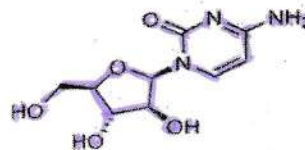


Cocher la ou les réponse(s) juste(s) :

corrigé type

1/ La structure ci-dessous correspond à :

- a ☒ La cytarabine
b ☐ La fludarabine
c ☐ La gemcitabine
d ☐ Aucune de ces propositions n'est juste



2/ La methyl dopa :

- a ☒ Est indiquée dans la prise en charge de l'hypertension artérielle durant la grossesse
b ☐ Est une molécule résistante à l'oxydation.
c ☐ A été initialement conçue comme activateur de la dopa carboxylase.
d ☐ Agit sur les récepteurs α_2 adrénergiques présynaptiques du SNC via son métabolite actif : la α -éthyladrepinephrine

3/ L'activité insulinothrompique des sulfonylurées au niveau des cellules β du pancréas est associée à

- a ☐ L'augmentation du rapport [ATP]/[ADP] à l'intérieur des cellules
b ☐ La fermeture du canal calcique membranaire voltage-dépendant
c ☐ Une interaction anionique avec les récepteurs SUR2A et SUR2B
d ☒ Une interaction anionique avec les récepteurs SUR1

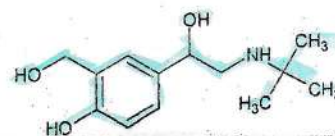
4/ Les sydnones :

- a ☒ sont des dérivés hétérocycliques méso ioniques.
b ☒ Ont un cycle de type 5-oxo oxadiazole-1,2,3
c ☐ Ont un cycle de type 1-oxo oxadiazole-2,3,4
d ☐ Ont un cycle de type 5-oxo oxadiazole-2,3,4

ResiPharmaTM

5/ Soit la structure ci-contre :

- a ☒ Est indiquée dans le traitement symptomatique de la crise d'asthme ;
b ☐ Est indiqué dans le traitement de fond de l'asthme ;
c ☐ Sa durée d'action est due à la présence du reste benzylalcool ;
d ☐ L'utilisation du racémique est recommandée en raison de l'impossibilité de résolution.



6/ Le 5-fluorodéoxuridine monophosphate : 5 FdUMP

- a ☒ Est le métabolite actif du tegafur
b ☐ Subit une désactivation hépatique par la dihydropyrimidine déhydrogénase
c ☒ Inhibe la substitution de l'uracile en 5 par un groupement méthyle
d ☐ Aucune de ces propositions n'est juste

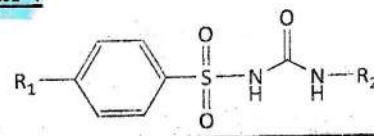
Tegafur

7/ La synthèse chimique de la méthyl dopa :

- a ☒ Débute suite à l'action de l'acétate d'éthyle sur le (3,4-dimethoxyphenyl) acétonitrile en présence d'éthoxyde de sodium.
b ☒ Fournit comme intermédiaire une hydantoïne obtenue par la réaction de bücherer-bergs
c ☐ Aboutit à un produit optiquement actif de configuration R
d ☐ Toutes les réponses sont justes

8/ Les sulfonilurées de deuxième génération sont caractérisées par :

- a ☒ Un substituant p-(β -arylcaryoxyamidoéthyle) en R1
- b ☐ Un petit substituant lipophile en R1
- c ☒ Un groupe acide requis pour l'activité insulinothipique
- d ☐ Un groupe phénylalanine requis pour l'activité insulinothipique



9/ La molsidomine

- a ☐ Est le métabolite actif de la linsidomine.
- b ☒ A le même mode de préparation que la linsidomine.
- c ☒ Se prépare à partir d'une aminomorpholine.
- d ☐ A la même solubilité que la linsidomine et donc la même voie d'administration.

ResiPharmaTM

10/ La préparation du salbutamol :

- a ☒ La chlorométhylation se fait en position ortho du reste hydroxyle ;
- b ☐ La chlorométhylation se fait en position ortho du reste acétyle ;
- c ☒ La préparation du diacétate est une étape de protection ne laissant disponible que la fonction acyle à l'attaque du dihalogène ;
- d ☐ L'action des hydrures sur l'aminocétone se limite à la transformation de la fonction cétone en alcool tertiaire.

