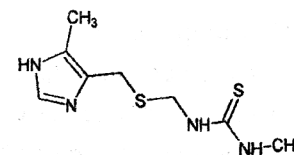


Le sujet comporte 40 questions - choisissez la ou les bonne(s) réponse(s)

1. Le composé suivant :

- a) est actif par voie orale grâce à une substitution en position 1 sur la chaîne latérale.
- b) est actif par voie orale grâce à une substitution en position 4 sur la chaîne latérale.
- c) a une meilleure absorption par voie orale grâce à la substitution de l'imidazole par un CH₃.
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.



2. Les antiémétiques :

- a) permettent de soulager de façon préventive les spasmes et de façon curative les vomissements.
- b) agissent tous au niveau de la Zone spécifique chémosensible.
- c) permettent de soulager de façon préventive ou de façon curative les vomissements et les nausées.
- d) sont tous des antagonistes du récepteur 5-HT₃ de la sérotonine.

3. Les antidépresseurs tricycliques présentent :

- a) une conformation plane.
- b) une conformation non plane.
- c) un angle de pliage égal à 55°.
- d) un angle alpha égal à 25°.

ResiPharmaTM

4. Lors de la synthèse de la metformine, la formation de la cyanoguanidine implique :

- a) une dimérisation du cyanamide suite à une protonation initiale de l'azote du groupe nitrile.
- b) une déprotonation initiale du cyanamide en milieu basique.
- c) une protonation initiale du diméthylamine en milieu acide.
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

5. La prométhazine :

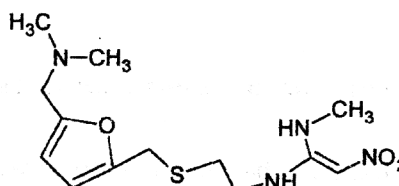
- a) est une phénothiazine avec une chaîne latérale diméthylaminoéthyle.
- b) est essentiellement employée en thérapeutique pour sa puissante action antipsychotique.
- c) est l'unique produit résultant de la réaction de la phénothiazine avec le 2-chloro-N,N-diméthyl-1-propanamine en présence d'amidure de sodium comme base.
- d) est commercialisée sous forme de mélange racémique.

6. La formation de la méthémoglobine - engendrée par la prilocaïne - est liée :

- a) a la présence d'un seul substituant « méthyl » en ortho sur le noyau aniline.
- b) a la présence de deux substituants « méthyl » en ortho sur le noyau aniline.
- c) a la libération de l'acide para-aminobenzoïque sous l'action des cholinestérases plasmatiques.
- d) a la présence d'une fonction ester.

7. La structure suivante est :

- a) la cimétidine.
- b) la famotidine.
- c) la nizatidine.
- d) la ranitidine.



8. Le métoclopramide :

- a) est un antispasmodique.
- b) est un antiémétique sans effet anesthésique.
- c) est obtenu par substitution du chlore du procainamide par un groupement O-CH₃.
- d) est un antagoniste des récepteurs D2 au niveau central et au niveau périphérique.

9. L'édification du noyau phénothiazine :

- a) peut se faire par thionation d'un diphenyle.
- b) peut se faire par cyclisation d'une diphenylamine.
- c) peut se faire par l'action d'une base sur un sulfure de diphenyl O-nitré et O'-acylamidé.
- d) est le siège d'une tautomérie appelée transposition de Smiles.

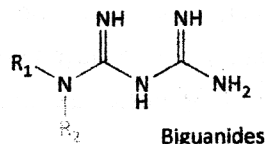
10. L'imipramine :

- a) est un dérivé azépinique N-Substitué.
- b) est caractérisé par une double liaison C=C exocyclique.
- c) possède une chaîne tri carbonée greffée sur le cycle central comprenant une amine tertiaire.
- d) possède une chaîne tri carbonée greffée sur le cycle central comprenant une amine secondaire.

