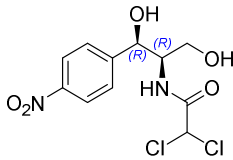


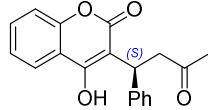
Tema 5 Fármacos y Quiralidad. Ejercicios

1.

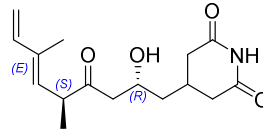
(a)



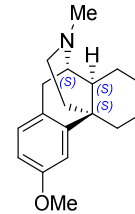
cloramfenicol
antibiótico



warfarina
anticoagulante

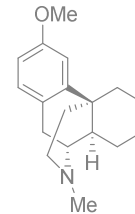
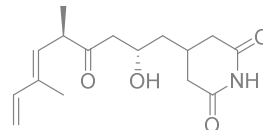
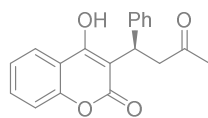
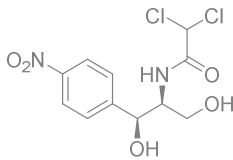


estreptomidona
antibiótico



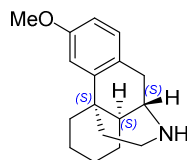
dextrometorfano
antitusivo

enantiómeros



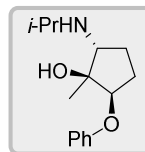
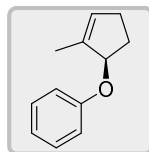
(b) El número máximo de isómeros puede determinarse con la expresión 2^n donde n representa el número de estereocentros. En el caso de paclitaxel que contiene 11 estereocentros: 2^{11} es el número máximo de isómeros posibles

2.

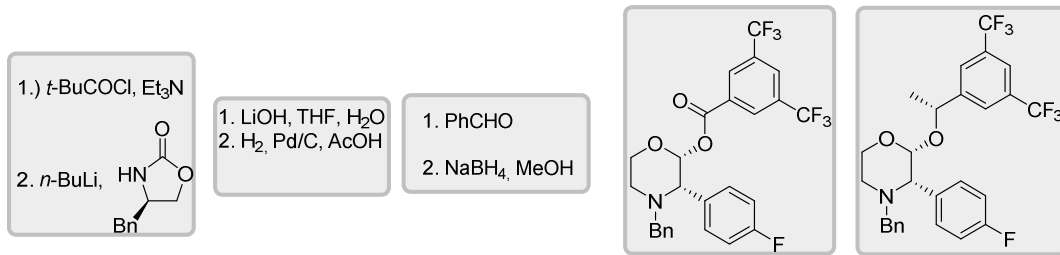


destrometorfano
III

3.



4.



5.

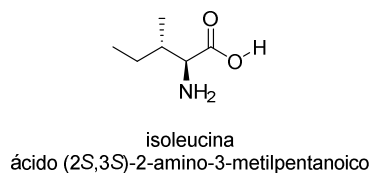


6.

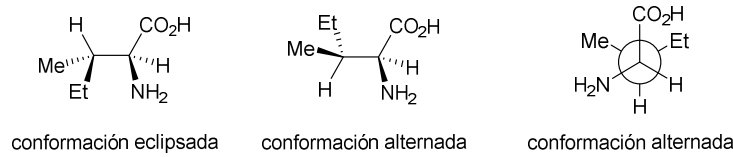
(a) un epímero se obtiene cambiando la configuración de un único centro estereogénico (existen 3 posibles). Un diastereoisómero cambiando la configuración de uno o dos estereocentros (existen 6 posibles). Su enantiómero, cambiando todos los estereocentros.



(b)



(c) Existen varias posibilidades, pero debe representarse el enlace C2-C3 para no perder información de la molécula.



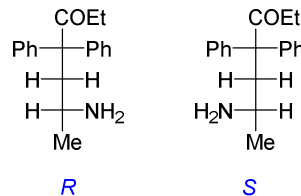
7.



8.

La resolución óptica de la metadona mediante la formación del tartrato con ácido L-(+)-tartárico, ácido (2*R*,3*R*)-2,3-dihidroxitbutanodioico, permite determinar que su actividad se debe fundamentalmente al isómero *levo*, que es 20 veces más activo que el *dextro*. (a) Dibuja las proyecciones de Fischer de los dos isómeros posibles, indicando la configuración absoluta (*R* o *S*). (b) ¿Se podría saber con los datos anteriores cuál es la configuración absoluta del isómero *levo*? (c) Define e indica cuál es el eutómero y cuál el distómero. (d) Al tratar la metadona con LAH se obtiene una mezcla de isómeros de fórmula C₂₁H₂₉NO. ¿Cuál es su estructura? ¿Cuántos isómeros se pueden formar?

(a) Para una correcta representación se recomienda colocar la cadena carbonada en la vertical con el átomo de carbono más oxidado en la posición superior.

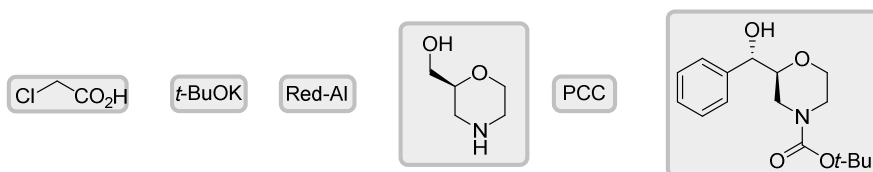


(b) *dextro* y *levo* solo indican el signo de la rotación óptica y no la configuración absoluta.

(c) el eutómero es el enantiómero más activo, en este caso, el *levo*.

(d) La metadona racémica reacciona con LAH reduciéndose la cetona al correspondiente alcohol secundario. Se genera un nuevo estereocentro por lo que el número máximo de isómeros posibles de este nuevo producto será 2² es decir 4.

9.





10.

(a) El módulo de quiralidad emplea cromatografía en fase quiral, es decir, empleará una columna cromatográfica con un relleno (fase estacionaria) quiral. Otras técnicas que se emplean para medir el exceso enantiomérico son la resonancia magnética nuclear con reactivos de desplazamiento o técnicas de transformación de los sustratos enantioméricos a los correspondientes diastereoisómeros que ahora presentarán propiedades físicas y químicas muy diferentes y pueden, por tanto, ser aislados separadamente.

(b) La rotación específica no puede conocerse con el valor de exceso enantiomérico.

(c) La pureza óptica será del 52%.

