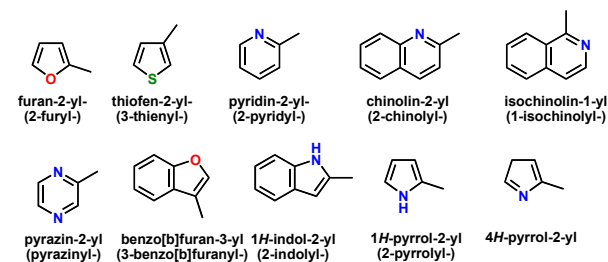
9

21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie



Heterocykly: Názvosloví



10

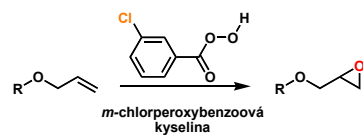
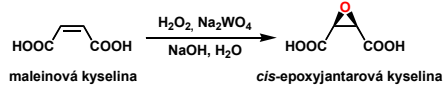
21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie

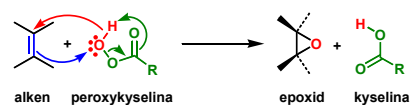


Příprava oxiranů

- oxidací alkenů



- mechanismus



11

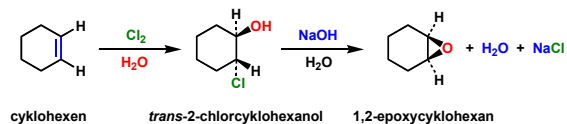
21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie

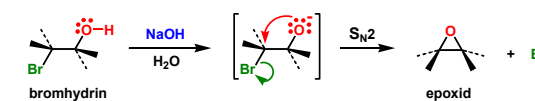


Příprava oxiranů

- z halohydrinů působením bází



- mechanismus



12

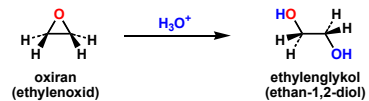
21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie

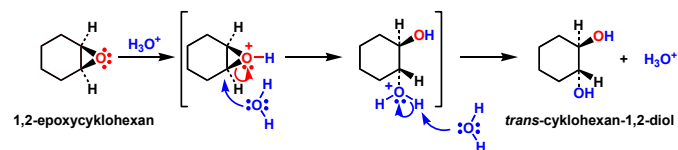


Reaktivita oxiranů: Kyselé katalyzované otevírání oxiranů

- příprava vicinálních glykolů – 1,2-diolů



- mechanismus



13

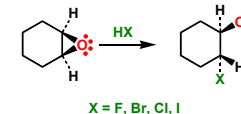
21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie

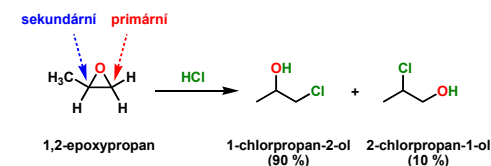


Reaktivita oxiranů: Kyselé katalyzované otevírání oxiranů

- otevírání - halogenovodík HX



- mechanismus – primární a sekundární – nukleofil atakuje méně stericky bráněnou polohu



14

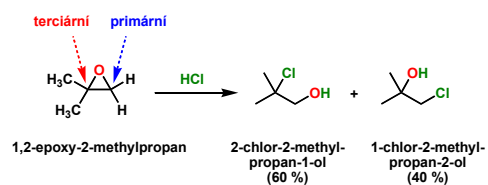
21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie



Reaktivita oxiranů: Kyselé katalyzované otevírání oxiranů

- terciární - mechanismus $\text{S}_{\text{N}}1$



15

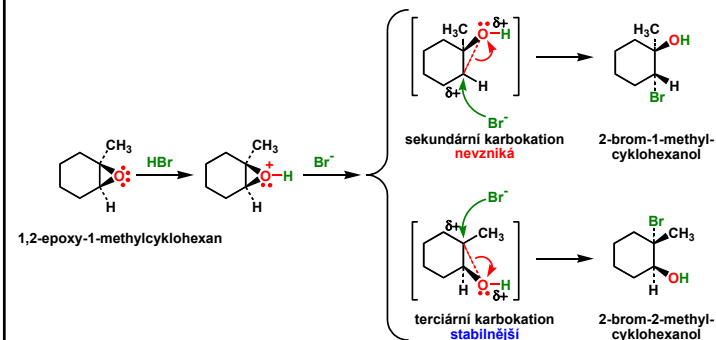
21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie



Reaktivita oxiranů: Kyselé katalyzované otevírání oxiranů

- složitější mechanismus – současně rysy mechanismu $\text{S}_{\text{N}}1$ a $\text{S}_{\text{N}}2$



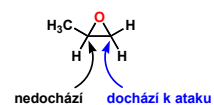
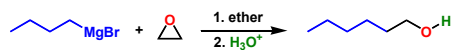
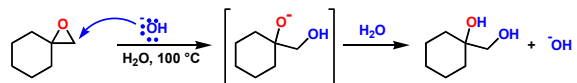
16

21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie



Reaktivita oxiranů: Bazicky katalyzované otevírání oxiranů



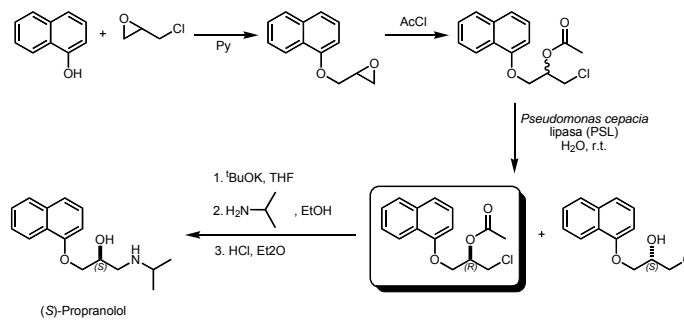
17

21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie



Využití oxiranů



18

21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie

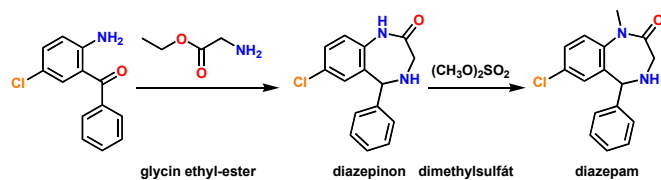


Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Příprava aziridinů – obdobná

Příprava 4-členných kruhů

Příprava 7-členných kruhů



19

21. Heterocykly: 3-, 4-, 7- a vícečlenné

Organická chemie