11/ Lors de la première étape de synthèse du fluorouracile :

- a ☒ Le formyl fluororoacétate est obtenu par la condensation de deux esters en présence d'une base forte
- b ☒ Le formyl fluororoacétate est obtenu par une condensation de claisen
- c ☐ Le formyl fluororoacétate est obtenu par Fluoration directe de l'uracile
- d ☐ Le groupement « OCH₂CH₃ » est libéré par le fluoroacétate d'éthyle

12/ La clonidine :

- a ☐ Renferme dans sa structure un noyau imidazole
- b ☒ Non chargée, peut exister sous forme d'une paire de tautomères
- c ☐ se lie uniquement aux récepteurs adrénergiques α_2 présynaptiques centraux.
- d ☐ Se lie uniquement aux sites de liaison aux imidazolines au niveau du SNC.

13/ Le répaglinde est un :

- a ☐ Agent hypoglycémiant appartenant à la classe des sulfonilurées de première génération
- b ☐ Analogue phénylalanine de la méglitinide avec un groupe carboxyle transposé sur la chaîne latérale
- c ☐ Dérivé de l'isoamylène guanidine disubstituée
- d ☒ Dérivé de l'acide benzoïque para substitué

14/ Le nicorandil :

- a ☒ Est préparé à partir de l'acide nicotinique.
- b ☐ Est préparé à partir de nicotinamide.
- c ☐ Est préparé à partir de l'acide nitrique
- d ☐ Est préparé à l'aide d'un mélange sulfonitrique

15/ **Le bromure de tiotropium :**

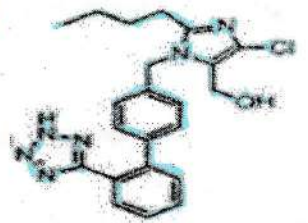
- a ☐ Renferme un noyau morpholine dans sa structure
- b ☒ Est un antagoniste cholinergique qui détend la fibre musculaire lisse bronchique
- c ☐ Lors de sa préparation, l'amidure de sodium est utilisé pour arracher un proton d'un acide faible
- d ☒ Lors de sa préparation, l'amidure de sodium permet de neutraliser l'acide chlorhydrique (HCl)

16/ **Stabilité du méthotrexate :** (Nef)

- a ☒ Le noyau ptéridine du méthotrexate subit une désamination en solution aqueuse acide ou sous l'action de la lumière vive.
- b ☐ En solution aqueuse acide la liaison amide reliant le NH₂ du noyau ptéridine à l'acide L-glutamique est hydrolysée.
- c ☒ L'azote de la partie para-aminobenzoïque subit une déméthylation sous l'action de la lumière vive.
- d ☐ Toutes les réponses sont justes

17/ **La molécule médicamenteuse dont la structure figure ci-contre :**

- a ☒ Est le premier médicament antagoniste non peptidique des récepteurs AT₁ de l'angiotensine II.
- b ☐ Est une prodrogue qui agit uniquement grâce à son métabolite
- c ☒ A été obtenue suite à la modification de la structure d'analogue de l'acide 5-imidazole acétique.
- d ☐ Toutes les réponses sont justes



18/ **La synthèse de la metformine implique :**

- a ☒ Une dimérisation du cyanamide en dicyandiamide en solution basique
- b ☐ Une réaction entre l'aide 5-chloro-2-méthoxybenzoïque et le chlorure de thionyle
- c ☒ Une condensation à chaud d'un substrat nitrile avec une amine secondaire
- d ☐ Une amination réductrice d'un substrat aldéhyde

19/ **La quinidine :**

- a ☒ Est un analogue de la quinine utilise comme antiarythmiques.
- b ☐ Est un analogue de la quinine utilise comme antiangoreux.
- c ☒ Est obtenue par extraction à partir de la poudre de quinquina.
- d ☐ Est obtenue par synthèse chimique à partir de la quinine.

Antiarythmique.

