

## Tema 1-8

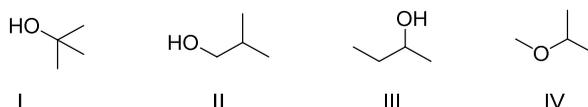
### Test de Autoevaluación. Solución

1. Indique los nombres IUPAC de los siguientes productos naturales.



- acetato de etilo / pentan-3-ona
- formiato de metilo / hexan-3-ona
- propanoato de metilo / hexan-3-ona
- metanoato de etilo / hexan-4-ona

2. ¿De los siguientes compuestos oxigenados de fórmula general  $C_4H_{10}O$  cuál corresponde al *tert*-butanol?



- Solo el compuesto I
- Solo el compuesto II
- Los compuesto II y IV
- Los compuestos I, II y III

3. Un medicamento que contiene el mismo principio activo y está disponible con la misma potencia y dosificación que su equivalente de marca, se denomina

- Análogo mejorado del fármaco original
- Medicamento genérico
- Medicamento siamés *twin-drug*
- Medicamento *me-too*

4. ¿Qué se entiende por prototipo líder (*lead compound*) en química farmacéutica?

- Un medicamento que contenga el compuesto prototipo
- Un medicamento líder en un área particular de la medicina
- Un compuesto que actúa como punto de partida para el diseño y desarrollo de fármacos
- El primer fármaco en ser prescrito para una dolencia particular

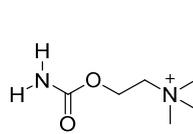
5. ¿Qué se entiende por ADME en farmacocinética?

- Afinidad, dosificación, marketing, eficacia
- Absorción, distribución, metabolismo, excreción
- Agonismo, dependencia, movilidad, eficacia
- Antagonismo, deficiencia, media, expulsión

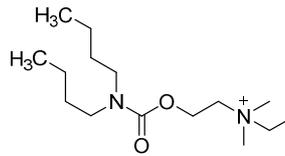
6. ¿Cuál de las siguientes características debe ser establecida necesariamente antes de la búsqueda de un prototipo líder?

- El farmacóforo
- Las relaciones estructura-actividad
- Un bioensayo para comprobar si tiene actividad
- La patente

7. Para estudiar la farmacodinámica del carbacol, un agonista colinérgico, se sintetizó la dibutolina. ¿Qué estrategia de diseño de fármacos se utilizó?



carbacol



dibutolina

- Simplificación
- Homologación
- Rigidificación
- Bloqueo conformacional

8. ¿Cuál de las siguientes afirmaciones es verdadera?

- Un medicamento es una sustancia que se usa en el diagnóstico, la mitigación, el tratamiento o la prevención de una enfermedad o el alivio de las molestias
- Las siglas de la FDA significan "Food and Drug Association"
- La FDA es la agencia europea responsable de la regulación y supervisión de la prescripción y comercialización de medicamentos farmacéuticos
- El desarrollo preclínico implica ensayos biológicos *in vitro*

9. ¿Cuál de las siguientes afirmaciones es verdadera?

- Una patente dura 25 años
- El desarrollo clínico de fase II implica la investigación con pacientes
- Los principales costos asociados al desarrollo de fármacos se encuentran en las fases clínicas
- La farmacocinética implica eliminar o incorporar grupos funcionales que son relevantes para la bioactividad para mejorar la absorción

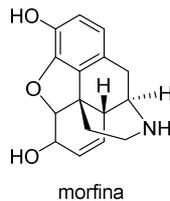
10. ¿Cuál de las siguientes afirmaciones es verdadera?