ResiPharmaTM

11. Soit la structure de base suivante, l'activité thérapeutique optimale est constatée lorsque :

- a) R1 est un alkyle jusqu'au n-pentyle, R2 est un phényléthyle.
- b) R1 est un aralkyle, R2 est un phényléthyle.
- c) R1 est un phényléthyle, R2 est un Hydrogène.
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.



12. La cétirizine :

- a) appartient à la série des benzydryl pipéridines.
- b) comporte dans sa structure une fonction alcool qui facilite son passage à travers la BHE.
- c) se présente sous forme d'un mélange racémique dont la résolution a permis d'isoler et de commercialiser la lévocétirizine.
- d) peut être préparée en faisant réagir dans un premier temps le 1-chloro-4-[chloro(phenyl)methyl]benzène avec le 1-pipéridine carboxylate d'éthyle.

13. L'azote de la partie alkyl amine de l'anesthésique local :

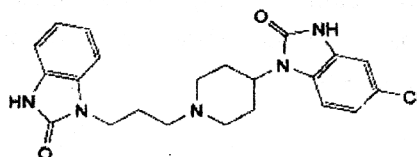
- a) confère à la molécule un caractère hydrophile.
- b) confère à la molécule un caractère lipophile.
- c) est absent dans la benzocaïne.
- d) interagit sous la forme « ionisée NH⁺ » avec le domaine chargé négativement du récepteur.

14. La cimetidine est une molécule :

- a) qui a un cycle imidazole substitué en C4 par un groupement cyanoguanidine.
- b) qui a un groupement électroattracteur qui lui confère une sélectivité H2.
- c) qui a un groupement nitrométhylène qui augmente la puissance des composés.
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

15. Cette structure chimique correspond à :

- a) Ondansetron.
- b) Dompéridone.
- c) Metoclopramide.
- d) Métopimazine.



16. Le Log octanol/eau des antidépresseurs tricycliques est un indice :

- a) de lipophilie.
- b) d'une pénétration à travers la barrière hémato encéphalique.
- c) de sensibilité aux oxydants.
- d) d'une liaison récepteur-ligand.

17. Lors de la fixation de la chaîne aminée sur la phénothiazine :

- a) l'amine chlorée est obtenue par action du phosgène sur l'amino-alcool correspondant.
- b) l'utilisation de NaNH₂ sur la phénothiazine est justifiée par son caractère amine métallique.
- c) l'utilisation de NaNH₂ sur la phénothiazine est justifiée par son caractère basique fort.
- d) l'utilisation de NaNH₂ sur la phénothiazine est justifiée par son caractère basique faible.

18. L'action hypoglycémiante des inhibiteurs des alpha-glucosidases est associée à :

- a) l'inhibition de la dipeptidyl peptidase IV.
- b) une augmentation de la sensibilité musculaire à l'insuline.
- c) leur interaction avec un récepteur sulfonylurée de type 1 au niveau des cellules β du pancréas.
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

19. La phéniramine :

- a) fait appel lors de sa synthèse à une réaction de Mannich qui sert à préparer la cétone β -aminée.
- b) exerce son action thérapeutique par blocage des récepteurs H_2 de l'histamine.
- c) est un antihistaminique de deuxième génération appartenant à la série des propylamines.
- d) Toutes les propositions précédentes sont correctes.

20. En comparant les pKa des anesthésiques locaux donnés ci-dessous, prédire la molécule ayant le délai d'action le plus court :

- a) Tetracaïne pKa= 8.6
- b) Bupivacaïne pKa= 8.1
- c) Procaïne pKa= 9.1
- d) Mépivacaïne pKa= 7.7

ResiPharmaTM

21. L'histamine :

- a) a plusieurs formes mésomères anioniques montrant sa liaison aux récepteurs H_1 et H_2 .
- b) a plusieurs formes mésomères cationiques expliquant sa liaison aux récepteurs H_1 et H_2 .
- c) a plusieurs formes mésomères neutres favorisant sa liaison aux récepteurs H_1 et H_2 .
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

22. L'action thérapeutique des antidépresseurs repose sur la stimulation :

- a) De la synthèse de BDNF.
- b) Protéine CREB.
- c) Adénylyl cyclase.
- d) Phospholipase C.

