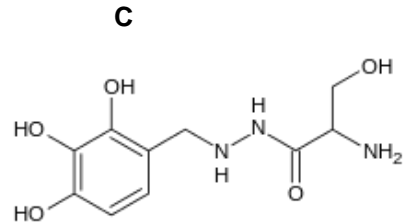
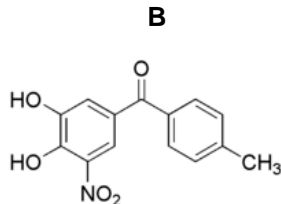
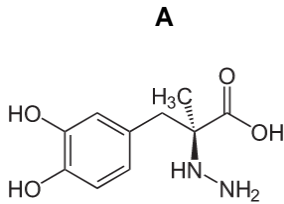


PRUEBA A2

Nombre: Fecha: 1 de marzo, 2022

Esta prueba contiene 42 preguntas de selección múltiple. Dispone de 2 horas para responder. No olvide traspasar sus respuestas a la hoja de respuestas y lea cuidadosamente las instrucciones de la hoja de respuesta antes de firmarla. No se descuenta puntaje por pregunta mal respondida.

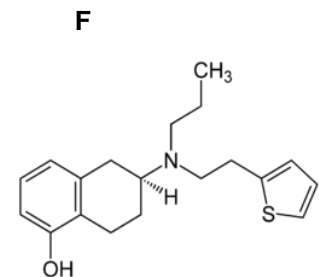
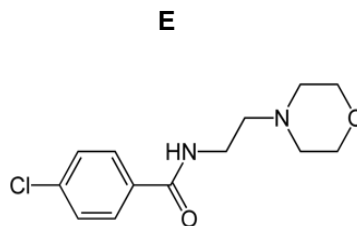
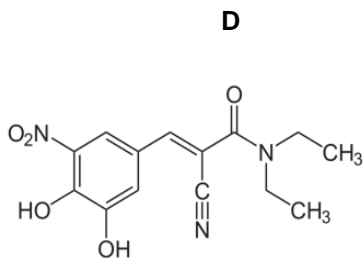
1. Las siguientes estructuras químicas (**A**, **B** y **C**) corresponden a fármacos antiparkinsonianos. Respecto de ellas, seleccione correctamente sus respectivas DCI y mecanismos de acción.



DCI	Mecanismo de acción
I A: carbidopa	Inhibe MAO
II B: tolcapona	Inhibe COMT
III C: benserazida	Inhibe dopamina descarboxilasa
IV B: selegilina	Inhibe COMT

- a) Solo I
- b) II y III**
- c) Solo IV
- d) III y IV
- e) Solo III

2. ¿Cuál(es) de los siguientes enunciados respecto de las estructuras químicas **D**, **E** y **F**, es(son) correcta(s)?

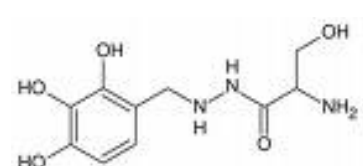
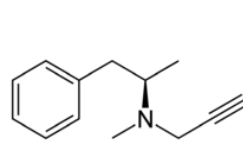
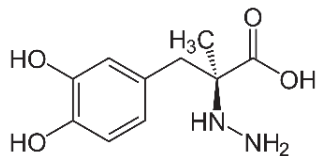


- I. D es un inhibidor de la COMT
- II. E es un inhibidor de la MAO
- III. F es un antagonista de los receptores dopaminérgicos
- IV. D es un inhibidor de la L-dopamina descarboxilasa periférica
- V. F es un agonista de receptores dopaminérgicos

- a) I, II y V**
- b) Solo II
- c) II, III y V
- d) Solo IV
- e) Solo III

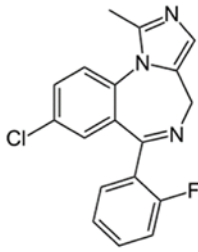
3. ¿Cuál(es) de los siguientes fármacos representados en las estructuras **C**, **D** y **E**, tiene(n) **por sí mismo** efecto agonista dopaminérgico?

