

**1. L'acétazolamide:**

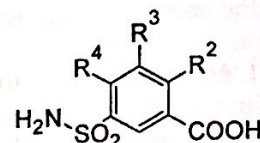
- ☒ a) Est un sulfamide diurétique. b) Renferme dans sa structure un noyau thiazolé.
 c) Est un diurétique efficace dans le traitement du glaucome en application oculaire.
 d) Lors de la dernière étape de sa préparation, l'action de NH_3 permet l'amination du reste $-\text{SO}_2\text{Cl}$.

2. Le mannitol:

- ☒ a) est un polyol diurétique osmotique.
☒ b) peut être indiqué dans l'insuffisance rénale oligourique (en administration intraveineuse).
 c) inhibe la réabsorption proximale transépithéliale de Na^+ par augmentation de l'osmolarité intratubulaire.
☒ d) est un vasoactif rénal.

3. Le furosémide de structure générale ci-contre :

- ☒ a) appartient à la classe des acide 2-amino benzoïques à fonction sulfamoyle.
 b) appartient à la classe des acide 3-amino benzoïques à fonction sulfonamide.
☒ c) le substituant R_2 est un groupe furan-2-yl méthanimine.
☒ d) le substituant R_2 est un groupe furfurylamine.

**4. le mébutanide:**

- a) lors de sa préparation par chlorosulfonation de l'acide *p*-chlorobenzoïque, la fixation du reste $-\text{SO}_2\text{Cl}$ est orientée par le substituant le plus activateur.
☒ b) lors de sa préparation par chlorosulfonation de l'acide *p*-chlorobenzoïque, la fixation du reste $-\text{SO}_2\text{Cl}$ est orientée par $-\text{COOH}$.
 c) lors de sa préparation par chlorosulfonation de l'acide *p*-chlorobenzoïque, la fixation du reste $-\text{SO}_2\text{Cl}$ est orientée par $-\text{Cl}$.
☒ d) est un diurétique efficace agissant au niveau de l'anse de Henlé.

5. Lors de la préparation du furosémide:

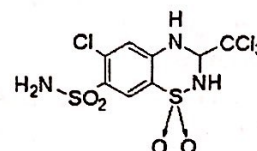
- ☒ a) l'acide 2,4-dichlorobenzoïque peut être utilisé comme substrat de synthèse.
☒ b) la sulfochloration du substrat est réalisée par la chlorhydrique sulfurique.
☒ c) la sulfochloration du substrat est réalisée par l'acide chlorosulfonique.
☒ d) L'attaque nucléophile de l'ammoniac sur le soufre du reste $-\text{SO}_2\text{Cl}$ aboutit au départ du nucléofuge Cl^-

6. Les diurétiques thiazédiques :

- a) agissent par blocage du co-transporteur Na/K dans la portion initiale du tube contourné distal
☒ b) inhibent l'anhydrase carbonique au niveau proximal
☒ c) l'hydrogénation de la double liaison en position 3 et 4 s'accompagne d'une augmentation de l'activité diurétique
 d) l'introduction de substituants en 2 et en 3 augmente leur durée d'action sans affecter leur efficacité.

7. Le téclothiazide dont ci-contre la structure chimique :

- ☒ a) est un dihydrothiazide.
☒ b) a une activité diurétique plus importante que l'hydrochlorothiazide.
☒ c) peut être préparé à partir du N-(3-chlorophényl) acétamide.
☒ d) l'action du trichloroacétaldéhyde sur le salamide produit directement le téclothiazide.

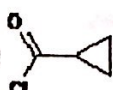
**8. Le midazolam :**

- a) A une structure plane. ☒ b) Est une structure ticyclique. ☒ c) A un pouvoir rotatoire nul. ☒ d) Est photosensible.

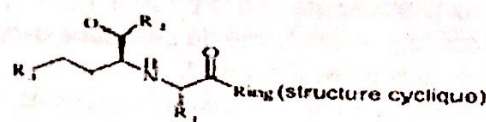
9. Le diazépam :

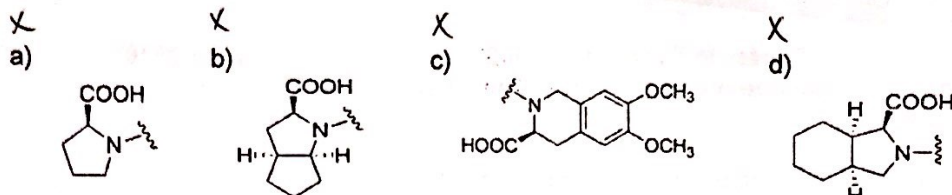
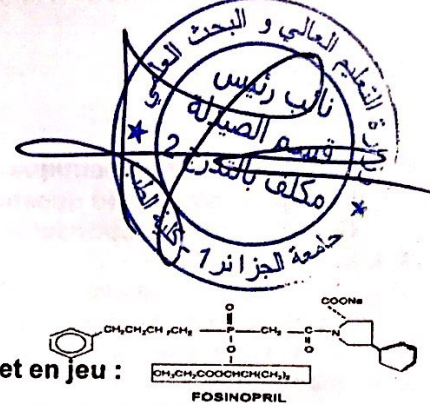
- ☒ a) Provoque une anxiolyse par voie orale. b) Est un anticonvulsivant per os.
 c) A une longue durée d'action suite à la formation d'un métabolite actif
☒ d) A une longue durée d'action car la déméthylation, in vivo, de l'azote donne un intermédiaire actif dont la durée d'action est plus importante

