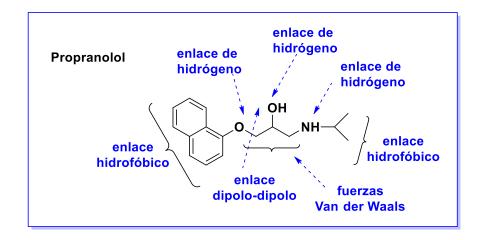
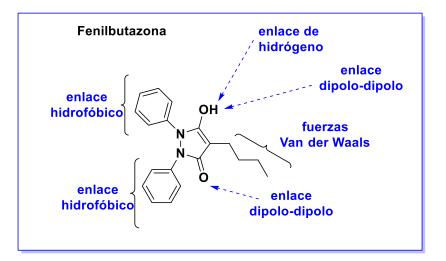


1.- Indique cuatro tipos de enlace que se formarán en la unión de los siguientes fármacos con su receptor:





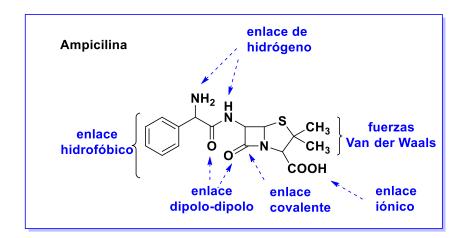






2.- Indique cuatro tipos de enlace que se formarán en la unión de los

siguientes fármacos con su receptor:







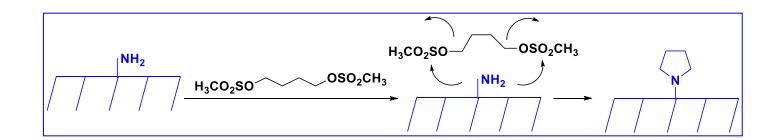


3.- Justifique la diferencia de actividad de la siguiente pareja de estructuras, indicando su relación estructural.

RESPUESTA:

El (II) sería el análogo rígido del busulfano (I), que es un fármaco que tiene actividad como antineoplásico. Actúa por alquilación de grupos nucleófilos de la diana biológica Su actividad antineoplásica, está relacionada con la capacidad de formar un derivado pirrolidínico por bis-1,4-alquilación de algunos grupos amino dispuestos adecuadamente en la diana biológica.

El compuesto (II) no podrá formar el derivado pirrolidínico por lo tanto no será activo









4.- Justifique la diferencia de actividad de la siguiente pareja de estructuras, indicando su relación estructural. Prediga qué probable actividad farmacológica tendrán.

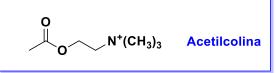
RESPUESTA:

El primer compuesto será un agonista nicotínico, mimetiza la conformación sesgada de la acetilcolina. Ésta, reacciona con el receptor nicotínico con la conformación sesgada o sinclinal, por lo tanto provocará un aumento del tono muscular, dilatación de la pupila, aumento del ritmo cardiaco.

El segundo compuesto, será un agonista muscarínico, mimetiza la conformación antiperiplanar de la acetilcolina. Ésta, reacciona con el receptor muscarínico con la conformación transoide o antiperiplanar. La respuesta muscarínica implica inhibición cardiaca, vasodilatación, contracción de la pupila, aumento de las secreciones, peristaltismo etc.

La relación entre los dos son diastereoisómeros









EJERCICIOS DEL TEMA 5 QF1 – PREGUNTAS FIR

- 1. El índice eudísmico es un parámetro con interés farmacológico que expresa la relación entre: (FIR 2013)
 - 1. Dos fármacos diasterómeros.
 - 2. Dos fármacos bioisósteros.
 - 3. Dos enantiómeros. CORRECTA
 - 4. Un fármaco y un profármaco, análogo estructural.
 - 5. Dos modificaciones estructurales, una hidrofílica y otra lipofílica, de un determinado fármaco.
- 2. ¿Qué tipo de interacción se establece entre el grupo fenólico de la molécula de morfina y el receptor opioide? (FIR 2023)
 - 1- Enlace iónico.
 - 2- Enlace de hidrógeno. CORRECTA
 - 3- Interacción pi-catión.
 - 4-Interacción dipolo- dipolo.