- Un "blockbuster" es un medicamento que alcanza ventas de \$ 10000 millones por año
- Cuando se registra un medicamento, la compañía proporciona un nombre (el nombre internacional no propietario) que es el nombre IUPAC dado a la estructura química del medicamento
- Una pipeline es un fármaco comercializado con ventas superiores a \$ 1000 millones por año
- La fase clínica III implica ensayo con pacientes voluntarios

11. Fármacos provistos de alquenos y anillos aromáticos en su estructura pueden interactuar con el receptor a través de:

- Enlaces de hidrógeno
- Fuerzas de Van der Waals y/o apilamientos  $\pi$
- Enlaces iónicos
- Este tipo de grupos no participa en la unión con el receptor

12. La morfina es un importante analgésico. ¿Qué interacciones participan en unir el grupo hidroxilo fenólico al sitio de enlace?

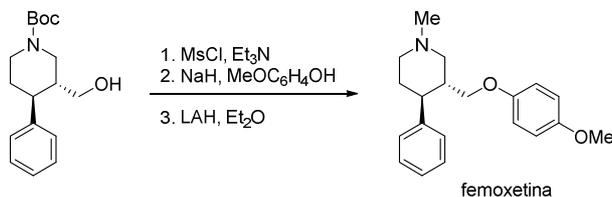


- Interacciones de Van der Waals
- Interacciones iónicas
- Interacciones por enlace de H
- El fenol no puede participar en la unión

13.Cuál de las siguientes afirmaciones describe un punto alostérico

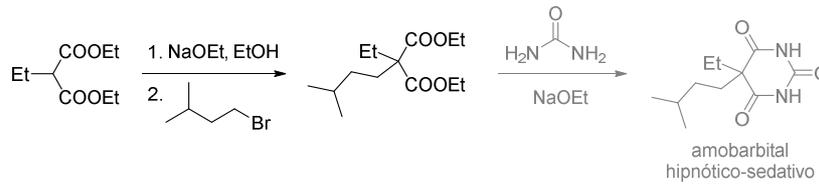
- Es un punto reactivo en aminoácidos con cadenas laterales alifáticas
- Es un punto de unión del enzima que puede aceptar una gran variedad de moléculas de formas diferentes
- Es un punto de unión, distinto del centro activo, que induce una modificación de la actividad de una enzima cuando es ocupado por un fármaco
- Es el centro activo del enzima

14. La síntesis de femoxetina puede llevarse a cabo según el siguiente esquema sintético. ¿Qué mecanismo sigue la segunda de las etapas de esta transformación?



- A<sub>N</sub>
- S<sub>N</sub>2
- S<sub>N</sub>Ar
- S<sub>E</sub>Ar

15. ¿Con qué nombre se conoce a la siguiente transformación durante la síntesis de amobarbital?



- Acilación de Robinson  
 Alquilación  
 Reacción de Claisen  
 Síntesis acetilacética

16. ¿Qué tipo de síntesis se lleva a cabo durante la preparación de un fármaco a partir de un sustrato extraído de una fuente natural?

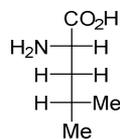
- Síntesis global  
 Síntesis parcial  
 Síntesis lineal  
 Síntesis convergente

17. Dadas las estructuras de los siguientes hidroxiácidos empleados en la resolución de fármacos racémicos:



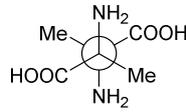
- Se trata de diastereoisómeros  
 Se trata de enantiómeros  
 Ambas son representaciones de la misma molécula  
 Se trata de epímeros en el C-2

18. Indique la configuración absoluta del siguiente aminoácido natural empleado como sustrato de partida en la síntesis a través del *chiral pool*.



- D-Leucina  
 Ácido (2*R*)-2-amino-4-metilpentanoico  
 (2*R*,4*S*)-Leucina  
 (2*S*)-Leucina

19. Dada la siguiente estructura empleada en la resolución de fármacos quirales por coprecipitación.



- Se trata de una molécula levógira.
- Se trata de una molécula dextrógira.
- El signo de su rotación específica es (+).
- Se trata de un isómero *meso*.