10. Le prazepam:

- ☒ a) Est une structure bicyclique
 c) Lors de sa préparation, l'action du  sur le substrat de départ est une étape de protection
 d) Est une base forte

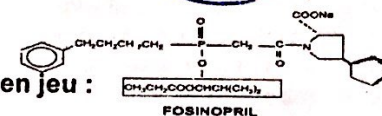
11. Parmi les structures cycliques données ci-dessous, indiquez celles qui sont favorables pour l'activité des inhibiteurs de l'enzyme de conversion :





12. L'interaction du Fosinopril avec le site actif de l'enzyme de conversion met en jeu :

- ☒ a) Une liaison hydrogène. ☒ b) Une liaison hydrophobe
 c) Une liaison de coordination entre le phosphore de l'acide phosphinique et le Zn^{2+} de l'enzyme de conversion de l'angiotensine.
 d) Une liaison ionique entre le carboxy de la D-proline et un résidu chargé positivement dans l'enzyme de conversion de l'angiotensine.



13. L'énalapril est un inhibiteur de l'ECA et :

- ☒ a) Est hydrolysés en un diacide pour être actif.
 b) Comporte deux fonctions acides.
☒ c) Comporte des atomes de carbone de configuration S.
☒ d) Etablit -après ionisation- deux liaisons ioniques avec le site actif de l'enzyme de conversion de l'angiotensine

ResiPharmaTM

14. Dans le verapamil :

- a) La présence d'une Amine tétra-substituée confère à la molécule une activité optimale.
☒ b) La présence d'un centre chiral ainsi que dans ses analogues implique qu'il existe deux formes optiquement actives où les énantiomères S(-) bloquent beaucoup plus le calcium que les énantiomères R(+).
 c) Au niveau du carbone benzylique disubstitué : les groupements cyano et isopropyle ne sont pas essentiels pour l'activité mais leur substitution provoque une diminution de l'intensité d'action.
 d) La nature et la position des substituants sur le cycle A et le cycle B n'influencent pas la réponse biologique.

15. Les dihydro-1,4-pyridine (DHP) :

- ☒ a) L'activité antagoniste est associée à l'énantiomère R tandis que l'activité agoniste est associée à l'énantiomère S.
 b) Les esters dissymétriques sont moins vasodilatateurs que les esters symétriques.
 c) L'effet agoniste partiel se manifeste à des concentrations très élevées et peut être dû à de petites modifications conformationnelles concernant la planéité du cycle DHP.
☒ d) Sont des Antagonistes calciques qui interagissent uniquement avec les VOC types L.

16. Le procainamide :

- ☒ a) Est issu de la condensation du chlorure para nitrobenzoyl avec une amine substituée.
 b) Est issu de la condensation du chlorure para nitrobenzoyl avec un amide substitué.
 c) Est issu de la condensation du para chloronitrobenzène avec une amine substituée.
 d) Est issu de la condensation du para chloronitrobenzène avec un amide substitué.

17. L'amiodarone :

- ☒ a) A été initialement développé comme antiangoreux. ☒ b) A été initialement développé comme antiarythmiques.
☒ c) Est un dérivé iodé sur les positions ortho du phénol. ☒ d) Est un dérivé iodé sur les positions méta du phénol.

18. Le dérivé apparenté à l'amiodarone :

- a) A été développé pour pallier à la liposolubilité faible de l'amiodarone
☒ b) A été développé pour pallier à la toxicité thyroïdienne de l'amiodarone.
 c) Est un dérivé plus soluble que l'amiodarone grâce à un reste sulfométhyle.
☒ d) Est un dérivé plus soluble que l'amiodarone grâce à un reste méthylsulfonamide.

19. Les digitaliques cardiotonique sont :

- ☒ a) 2 hydroxylés sur la digitoxigénine. ☒ b) 3 hydroxylés sur la digoxigénine.
 c) Carboxylés sur la digitoxigénine. ☒ d) Toutes les réponses sont justes.