(Ecorce de quinquina)

20/ **La théophylline :**

- a ☒ Est une structure hétérocyclique
- b ☒ A des propriétés anti inflammatoire (in vitro)
- c ☒ Sa synthèse peut se faire à partir d'une urée correctement substituée
- d ☒ Lors de sa préparation, l'action du dihydrogène sur la fonction nitro aboutit au dérivé aminé

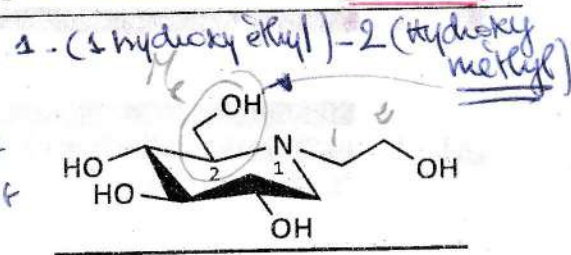
ResiPharmaTM

21/ **Gemcitabine :**

- a ☐ Est une fluoropyrimidine où deux atomes de fluor ont substitué deux atomes d'hydrogène
- b ☐ Est une fluoropyrimidine où un atome de fluor a substitué un atome d'hydrogène
- c ☒ Est un inhibiteur de la ribonucléotide réductase
- d ☐ Aucune de ces propositions n'est juste

- 22/ **Les sartans :**
- a ☐ Sont des antagonistes des récepteur AT₂ de l'angiotensine II
 - b ☒ Sont des composés à caractère acide
 - c ☐ Ont vu le jour suite à une légère modification de la structure de la saralazine
 - d ☒ Qui renferment un groupement tétrazole sont doués de biodisponibilité et de lipophilie satisfaisantes.

- 23/ **Le nom chimique du miglitol est le :**
- a ☐ 1-(2-hydroxyethyl)-2-(hydroxyethyl)piperidine-3,4,5-triol F
 - b ☐ 1-(1-hydroxyethyl)-2-(hydroxyethyl)piperidine-3,4,5-triol F
 - c ☐ 1-(2-hydroxyméthyl)-2-(hydroxyethyl)piperidine-3,4,5-triol F
 - d ☒ Aucune des propositions précédentes n'est exacte



- 24/ **Le dronaderone :**
- a ☒ Est un dérivé dont la structure est apparentée à l'amiodarone.
 - b ☐ Est un composé dont l'augmentation de la lipophilie est due au groupement méthylsulfonamide.
 - c ☒ Est un composé dont la diminution de la lipophilie est due au groupement méthylsulfonamide.
 - d ☐ Est un composé dont la diminution de la lipophilie est due au groupement iodé

- 25/ **Les molécules d'intérêt thérapeutique :** (Anti thyroïdiens de synthèse)
- a ☐ Sont susceptibles d'avoir une activité antityroïdienne si elles renferment dans leurs structures l'enchainement -SH-urée-
 - b ☐ La présence de l'enchainement thiourée est une condition nécessaire et suffisante pour l'activité antityroïdienne ; F
 - c ☒ La présence de l'enchainement thiourée est une condition nécessaire mais insuffisante pour l'activité antithyroïdienne ;
 - d ☒ Peuvent avoir un effet hypothyroïdien par blocage de la tyroïde peroxydase. (TPO blocage)

- 26/ **6-mercaptopurine :** X
- purine $\Leftrightarrow$ Base puriques (A et G)
- a ☒ Est analogue de base purique
 - b ☐ Est analogue de base pyrimidique
 - c ☐ Est convertie en thio-inosine monophosphate qui est à son tour convertie en thioguanine, cette dernière est le seul métabolite actif.
 - d ☐ Inhibe la ribonucléotide réductase.

ResiPharmaTM

- 27/ **Le candesartan cilexetil :**
- a ☒ Est un dérivé du biphényltétrazole
 - b ☐ Possède une biodisponibilité très faible par voie orale.
 - c ☐ Renferme dans sa structure un groupement acide carboxylique
 - d ☒ Est une prodrogue, qui va être hydrolysée durant l'absorption gastro-intestinale en candesartan

- 28/ **L'acarbose est un :**
- a ☒ Oligosaccharide naturel obtenu à partir d'un champignon Actinomyces utahensis
 - b ☐ Inhibiteur de la dipeptidyl peptidase IV
 - c ☐ Inhibiteur des α -glucosidases avec lesquelles il interagit par le biais d'un groupe éther protoné
 - d ☒ Dérivé glucosylamine liés à l'intermédiaire de haute énergie I (inhibiteur type I)

Diméthyl Aniline + Chlorure de Chloracetyl

Diméthyl Aniline + Chlorure de Chloracetyl

- 29/ **La xylocaine :**
- a ☐ Est préparé à partir de la diethyl aniline et le chlorure de chloracetyl.
 - b ☒ Est préparé à partir de la diméthyl aniline et le chlorure de chloracetyl.
 - c ☐ Est préparé à partir de la diethyl aniline et l'anhydride acetique.
 - d ☐ Est préparé à partir de la diméthyl aniline et l'anhydride acetique.