- a) Solo C**
- b) Solo D
- c) C y D
- d) Solo E
- e) D y E

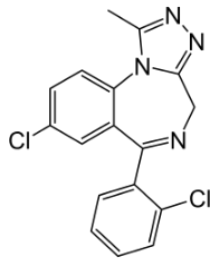


4. Si en la estructura química general de las benzodiazepinas se realiza el cambio del anillo A por un tiofeno con un sustituyente etilo en posición 7, y la adición de un F en posición 2', se obtiene un compuestorespecto del compuesto de origen.
- inactivo
 - de mayor efecto hipnótico
 - de mayor efecto relajante muscular
 - de vida media más corta
 - de mayor efecto ansiolítico, pero sin efecto hipnótico
5. En la estructura química del tetrazepam, el reemplazo del C=O por C=S originará un compuesto que tiene..... que el compuesto de origen.
- mayor afinidad por el receptor
 - menor afinidad por el receptor
 - igual afinidad por el receptor
 - cambia la solubilidad
 - que no tiene actividad
6. Si en la estructura química del lormetazepam se reemplaza el sustituyente de la posición 3 por -CH₃, se originará un compuesto que tiene.....que el compuesto de origen.
- más afinidad por el receptor
 - igual afinidad
 - vida media más larga
 - vida media más corta
 - menor actividad
7. Si en la estructura química del lorazepam se reemplaza el sustituyente de la posición 3 por un -CH₃, se originará un compuesto que tiene.....respecto del compuesto de origen
- un impedimento estérico que lo inactiva
 - características de un profármaco
 - mayor liofilia
 - un compuesto quiral en que el racemato S(-) es el mayor responsable de la actividad farmacológica
- I y III
 - Solo II
 - Solo III
 - III y IV
 - II y III
8. Si en la estructura química del quazepam se reemplaza el sustituyente de la posición 5 por un 1,2-dihidrociclohexano, se originará un compuesto que tiene.....que el compuesto de origen.
- mejores propiedades ansiolíticas
 - mejor propiedad relajante muscular
 - mejor efecto hipnótico
 - mejor propiedad anticonvulsivante
 - mejor propiedad hipnótica
9. En los siguientes grupos de fármacos la duración de la acción es:
- | | | |
|------|-----------------------|--|
| I) | clobazam, ketazolam | |
| II) | alprazolam, temazepam | |
| III) | midazolam, triazolam | |
- I) corta II) larga III) intermedia
 - I) larga II) corta III) intermedia
 - I) intermedia II) larga III) corta
 - I) larga II) intermedia III) corta
 - I) intermedia II) corta III) larga

10. Las siguientes estructuras (B y C) se caracterizan porque:



B

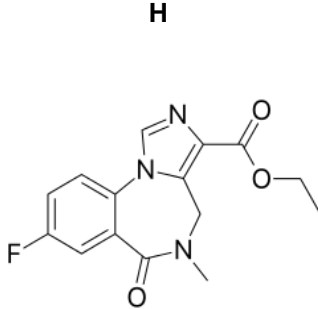


C

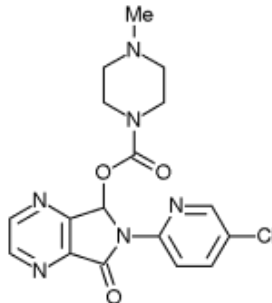
- I. Se metabolizan por alfa hidroxilación
- II. El metabolito principal es un derivado inactivo
- III. El metabolito principal es de vida media corta
- IV. Ambos tienen un marcado efecto ansiolítico por sobre el efecto hipnótico

- a) I y III
- b) II y III
- c) III y IV
- d) I y IV
- e) I, III y IV

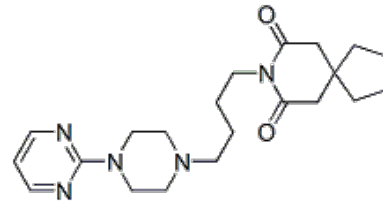
11. Las siguientes estructuras (H, I y J) se caracterizan porque:



H



I



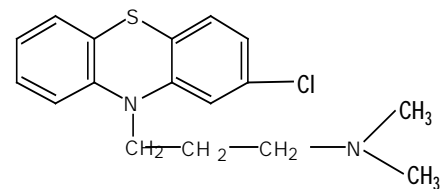
J

- I. H es un antagonista de las benzodiazepinas
- II. H es un agonista parcial del receptor de benzodiazepinas
- III. J e I son hipnóticos derivados de las pirazina
- IV. J es un ansiolítico puro

- a) II y III
- b) I y III
- c) III y IV
- d) I y IV
- e) II, III y IV

12. En la siguiente estructura química, la sustitución del grupo dimetilamino por un anillo piperidínico, generará un compuesto