23. L'activité neuroleptique des phénothiazines :

- a) est diminuée par des radicaux volumineux sur l'azote du noyau phénothiazine.
- b) est augmentée par la cyclisation de l'azote terminal en une structure pipérazinique.
- c) est augmenté en introduisant des substituants sur tous les sommets du dibenzoparathiazine.
- d) est diminuée par l'introduction d'une encombrante ramification en C2 de la chaîne latérale.

24. Le développement des sulfonylurées de première génération a été :

- a) initié par la découverte fortuite des propriétés hypoglycémiantes de certains sulfamides antibactériens.
- b) entrepris par l'introduction d'un fragment urée sur les sulfamides antibactériens.
- c) à l'origine de la commercialisation du glibenclamide comme premier agent de cette classe.
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

25. La loratadine :

- a) est un antihistaminique de première génération appartenant à la classe de l'éthylène diamine.
- b) exerce son action thérapeutique par le biais de son métabolite la dechloroloratadine.
- c) a été obtenue suite à des modifications structurales réalisées sur la desloratadine.
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

26. Le but du traitement antidépresseur est

- a) inhiber la recapture de la noradrénaline et la sérotonine.
- b) inhiber la dégradation de la monoamine-oxydase.
- c) inhiber les mécanismes de rétrocontrôle.
- d) Activer les mécanismes de rétrocontrôle.

27. L'atropine :

- a) interagit de la même manière que l'acétylcholine au niveau du récepteur cholinergique.
- b) possède les deux caractéristiques liantes essentielles de l'acétylcholine : un azote constamment chargé positivement et un groupe ester.
- c) possède les deux caractéristiques liantes essentielles de l'acétylcholine : un azote chargé positivement (s'il est protonné) et un groupe ester.
- d) se présente sous forme d'un mélange racémique.

28. Le pyrazinamide :

- a) est également appelé pyrazinecarboxamide.
- b) peut être préparé en faisant réagir le 2-pyrazine carboxylate de méthyle, résultant de l'estérification de l'acide pyrazinoïque, avec l'hydrazine.
- c) est une prodrogue qui est métabolisée en acide pyrazinoïque créant un pH acide au voisinage du bacille de koch.
- d) Toutes les propositions précédentes sont correctes.

29. Les impuretés des antidépresseurs sont représentées par :

- a) motif tricycliques pourvu de chaîne latérale.
- b) motif tricycliques dépourvu de chaîne latérale.
- c) dérivés hydroxylés au niveau du cycle central.
- d) produits de N-oxydation ou S-oxydation.

30. Les benzodiazépines :

- a) sont toutes indiquées comme anxiolytique.
- b) sont des molécules planes.
- c) possèdent un angle dièdre.
- d) renferment un hétérocycle diazépine.

ResiPharmaTM

31. L'isoniazide :

- a) est l'hydrazide de l'acide nicotinique.
- b) constitue le principal traitement contre le mycobactérium tuberculosis.
- c) est oxydé in vivo en espèces réactives qui inhibent la synthèse de la paroi bactérienne.
- d) est obtenu en faisant réagir le nicotinate d'éthyle, résultant de l'estérification de l'acide nicotinique, avec l'hydrazine.

32. La trimébutine :

- a) antispasmodique anticholinergique.
- b) est un antagoniste enképhalinergique.
- c) a une action antidouleur type opiacé physiologiquement démontrée.
- d) a un effet antagoniste sérotoninergique marqué.

33. La duloxétine est un inhibiteur :

- a) de la recapture de sérotonine et noradrénaline.
- b) de la monoamine-oxydase.
- c) sélectif de la recapture de la sérotonine.
- d) sélectif de la recapture de la noradrénaline.