20. La relación de actividades entre el eutómero y el distómero se denomina

- Relación enantiomérica
- Relación eufemística
- Relación eudísmica
- Relación isomérica

21. Se denomina racemorfano al fármaco formado por una mezcla equimolecular de levofanol y dextrofanol. Indica cuál de las siguientes afirmaciones es correcta

- Levofanol y dextrofanol son enantiómeros
- Levofanol y dextrofanol son racémicos
- Racemorfano es ópticamente activo
- Racemorfano es farmacológicamente inactivo

22. Se dispone de una mezcla de enantiómeros en una proporción 95:5

- La mezcla será dextrógira
- La pureza óptica y el exceso enantiomérico es 90%
- La pureza óptica es 95%
- La mezcla es ópticamente inactiva

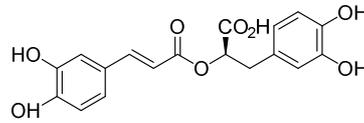
23. Se denomina síntesis asimétrica a:

- La síntesis de un compuesto quiral desde un sustrato quiral
- La síntesis de un compuesto quiral desde un sustrato aquiral proquiral
- La síntesis de un compuesto quiral desde un sustrato aquiral no proquiral
- La síntesis de un compuesto quiral por resolución del racemato

24. La prostaglandinas derivan biogenéticamente:

- Acetato
- Ácido mevalónico
- Ácido shikímico
- Fenilalanina

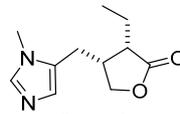
25. El *ácido rosmarínico* es un fenilpropanoide natural presente en plantas aromáticas como el romero y la salvia ¿Cuál de las siguientes afirmaciones es correcta?



ácido rosmarínico

- Deriva biogénicamente del acetato
- Deriva biogénicamente del ácido shikímico
- Deriva biogénicamente del ácido mevalónico
- Deriva biogénicamente del geraniol

26. Pilocarpina es un alcaloide derivado de:



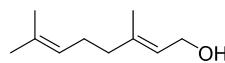
pilocarpina

- L-Lisina
- L-Ornitina
- L-Tirosina
- L-Histidina

27. Para la determinación de la secuencia biogénica de un producto natural se utiliza la técnica de:

- Cromatografía
- Extracción
- Destilación
- Marcaje isotópico

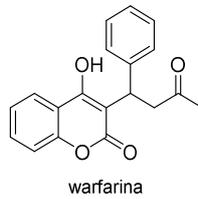
28. El geraniol es un terpeno natural. ¿A qué grupo de terpenos pertenece?



geraniol

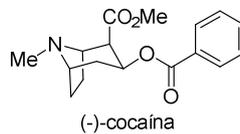
- Monoterpenos
- Sesquiterpenos
- Diterpenos
- Hemiterpenos

29. La *warfarina*, cuya estructura se representa a continuación, es un fármaco anticoagulante. Indique cuál de las siguientes afirmaciones es correcta.



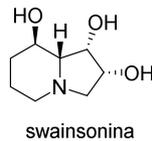
- Es un alcaloide oxigenado
- Es un terpenoide
- Tiene estructura de cumarina
- Tiene estructura de Iridoide

30. La (-)-cocaína es un narcótico natural derivado de:



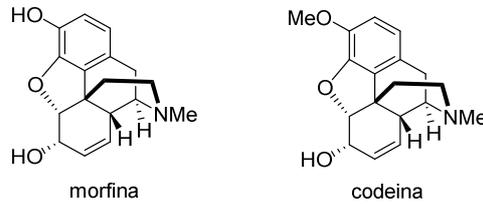
- Narcotamina
- Tropamina
- 3- $\alpha$ -Tropanol
- 3- $\beta$ -Tropanol

31. Swainsonina es un alcaloide natural polihidroxiado con interesantes propiedades biológicas.



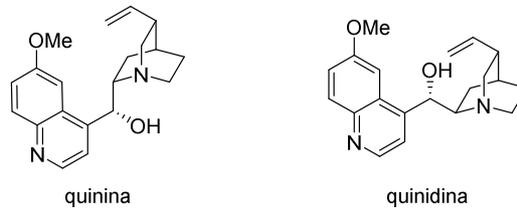
- Pirrolicidina
- Indolizidina
- Quinolicidina
- Tirosina

