



1. PREDMET: SINTEZA PEPTIDOV IN OLIGONUKLEOTIDOV

Šifra: 30-2017

Število kreditnih točk (ECTS): 12

Obseg ur: 60; predavanja 60

Program: podiplomski študij - smer Kemija

2. VZGOJNOIZOBRAŽEVALNI CILJI

Študent se seznaní z najpomembnejšími metodami za pripravo peptidov in oligonukleotidov. Dobi vpogled v posamezne stopnje, ki jih tako zahtevne sinteze zajemajo: stereoselektivna priprava amino kislin in njihovih derivatov, priprava nukleotidov in njihovih derivatov, uvedba zaščitnih skupin, tvorba peptidne oziroma internukleotidne vezi, odcep zaščitnih skupin itd. Študent spozna tudi sinteze na trdnih nosilcih.

3. VSEBINA

Stereoselektivne sinteze amino kislin. Asimetrična derivatizacija glicina. Glicinski kationi. Stereoselektivne sinteze preko β -ogljkovega atoma. Elektrofilno aminiranje enolatov. Nukleofilno aminiranje α -substituiranih kislin. Asimetrično hidrogeniranje didehidroamino kislin.

Priprava derivatov. Metode za zaščito amino skupine. Načini zaščite karboksilne skupine. Komplementarnost zaščitnih skupin. Zaščite ostalih funkcionalnih skupin. Selektivni odcep zaščitnih skupin.

Sinteza peptidov. Aktivacija karboksilne komponente. Aktivacija aminske komponente. Tvorba peptidne vezi. Uporaba karbodiimidov, fosfonijevih reagentov, N-karboksianhidridov in drugih reagentov. Uporaba talijevega trinitrata. Sinteze na trdnih nosilcih. Merrifieldova sinteza. Sheppardov pristop.

Taktika in strategija v peptidni sintezi. Kombinacije zaščitnih skupin. Segmentna kondenzacija. Postopno podaljševanje na N-terminalni oziroma C-terminalni amino kislini. Sinteze cikličnih peptidov. Načini tvorbe disulfidnih mostov. Uporaba karbamoilazo spojin.

Nukleozidi in nukleotidi. Priprava nukleozidne enote. Zaščita sladkorne komponente: zaščita 2'- hidroksi skupine, zaščita 3'- in/ali 5'- hidroksi skupine, zaščita 2',3'- cis diola. Metode zaščite amino skupine na heterociklični bazi. Zaščita fosfatne skupine.

Sinteza oligonukleotidov. Tvorba vezi med nukleotidi. In situ aktivacija fosfatne skupine. Nastanek internukleotidne vezi z eliminacijo dobro izstopajoče skupine. Sinteza preko ciklonukleotidov. Kemijska polimerizacija. Stopenjska sinteza v raztopini. Sinteza na polimernih nosilcih.

4. POVEZANOST Z DRUGIMI PREDMETI

Predmet se povezuje z organsko kemijo in z organsko kemijo biološko pomembnih spojin.

5. ŠTUDIJSKA LITERATURA

OSNOVNA UČBENIKA:

- M. Bodanzsky: *Principles of Peptide Synthesis*, Springer, 1993.
- Y. Mizuno: *The Organic Chemistry of Nucleic Acids*, Elsevier, 1986.

DODATNA LITERATURA:

- R. M. Williams: *Synthesis of Optically Active α -Amino Acids*, Pergamon, 1989.
- J. Jones: *The Chemical Synthesis of Peptides*, Oxford, 1991.

6. OBVEZNOSTI ŠTUDENTA

Študent opravi ustni izpit.

PRIPRAVIL: Slovenko Polanc

DATUM: 06. 08. 2003