34. Le diazépam :

- a) agit sur le même récepteur que le GABA.
- b) agit sur le même site d'action du GABA.
- c) sa cible est un récepteur ionotrope.
- d) agit en augmentant la durée d'ouverture du canal Cl⁻

35. Le carbimazole :

- a) est une prodrogue.
- b) est obtenu par action du chlorométhylate d'éthyle sur le méthimazole.
- c) inhibe irréversiblement la thyroïde peroxydase.
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

36. Le phloroglucinol :

- a) existe sous deux formes énantiomériques: le 1,3,5-trihydroxybenzène qui a une structure de phénol et la 1,3,5-cyclohexanetrione (phloroglucine) qui est une cétone.
- b) existe sous deux formes tautomériques: le 1,3,5-trihydroxybenzène qui a une structure de phénol et la 1,3,5-cyclohexanetrione (phloroglucine) qui est une cétone.
- c) existe sous deux formes tautomériques: le 1,3,5-trihydroxybenzène qui a une structure d'une cétone et la 1,3,5-cyclohexanetrione (phloroglucine) qui est un phénol.
- d) est un antispasmodique musculotrope.

ResiPharmaTM

37. La synthèse de l'amitriptylline fait intervenir l'action :

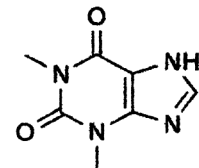
- a) du di benzo subérone sur le bromure de magnésium du diméthyl propylamine.
- b) de imino dibenzyl sur le bromure de magnésium.
- c) du dibenzyl sur le bromure de magnésium.
- d) Acide 2- phenylethylbenzoïque sur acide phosphorique à 120°C.

38. Le salbutamol :

- a) agit sur les récepteurs B2 adrénergiques qui sont couplés à la protéine G.
- b) son interaction avec les récepteurs B2 conduit à la séparation des sous-unités de la protéine G.
- c) aboutit à une myorelaxation bronchique par diminution de la concentration intracellulaire de l'AMPc.
- d) aboutit à une myorelaxation bronchique par augmentation de la concentration intracellulaire de l'AMPc.

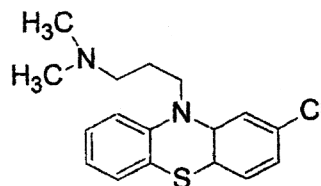
39. La théophylline :

- a) est une 1,3-diméthylxanthine.
- b) est indiquée comme anti-inflammatoire bronchique.
- c) peut être préparée à partir du 1,3-diméthylurée comme substrat de départ.
- d) est un inhibiteur de la phosphatase.



40. Soit la chlorpromazine :

- a) c'est un psychotrope.
- b) c'est un antipsychotique.
- c) c'est un neuroleptique.
- d) c'est une phénothiazine pipéridinée.



Thérapeutique

25.07.2018
Barème variable

N°	Réponses	Barème
1	C	0.5
2	C	0.5
3	B C	0.5
4	B	0.5
5	A D	0.5
6	A	0.5
7	D	0.5
8	B D	0.5
9	C	0.5
10	A C	0.5
11	C	0.5
12	C	0.5
13	A C D	0.5
14	D	0.5
15	B	0.5
16	A B	0.5
17	C	0.5
18	D	0.5
19	A	0.5
20	D	0.5
21	B	0.5
22	A B C D	0.5
23	B D	0.5
24	A B	0.5
25	D	0.5

N°	Réponses	Barème
26	A C	0.5
27	C D	0.5
28	A C	0.5
29	B C D	0.5
30	C D	0.5
31	B C	0.5
32	C D	0.5
33	A	0.5
34	A C	0.5
35	A B C	0.5
36	B D	0.5
37	A D	0.5
38	A B D	0.5
39	A C	0.5
40	A B C	0.5

ResiPharmaTM