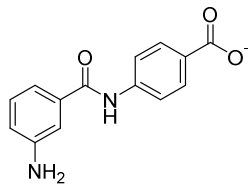


Tema 2 El Fármaco y su Desarrollo. Test de Autoevaluación 2. Solución

1. El parámetro que indica la concentración de fármaco necesaria para inhibir la actividad de un enzima en un 50% se denomina:

- FC₅₀
- IC₅₀
- EC₅₀
- CE₅₀

2. ¿Cuál de los heteroátomos presentes en la estructura representada es el aceptor de hidrógeno más fuerte?



- El nitrógeno anilínico
- El nitrógeno de la amida
- El oxígeno cargado del grupo carboxilato
- El oxígeno carbonílico

3. ¿Cuál de las siguientes estrategias aumentará la solubilidad en agua y la polaridad de un fármaco?

- Eliminación de grupos funcionales polares
- Adición de grupos alquilo
- Sustitución de un anillo aromático por un anillo heterocíclico que contenga un átomo de nitrógeno
- Reemplazar un grupo alquilo por otro grupo alquilo de mayor tamaño

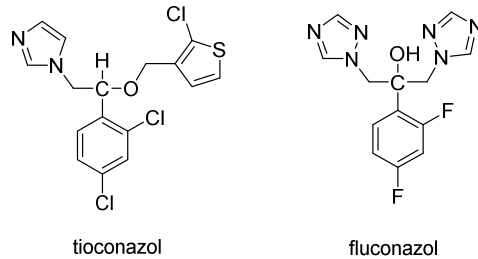
4. ¿Cuál de las siguientes afirmaciones es la que mejor describe las relaciones estructura-actividad (SAR)?

- El estudio de cuáles son los grupos funcionales importantes para la reactividad química del fármaco
- El estudio de las propiedades fisicoquímicas que son importantes para la absorción de un fármaco
- El estudio de las características estructurales de un fármaco que son importantes para su actividad biológica
- El estudio de las características estructurales de un medicamento que son importantes para su estabilidad química

5. ¿Cuál de las siguientes áreas de estudio no es parte de los ensayos preclínicos?

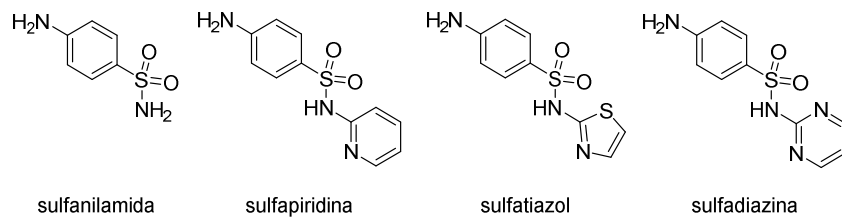
- Toxicología
- Metabolismo del fármaco
- Farmacología
- Relaciones estructura-actividad

6. Tioconazol es un agente antifúngico no polar que se utiliza por vía tópica, mientras que el fluconazol es un medicamento polar que se utiliza sistémicamente. ¿Cuál de las siguientes afirmaciones es correcta?



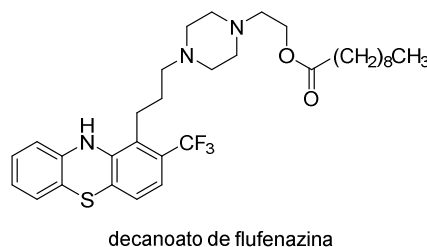
- Los anillos heterocíclicos del fluconazol contienen más átomos de nitrógeno por lo que el fármaco es menos polar
- El aumento de polaridad disminuye la solubilidad en agua
- Los átomos de flúor en fluconazol disminuyen la solubilidad en agua
- El grupo hidroxilo en fluconazol aumenta la solubilidad en agua

7. Para aumentar la absorción en fármacos derivados de sulfanilamida se prepararon los análogos que se muestran en el esquema. ¿Cuál ha sido el objetivo de las modificaciones realizadas?



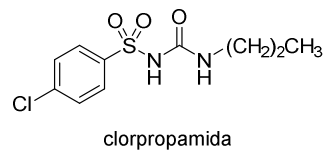
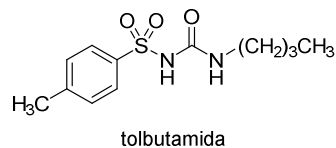
- Aumentar la acidez del prototipo
- Aumentar la basicidad
- Preparar análogos de mayor pK_a
- Comprobar que el pK_a no afecta a la absorción de sulfanilamida

8. El decanoato de flufenazina es un éster profármaco de la flufenazina, fármaco antipsicótico, que se administra por inyección intramuscular. ¿Cuál de las siguientes afirmaciones es verdadera?



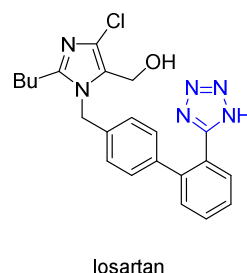
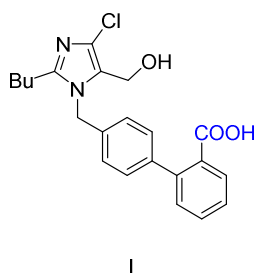
- La hidrólisis del éster libera el grupo ácido carboxílico de flufenazina
- La hidrólisis del éster liberará el ácido decanoico que es tóxico
- El éster es activo *in vitro* pero no *in vivo*
- El éster es activo *in vivo* y no *in vitro*

9. ¿Por qué tiene una actividad antibiótica mayor tolbutamida que clorpropamida?



- El grupo metilo de tolbutamida es susceptible al metabolismo del fármaco mientras que átomo de cloro de la clorpropamida no lo es
- El grupo urea de tolbutamida es más susceptible a la hidrólisis que el grupo urea de la clorpropamida
- El átomo de cloro de clorpropamida tiene un efecto electrón-atractor en el anillo aromático y estabiliza la molécula
- El grupo sulfonamida de tolbutamida es más susceptible a la hidrólisis que el grupo sulfonamida de clorpropamida

10. Losartan, un agente anti-hipertensivo, fue desarrollado a partir de la estructura (I) mediante sustitución del grupo carboxilo por un anillo de tetrazol. ¿Cuál de las siguientes afirmaciones es correcta?



- El anillo de tetrazol representa un bioisótero del grupo carboxilo para aumentar la absorción del fármaco
- El anillo de tetrazol representa un bioisótero del grupo carboxilo para disminuir la absorción del fármaco
- El anillo de tetrazole aumenta la hidrofilia del compuesto
- Losartan se ioniza con más facilidad que la estructural