ResiPharmaTM

- 30/ **Le formotérol :**
- a ☒ A 2 couples d'énantiomères ;
 - b ☐ A 2 couples de diastéréoisomères ;
 - c ☒ A 4 stéréo-isomères
 - d ☐ Présente un problème de polymorphisme qui impacte son efficacité

- 31/ **Les premiers dérivés nitres utilisé comme antiangoreux sont les :**
- a ☐ esters nitriques.
 - b ☐ acides nitriques.
 - c ☐ acides nitreux.
 - d ☒ esters nitreux.

Esters Nitreux !

- 32/ **Le fluticasone :**
- a ☐ Est indiqué dans le traitement anti inflammatoire de la crise d'asthme ;
 - b ☒ Présente une fonction cétone indispensable à l'activité anti inflammatoire ;
 - c ☐ Présente des restes fluors nécessaires à l'activité anti inflammatoire ;
 - d ☐ A un analogue chloré, il s'agit du béclo métasone.

fluticasONE $\leftrightarrow$ cétone !

+ Anti inflammatoire

- 33/ **La procainamide :**
- a ☒ Est un antiarythmiques de classe Ia
 - b ☐ Est un antiarythmiques de classe IIa
 - c ☐ Est un antiarythmiques de classe Ib
 - d ☐ Est un antiarythmiques de classe IIb

IA

IA

- 34/ **Le propylthiouracile :**
- a ☒ est active sur deux cibles distinctes afin d'induire l'effet hypothyroïdien
 - b ☒ lors de sa préparation est noté le déplacement de la double liaison C=O
 - c ☒ sur le produit final de sa synthèse, l'enchainement imine est remplacé par l'enchainement énamine
 - d ☒ sa préparation se résume en une condensation entre une thiourée et un ester ayant une fonction cétone en position C3

- 35/ **Le glibenclamide est un agent hypoglycémiant :**
- a ☐ Appartenant à la classe des sulfonylurées de première génération
 - b ☐ Appartenant à la classe des inhibiteurs de la dipeptidyl peptidase IV
 - c ☐ Appartenant à la classe des Biguanides
 - d ☒ Aucune des propositions précédentes n'est exacte

36/ Les anti métabolites renferment dans leurs structures certaines modifications par rapport à leurs analogues (substrats naturelles), nous citons :

- a ☒ La substitution d'un hydrogène de la partie ose par un halogène
- b ☒ La substitution d'un hydrogène de la base azotée par un halogène
- c ☐ La substitution de l'hydrogène en 6 du noyau purique par un atome de soufre
- d ☐ Toutes les réponses sont justes

37/ L'irbésartan est une molécule médicamenteuse :

- a ☒ Appartenant à la classe des ARAT.
- b ☒ Pouvant être employée pour le traitement de la néphropathie dans le diabète de type II.
- c ☒ Considérée comme un composé spiro car comportant 2 cycles connectés par un seul carbone.
- d ☒ Dont la synthèse fait appel à l'azoture de tributylétain ($\text{Bu}_3 \text{Sn N}_3$) pour pouvoir former le cycle tétrazole.

38/ Le miglitol est un inhibiteur des α -glucosidases qui :

- a ☒ Inhibe la glucoamylase et la sucrase, mais pas l'isomaltase.
- b ☐ Inhibe l' α -amylase pancréatique et la lactase mais pas la glucoamylase.
- c ☒ Peut-être synthétisé à partir d'une molécule de glucose comme substrat de départ
- d ☐ Peut-être synthétisé à partir d'une molécule de fructose comme substrat de départ

Mi glitf $\Leftrightarrow$ glu ad

39/ L'allongement du temps de demi vie des fluoropyrimidines peut être obtenu par :

- a ☒ Protection de la fonction amine du noyau fluorouracile par une amidification
- b ☒ Association de la fluoropyrimidine à l'uracile
- c ☐ Condensation du noyau fluorouracile à une arabinose
- d ☐ Aucune de ces réponses n'est juste

40/ La rilmenidine est un médicament antihypertenseur :

- a ☒ Hautement sélectif pour les récepteurs aux imidazolines.
- b ☐ Possédant une grande affinité pour les récepteurs α_2 centraux.
- c ☒ Qui renferme dans sa structure un cycle oxazoline.
- d ☐ Qui renferme dans sa structure un cycle imidazoline.

rilmenidine $\Leftrightarrow$ imidazoline
cycle oxazoline
Genius!

