

Ερωτήσεις στην ΟΦΧ_III

Έγλη Χατζηπαύλου-Λίτινα

2019-20

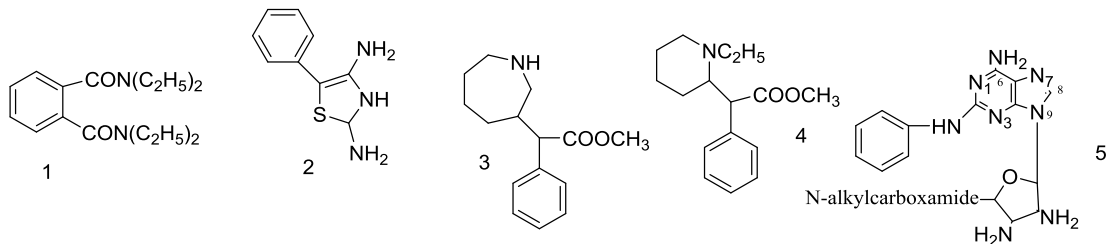
Ποιά στοιχεία προέκυψαν από την κρυσταλλογραφική μελέτη του ενεργού κέντρου της θρομβίνης από την άποψη των φυσικοχημικών ιδιοτήτων και των δομικών στοιχείων που εμπλέκονται στη δράση.

Γράψτε τη σύνθεση ενός αντιπροσωπευτικού μορίου και προτείνετε μια μέθοδο ποσοτικού προσδιορισμού.

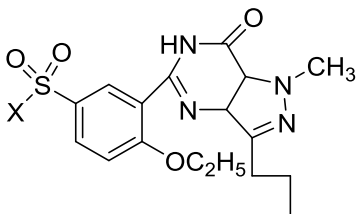
Στους αναστολείς της θρομβίνης ποια ομάδα τους παίζει ρόλο για την αναγνώριση από το ενεργό κέντρο του ενζύμου. Η αντικατάσταση της ομάδας αυτής από λυσίνη, ή ασπαρτικό οξύ ή γλυκίνη θα επηρεάσει την αναστολή και πώς; Δικαιολογήστε την απάντησή σας.

Τι είδους (από άποψη μηχανισμού δράσης) μόριο θα επιλέγατε για την θεραπεία της χρόνιας αποφρακτικής πνευμονοπάθειας σαν αντιφλεγμονώδες. Γράψτε τον μηχανισμό δράσης και την σύνθεση του. Ποιο είναι το πρωτότυπο φάρμακο της κατηγορίας στην οποία ανήκει (όνομα, τύπος)

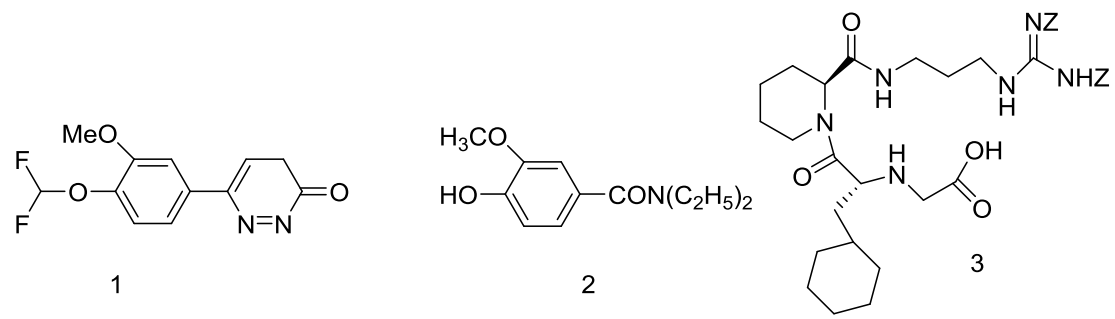
•Τι δράση μπορείτε να αποδώσετε από όσα γνωρίζετε στα παρακάτω μόρια και γιατί
Απαντήστε συνοπτικά:



•4)Τι δομικές αλλαγές πρέπει να γίνουν στην παρακάτω ένωση ώστε να έχετε την δομή ενός γνωστού φαρμάκου. Ποιό είναι, σε ποιά κατηγορία ανήκει, ποιος ο μηχανισμός δράσης του. Γράψτε την σύνθεσή του



• Αναγνωρίστε σε ποια φάρμακα αντιστοιχούν οι δομές των 1, 2 και 3. Γράψτε τα ονόματά τους και την δράση τους μονολεκτικά. Γράψτε την σύνθεση ενός φαρμακομορίου που να αντιστοιχεί σε μία από τις τρεις κατηγορίες (1, 2, 3).



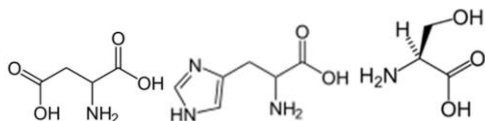
Ποιο μόριο αποτελεί τον πρωτότυπο PDE-4 αναστολέα. Γράψτε την σύνθεση ενός εκλεκτικού PDE-4 αναστολέα. Πώς μπορούμε να εξασφαλίσουμε την εκλεκτικότητα στη δράση **A1**/PDEs (δομικά και θέση υποκατάστασης).

α) Στον παρακάτω γενικό τύπο (**A**) αντικαταστήστε τα **Z**, **X** και **R** έτσι ώστε να έχουμε ένα πολύ ισχυρό και ένα ασθενέστερο αναληπτικό. **A : Z-C(X)-COOR**,

β) Για ποιούς λόγους οι στατίνες τύπου II πλεονεκτούν των τύπου I.

γ) Στους αναστολείς της θρομβίνης ποια ομάδα τους παίζει ρόλο για την αναγνώριση από το ενεργό κέντρο του ενζύμου. Η αντικατάσταση της ομάδας αυτής από λυσίνη, ή ασπαρτικό οξύ ή γλυκίνη θα επηρεάσει την αναστολή και πώς; Δικαιολογήστε την απάντησή σας.

• Με την δράση ποιών φαρμάκων συνδέονται τα παρακάτω αμινοξέα (ποιά είναι). Γράψτε την σύνθεση ενός τέτοιου φαρμάκου και ποιός είναι ο βιολογικός του στόχος



Γράψτε την δομή της θεοφυλλίνης υποδεικνύοντας όλες τις πιθανές θέσεις δομικών τροποποιήσεων και τις αναμενόμενες επιπτώσεις στη δράση.

Πού στοχεύει ο σχεδιασμός αναλόγων Iovastatin; Ποια είναι τα χαρακτηριστικά δομικά στοιχεία των φυσικών στατινών και ποια των συνθετικών

Γράψτε την σύνθεση ενός μη ομοιοπολικού αναστολέα της θρομβίνης. Πώς θα επηρεασθεί η δράση του αν το κατιονικό του άκρο αντικατασταθεί με ένα ανιονικό υπόλοιπο

• Γράψτε την σύνθεση της Loxiglumide και συζητήστε τα πλεονεκτήματα/μειονεκτήματα που προσφέρουν στην δράση οι υπάρχοντες στο μόριο της Loxiglumide υποκαταστάτες σε σύγκριση με το πρωτότυπο μόριο (ποιό είναι).

• Τι δομικές αλλαγές νομίζετε ότι πρέπει να κάνετε στο παρακάτω μόριο ώστε να καταλήξετε σε ένα γνωστό και χρησιμοποιούμενο φάρμακο. Γράψτε τον τύπο και το μόριο του