- a) con actividad sedante y elevado trastorno motor
- b) con actividad sedante y moderado trastorno motor
- c) con escasa actividad sedante y moderado trastorno motor
- d) con escasa actividad sedante y elevado trastorno motor
- e) con moderada actividad sedante y escaso trastorno motor

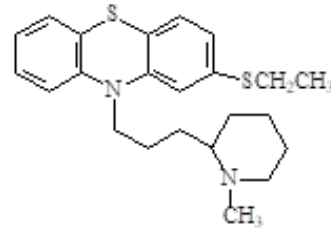


13. La presencia del hidroxilo en la pipotiazina posibilita su:

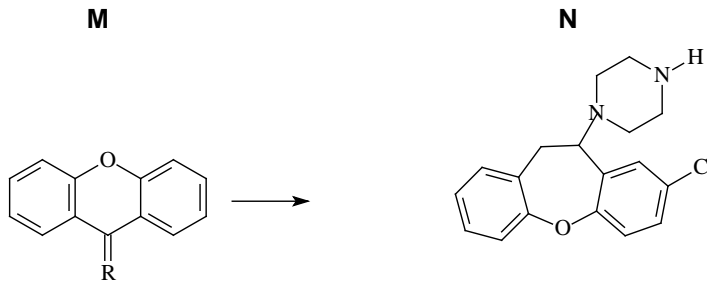
- a) esterificación para formar soluciones de depósito
- b) eliminación más rápida por ser un grupo muy polar
- c) la posibilidad de formar sales de depósito
- d) no influye mayormente en sus propiedades farmacocinéticas
- e) alta hidrofiliya y baja absorción

17. Si en el siguiente fármaco se realiza el cambio estructural del grupo $-SCH_2CH_3$ por $-OCH_3$, el compuesto resultante tendrá.....que el compuesto de origen.

- a) mayor potencia
- b) menor potencia**
- c) mayor vida media
- d) menor vida media
- e) ninguna de las anteriores

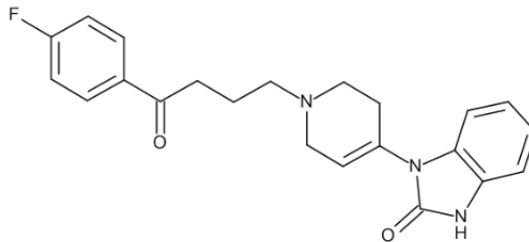


18. El compuesto representado por la estructura **M** exhibirá propiedades como y los cambios estructurales indicados generarán un compuesto (**N**)



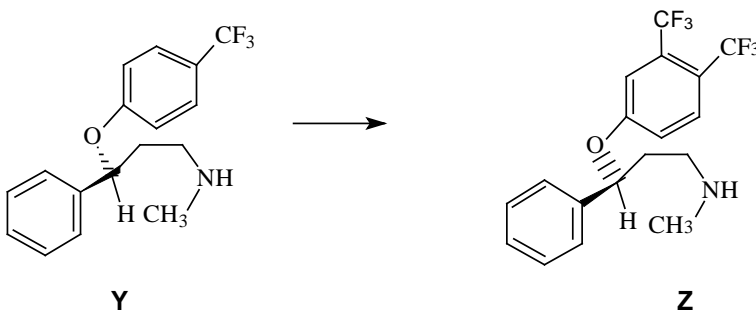
- | | |
|-------------------------|-------------------------------|
| M | N |
| a) antipsicótico | con idénticas propiedades |
| b) antidepresivo | antipsicótico y antidepresivo |
| c) antidepresivo | antipsicótico |
| d) antipsicótico | antidepresivo |
| e) antidepresivo | antidepresivo |

19. Para la siguiente estructura química, ¿cuáles de las siguientes aseveraciones son correctas?



- I. La unión del grupo amino terciario al 4º átomo de carbono del esqueleto es esencial para la actividad neuroléptica
 - II. Sólo el alargamiento de la cadena propílica disminuye la actividad neuroléptica
 - III. El átomo de flúor es esencial
 - IV. El grupo amino terciario puede estar incorporado solo a anillos de 6 átomos insaturados para mantener la potencia neuroléptica
- a) II y III
 - b) I y II
 - c) III y IV
 - d) I y IV
 - e) I, III y IV**

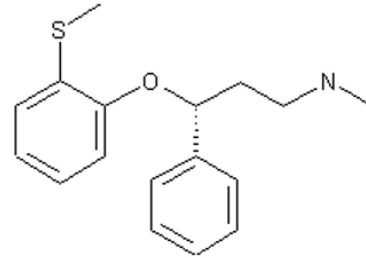
20. En la siguiente estructura, el cambio introducido en **Y** originará un compuesto (**Z**) que.....