20. La dopamine :

- a) Est synthétisée grâce à la dopa hydroxylase.
☒ b) Est synthétisée grâce à la tyrosine hydroxylase.
☒ c) Est apportée sous forme de Levodopa exogène dans la maladie de parkinson
☒ d) Son énantiomère S est actif.

21. La levodopa est caractérisée grâce à :

- ☒ a) La présence d'un noyau cathécolamine qui complexe avec le fer pour donner une réaction colorimétrique
 b) La présence d'un reste xylène qui complexe avec le cuivre pour donner une réaction colorimétrique
 c) Une fonction amine tertiaire dosée par titrimétrie. ☒ d) Une fonction amine tertiaire dosé par spectrométrie.

22. Les inhibiteurs de la dopadécarboxylase :

- a) Sont des agonistes dopaminergiques.
- b) Sont des molécules qui traversent la barrière hémato-encéphalique.
- c) Permettent la conversion périphérique de la lévodopa en dopamine
- ☒ d) Aucune des propositions n'est exacte.

23- Les agonistes dopaminergique ergotés utilisés dans le traitement du parkinson :

- a) Ont une chaîne latérale aminée qui détermine la sélectivité et l'affinité à l'enzyme.
- ☒ b) Ont la configuration trans des cycles C et D.
- c) Sont autant lipophiles qu'ils renferment des substituants hydroxylés.
- ☒ d) Sont des molécules d'origine hémisynthétique.

24- La quinidine de la classe des antiarythmiques :

- a) Est un dérivé synthétique
- ☒ b) Est un alcaloïde extrait de l'écorce de quinquina.
- ☒ c) Est un stabilisant de la membrane
- d) Aucune des réponses n'est juste.

25- Les antiangoreux dérivés de l'ester nitrique sont obtenues en :

- ☒ a) Additionnant un mélange sulfonitrique à un alcool.
- b) Additionnant de l'acide nitrique à un alcool.
- ☒ c) Faisant réagir l'ion nitronium avec un alcool
- d) Faisant réagir l'ion nitronium avec un acide.

26- Le noyau sydnone des antiangoreux :

- a) Est un dérivé benzénique
- ☒ b) Est un dérivé hétérocyclique
- ☒ c) Est un composé mésoionique
- ☒ d) Est sujet à la substitution électrophile.

27. Ethosuccimide (antiépileptique) a été développé par introduction d'un isostère CH₂ du groupement :

- ☒ a) NH
- b) C=O
- c) OH
- d) CH₃

28. La phenytoïne est :

- ☒ a) Une 5,5 diphényl hydantoïne
- b) Une 2,5 diphényl hydantoïne
- ☒ c) Mise en évidence par action du sulfate de cuivre en solution ammoniacale
- ☒ d) Identifiée par la réaction de Parri

29. La vigabatrine présente une analogie structurale avec :

- ☒ a) L'acide gamma amino butanoïque
- ☒ b) L'acide - 4- aminohex-5-énoïque
- c) La gabapentine
- d) l'acide nipécotique

30. La relation structure activité de lamotrigine est due :

- ☒ a) A La présence d'hétérocyclique triazine
- b) Au groupement dicholophényle
- c) Au groupement diamino de la triazine
- d) A la présence d'hétérocycle diazine

31. Les antiépileptiques agissent par :

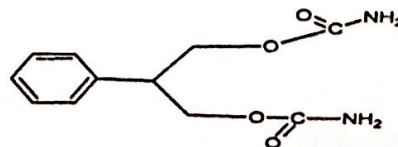
- a) Diminution de l'inhibition de la neurotransmission médiée par l'acide gamma amino butyrique
- ☒ b) Diminution de la neurotransmission du glutamate
- ☒ c) Augmentation de l'inhibition de la neurotransmission médiée par l'acide gamma amino butyrique
- ☒ d) Stabilisation de la membrane pré synaptique

32. Le fluorofelbamate :

- ☒ a) Réduit la toxicité sanguine et hépatique grâce à la présence du fluor
- ☒ b) Bloque sélectivement les récepteurs NMDA
- c) Est responsable du blocage des canaux sodiques par le groupement fluorobenzyle
- ☒ d) Est un modulateur allostérique des récepteurs GABA A

33. La structure ci-contre correspond :

- a) Au meprobamate
- ☒ b) Au felbamate
- ☒ c) à l'oxcarbamazépine
- d) Au valroceamide



34. Les antihypertenseurs centraux :

- a) Sont des médicaments utilisés pour le traitement de l'HTA en première intention
- b) Agissent sur les récepteurs adrénergiques alpha-1 et/ou les récepteurs des imidazolines
- ☒ c) Agissent au niveau du SNC sur des récepteurs localisés dans les centres de régulation de la PA
- d) Est une classe thérapeutique dont le chef de file est le losartan