**32.** Morfina y Codeína, cuyas estructuras se representan, poseen importante actividad analgésica y narcótica. Indique cuál de las siguientes afirmaciones es correcta:



- Morfina se metila en el hígado para dar codeína
- Codeína se demetila en el hígado para dar morfina
- Codeína es un análogo de morfina con mayor actividad analgésica
- Ambos son alcaloides derivados de triptófano

**33.** Quinina y quinidina son alcaloides naturales de Cinchona. Indique cuál de las siguientes afirmaciones es correcta.

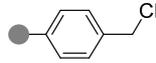


- Son enantiómeros
- Son diastereoisómeros
- Son confórmers
- Son regioisómeros

**34.** Un laboratorio farmacéutico desea sintetizar todos los dipéptidos posibles que contienen los aminoácidos (Thr, Ile, Phe, Lys, Ser). ¿Cómo llevaría a cabo la síntesis mediante técnicas combinatorias?

- Mezclando los cinco aminoácidos y añadiendo la mezcla a una resina para que los aminoácidos se unan a la resina. Posteriormente se agrega otra combinación de los cinco aminoácidos para que los dipéptidos se formen en la resina
- Poner un aminoácido diferente en cada recipiente para que cada aminoácido se una a la resina. Mezclar todos en un recipiente y dividir de en cinco recipientes. Añadir un aminoácido diferente a cada recipiente de manera que se formen todos los dipéptidos posibles
- Poner un aminoácido diferente en cada recipiente para que cada aminoácido se una a la resina. luego añadir un aminoácido diferente a cada recipiente para que se formen los dipéptidos
- Poner un aminoácido diferente en cada recipiente para que cada aminoácido se una a la resina. Después agregar una mezcla de los cinco aminoácidos a cada recipiente para que se formen los dipéptidos posibles

35. La resina de Merrifield, representada en la figura, es una de las resinas más comunes empleada en síntesis en fase sólida. La unión del sustrato de partida, por ejemplo un aminoácido, a la resina ha de realizarse a través del:



- Anillo aromático
- Carbono bencílico
- Átomo de cloro
- Hidrógeno bencílico

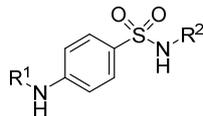
36. ¿Cuál de los siguientes grupos protectores de aminas empleados en síntesis en fase sólida se retira por medio de una base, por ejemplo, piperidina?

- Fmoc
- Boc
- t*-Bu
- Bn

37. ¿Cuántos tripéptidos se obtendrían por el método mix and split empleando 4 aminoácidos diferentes en cuatro recipientes?

- Un único tripéptido
- Tres tripéptidos
- Nueve tripéptidos
- Veintisiete tripéptidos

38. Estudios SAR en sulfonamidas han concluido que



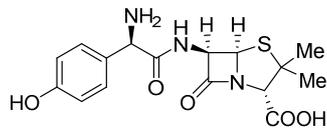
- Se permiten variaciones en R<sup>1</sup>
- Se permiten variaciones únicamente en R<sup>2</sup>
- La sustitución *meta* en el anillo bencénico es tolerable
- El grupo sulfonamida es esencial aunque no interviene en la unión con su diana

39. La obtención de penicilinas mejoradas:

- Se puede llevar a cabo por semisíntesis desde 6-ACA obtenido éste por hidrólisis enzimática
- Se puede llevar a cabo por síntesis total
- Se puede llevar a cabo por fermentación o por semisíntesis
- Se puede llevar a cabo por semisíntesis desde ácido 6-aminocefalosporánico



40. Indica a qué grupo de antibióticos  $\beta$ -lactámicos pertenece la siguiente estructura:



- Sulfamidas
- Penicilinas
- Cefalosporinas
- Tetraciclinas