- a) tiene la misma actividad que el compuesto de origen
- b) pierde la actividad respecto el compuesto de origen**
- c) cambia totalmente las propiedades farmacológicas respecto el compuesto de origen
- d) tiene actividad mayor que el compuesto de origen
- e) tiene igual afinidad por SERT que por NERT

21. La siguiente estructura química se caracteriza porque tiene.....

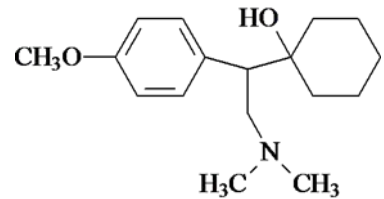
- I. el mismo grado de selectividad y afinidad por SERT y por NERT
- II. alta selectividad solo por SERT
- III. alta selectividad solo por transportador de dopamina
- IV. alta selectividad solo por NERT



- a) Solo I
- b) II y III
- c) Solo III
- d) Solo II
- e) Solo IV

22. En la siguiente estructura química, la O-demetilación produce:

- I. Un compuesto inactivo
- II. Un compuesto activo
- III. Un compuesto que cambia radicalmente la afinidad por su blanco farmacológico
- IV. Un compuesto que es 10 veces más potente en inhibir SERT que NERT



- a) Solo I
- b) Solo II
- c) Solo III
- d) III y IV
- e) II y IV

23. ¿Cuál(es) de las siguientes aseveraciones es(son) correcta(s)?

- I) en los TCAs la estructura tricíclica está asociada con alta afinidad a sus receptores en el SNC
- II) Los TCAs generalmente son de estructura 6-7-6, con anillo central saturado o insaturado
- III) La cadena debe estar unida a uno de los átomos del anillo de 7, pero debe ser de tres átomos de carbono
- IV) La cadena central puede ser propilo o propilideno solo con un grupo amino terminal primario

- a) Solo I
- b) Solo III
- c) II y III
- d) II y III
- e) II, III y IV

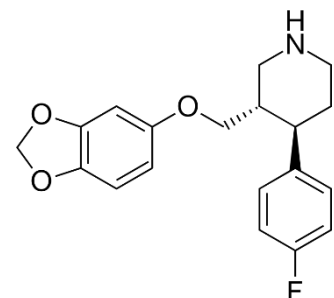
24. ¿Cuál(es) de las siguientes aseveraciones es(son) correcta(s)?

- I) en la dihidrodibenzazepina los halógenos o ciano en posición 3 cambian la afinidad sólo por SERT
- II) La ramificación de cadena en la dihidrobenzazepina reduce la afinidad del fármaco por SERT o NERT 100 veces
- III) El isómero Z (cis) para propilideno en la doxepina es importante para la selectividad y actividad del transportador

- a) Solo I
- b) Solo II
- c) Solo III
- d) II y III
- e) I, II y III

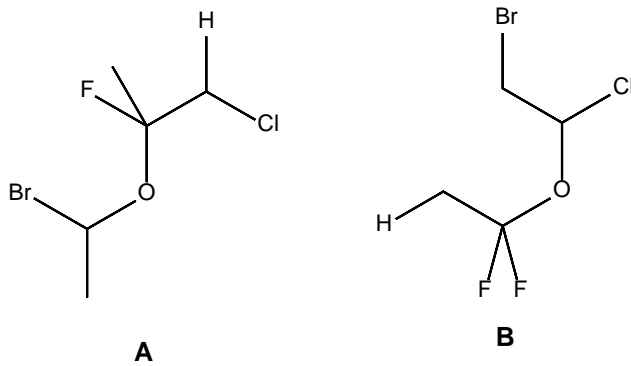
25. ¿Cuál(es) de las siguientes aseveraciones, respecto de la siguiente estructura es(son) correcta(s)?