35. La méthildopa :

- a) Est une molécule médicamenteuse commercialisée sous forme de mélange racémique.
- ☒ b) Est transformée au niveau du SNC en 1R,2S- α -methylnorepinephrine qui agit sur les récepteurs centraux α_2 -présynaptiques
- c) Est préparée en commençant par faire réagir le (3,4-dimethoxycyclohexyl) acétonitrile avec l'acétate d'éthyle en présence d'une base forte
- ☒ d) Est préparée en plusieurs étapes dont l'une correspond à une synthèse de BÜCHERER-BERGS qui aboutit à une hydantoïne

36. La clonidine :

- ☒ a) Comporte dans sa structure un noyau imidazoline
- ☒ b) A été conçue au départ comme décongestionnant nasal agoniste des récepteurs α_1 adrénergiques
- ☒ c) N'est pas une prodrogue
- ☒ d) Comporte deux atomes de chlore fixés en position ortho sur le noyau benzénique qui empêchent la co-planarité des cycles et diminuent la basicité.

37. L'irbésartan :

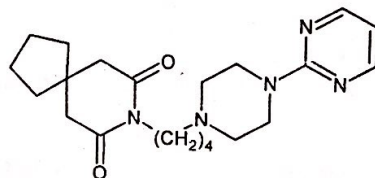
- ☒ a) Est un dérivé du biphényltétrazole contenant un spirocyclopentane
- b) Est un antihypertenseur qui agit par blocage des récepteur AT2 de l'angiotensine II
- ☒ c) Nécessite pour sa préparation de l'azoture de tributylétain ($\text{Bu}_3\text{Sn N}_3$) afin de former le cycle tétrazole
- d) Toutes les réponses sont correctes

38. Le valsartan:

- a) Est un médicament à caractère basique
- ☒ b) Est nommé ainsi en raison de la portion valine qu'il comporte
- c) Est un dérivé du biphényltétrazole substitué par un imidazole tout comme le losartan
- ☒ d) Est un antihypertenseur de la classe des sartans qui agit par blocage des récepteur AT1 de l'angiotensine II

39. soit la structure ci-contre :

- a) il s'agit d'une cyclizine
- ☒ b) c'est un dérivé spiroglutarimique
- ☒ c) Ce n'est pas un antiépileptique
- d) Ce n'est pas un anxiolytique



40. Les spirolactones :

- ☒ a) Diminuent la réabsorption du sodium
- ☒ b) Diminuent la sécrétion du potassium
- ☒ c) Diminuent la sécrétion des protons
- ☒ d) Sont à l'origine d'une urine hypertonique et alcaline

ResiPharmaTM



3ème ANNEE DE PHARMACIE - 2017/2018- EMD 2- CHIMIE THERAPEUTIQUE

Date de l'épreuve : 11/04/2018

Page 1/1

Corrigé Type

Barème variable par question

N°	Rép.	Barème
1	A	0,5
2	ABD	0,5
3	ACD	0,5
4	BD	0,5
5	ABCD	0,5
6	BC	0,5
7	ABCD	0,5
8	BCD	0,5
9	AD	0,5
10	AB	0,5
11	ABCD	0,5
12	AB	0,5
13	ACD	0,5
14	B	0,5
15	AD	0,5
16	A	0,5
17	AC	0,5
18	BD	0,5
19	AB	0,5
20	BCD	0,5
21	A	0,5
22	D	0,5
23	BD	0,5
24	BC	0,5
25	AC	0,5
26	BCD	0,5
27	A	0,5
28	ACD	0,5
29	AB	0,5
30	A	0,5
31	BCD	0,5
32	ABD	0,5
33	B	0,5
34	C	0,5
35	BD	0,5

N°	Rép.	Barème
36	ABCD	0,5
37	AC	0,5
38	BD	0,5
39	BC	0,5
40	ABCD	0,5

X
a)

12. L'intera

- ☒ a) Une liai
☐ c) Une liai
 et le Zn^{2+} d
☐ d) Une liai
 de l'angiot

13. L'énal

- ☒ a) Est hyd
☐ b) Compos
☒ c) Compos
☒ d) Etabli

14. Dans

- ☐ a) La prés
☒ b) La pré
 actives o
☐ c) Au niv
 l'activité

15. Les

- ☒ a) L'activ
☐ b) Les es
☐ c) L'effe
 conform

16. Le p

- ☒ a) Est is
☐ b) Est is
☐ c) Est is
☐ d) Est is

17. L'an

- ☒ a) A éta
☒ c) Est u

18. Le

- ☐ a) A été
☒ b) A été
☐ c) Est u
☒ d) Est u

19. Les

- ☒ a) 2 hy
☐ c) Carb

20. La

- ☐ a) Est
☒ b) Est
☒ c) Est
☒ d) Sor

21. La

- ☒ a) La
☐ b) La
☐ c) Un