- I. es selectivo para SERT
- II. Si el H de la amina se reemplaza por un grupo metilo la afinidad por SERT aumenta 100 veces
- III. El reemplazo del F por H o CH₃ reduce 10 veces la afinidad
- IV. Sustitución de la posición 2 de cualquier anillo aromático reduce la afinidad de 10 a 100 veces siendo mayor en el anillo fenoxilo



- a) Solo I
- b) Solo II
- c) Solo III
- d) II y III
- e) I, II y IV

30. Considerando que las siguientes dos estructuras son anestésicos generales, ¿cuáles son sus logP según Cates? (Ver tabla con valores).



Grupo funcional	Valor
F	-0,5
Br	2
Cl	1,5
Metilo	0,5
Ester	2
Eter	1
Amida	0
C, CH, CH ₂	0

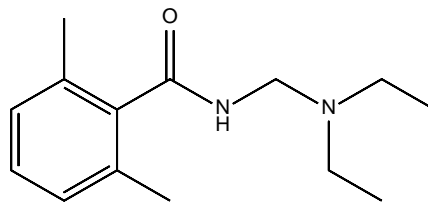
- a) A = 5 ; B = 4
 b) A = 4 ; B = 5
 c) A = 3 ; B = 4
 d) A = 5 ; B = 3,5
 e) A = 4 ; B = 3,5

31. Para los anestésicos generales de la pregunta anterior, ¿cuál es el orden de potencia entre ambos, según la siguiente ecuación QSAR?

$$\text{Potencia anestésica} = -\frac{1}{4} * (\log P)^2 + \log P + 3$$

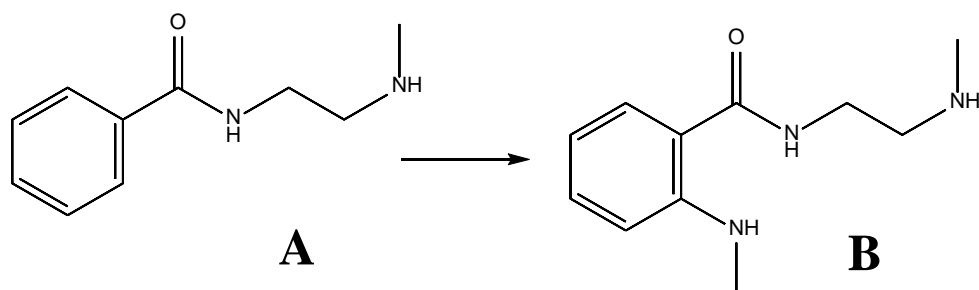
- a) A > B, donde la potencia anestésica de A = 1,75
 b) B > A, donde la potencia anestésica de B = 3,00
 c) A = B, donde la potencia anestésica de A = 1,75
 d) A > B, donde la potencia anestésica de B = 3,75
 e) B > A, donde la potencia anestésica de A = 3,00

32. Respecto de lidocaína, la siguiente estructura:



- a) Tendrá un inicio de acción más rápido.
 b) Será más potente.
 c) Tendrá mayor duración en su acción.
 d) Será menos potente.
 e) Tendrá un inicio de acción más lento.

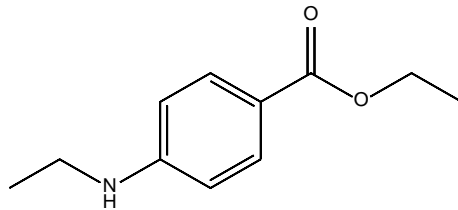
33. El anestésico local A ha sido modificado para dar la estructura B. Al respecto, seleccione cual/es de la/s siguiente característica/s NO se verá/n afectada/s por el cambio estructural.



- I. Inicio de la acción anestésica.
 II. Potencia anestésica local.
 III. Tiempo de duración de la acción anestésica.

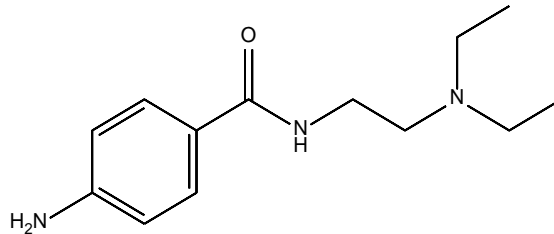
- a) Solo I
 b) Solo II
 c) Solo III
 d) I y II
 e) II y III

34. Respecto de benzocaína, la siguiente estructura:



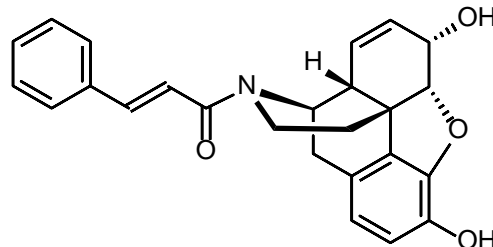
- a) Tendrá un inicio de acción más rápido.
- b) **Será más potente.**
- c) Tendrá mayor duración en su acción.
- d) Será menos potente.
- e) Tendrá un inicio de acción más lento.

35. Respecto de procaína, la siguiente estructura:



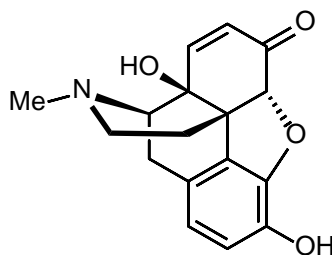
- a) Tendrá un inicio de acción más rápido.
- b) Será más potente.
- c) **Tendrá mayor duración en su acción.**
- d) Será menos potente.
- e) Tendrá un inicio de acción más lento.

36. Según las características estructurales, el siguiente compuesto será:



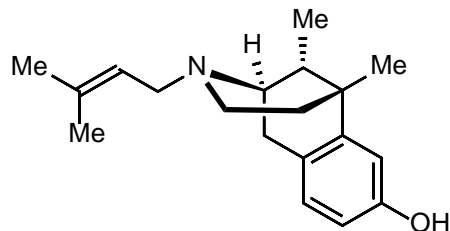
- a) Agonista opioide de receptores μ .
- b) Antagonista opioide de receptores μ .
- c) **Inactivo, sin afinidad al sitio de unión de los opioides.**
- d) Más potente que morfina.
- e) Menos potente que oximorfina.

37. Según las características estructurales, el siguiente compuesto será:



- a) **Agonista opioide de receptores μ .**
- b) Antagonista opioide de receptores μ .
- c) Inactivo, sin afinidad al sitio de unión de los opioides.
- d) Más potente que nalorfina.
- e) Menos potente que morfina.

38. Según las características estructurales, el siguiente compuesto será:



- a) Agonista opioide de receptores κ .
- b) Antagonista opioide de receptores μ .**
- c) Inactivo, sin afinidad al sitio de unión de los opioides.
- d) Más potente que nalorfina.
- e) Menos potente que morfina.

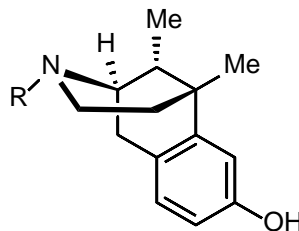
39. Seleccione cuál de los siguientes cambios estructurales realizados a la morfina, producirá el mayor aumento de actividad agonista.

- a) Metilación del grupo hidroxilo en posición 3.
- b) Eliminación del anillo B.
- c) Eliminación del anillo E.
- d) Introducción de un grupo hidroxilo en posición 14 alfa.**
- e) Inserción de un grupo butilo en el nitrógeno básico.

40. Seleccione cuál de los siguientes cambios estructurales realizados a la naloxona, producirá el mayor aumento de actividad antagonista.

- a) Reducción del grupo carbonilo en posición 6.
- b) Eliminación de los anillos C y D.
- c) Eliminación del nitrógeno del anillo E.
- d) Introducción de un grupo hidroxilo en posición 7.
- e) Eliminación del anillo D.**

41. Para la siguiente estructura, seleccione cuál/es de el/los sustituyente/s de la tabla (A, B, C) dará/n origen a un antagonista opioide μ .



A	B	C

- a) Solo A
- b) Solo B**
- c) A y B
- d) B y C
- e) A, B y C

42. Seleccione la alternativa correcta.

- a) El aumento de lipofilia en el anillo C, implica un aumento de la actividad agonista de las moléculas con afinidad al receptor μ .
- b) La presencia de un nitrógeno básico en el esqueleto de la morfina es fundamental para la actividad analgésica.**
- c) Los derivados de fentanilo, corresponden a las estructuras más potentes conocidas como agonistas y antagonistas opioides.
- d) Las modificaciones estructurales afectan en la misma proporción a los agonistas y a los antagonistas.
- e) La estrategia de rigidificación permitió conocer la estructura farmacofórica de los derivados opioides.