

[Cochez la ou les réponses justes]

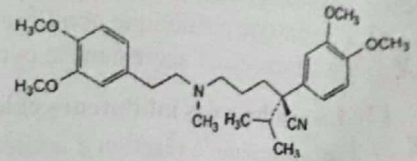
Durée 60 min

1- La structure de la morphine :

- ☒ a) Est composée de 5 cycles : A, B, C, D, E
- ☒ b) Son noyau de base est le morphinane
- c) a un cycle D ponté sur le cycle A
- ☒ d) Le cycle E est un 2,3-dihydrofurane

2- La structure chimique suivante correspondrait-elle à un dérivé des :

- a) Aryloxypropanolamines
- b) Phényléthanolamines
- ☒ c) Phénylalkylamines
- d) Catécholamines



3- Les Anti-inflammatoires non stéroïdiens conventionnels sont tous :

- a) des bases organiques relativement fortes avec des pKa de l'ordre de 10 à 12
- b) des acides carboxyliques possédant un groupement carboxyle COOH
- c) des composés énoliques possédant un groupement énol à l'origine de leur acidité
- ☒ d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte

4- L'alphaméthyl dopa :

- a) Est l'acide (2R)-2-amino-3-(3,4-dihydroxyphenyl)-2-methylpropanoïque
- ☒ b) Diffère de la dopa par la présence d'un groupement CH₃ sur le carbone α
- c) Est le plus récent des antihypertenseurs centraux
- d) Est une molécule qui résiste à l'oxydation en présence de divers agents oxydants

5- Le Methazolamide :

- ☒ a) Est un inhibiteur de l'anhydrase carbonique
- b) Diffère de l'Acétazolamide par la présence d'un groupe éthyle sur l'un des azotes du cycle
- c) Est un diurétique hyperkaliémiant
- d) Possède deux groupes sulfamoyle

6- La morphine :

- ☒ a) Contient 5 centres chiraux en positions 5, 6, 9, 13 et 14
- b) Contient 5 centres chiraux en positions 5, 7, 9, 13 et 16
- c) La disposition du cycle D, nécessite que les liaisons pontées en 9 et 13 soient trans
- ☒ d) La disposition du cycle D, nécessite que les liaisons pontées en 9 et 13 soient cis

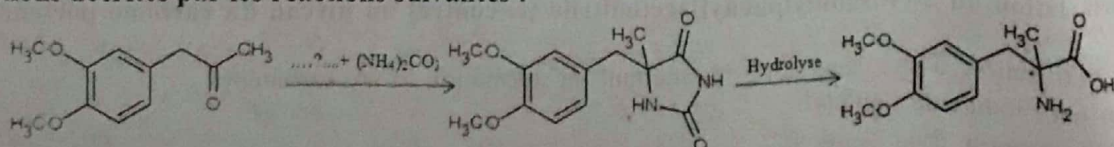
7- Les deux énantiomères R(+) et S (-) du Vérapamil ne présentent pas des caractéristiques pharmacocinétiques identiques car :

- ☒ a) Faux, c'est les deux énantiomères R(-) et S(+) du Vérapamil qui présenteraient des caractéristiques pharmacocinétiques différents
- b) Les concentrations plasmatiques des isomères R et S varient avec la voies d'administration et dans le temps
- ☒ c) Une grande proportion de S(-) que de R(+) n'est pas liée aux protéines plasmatiques
- ☒ d) Les clairances systémiques sont différentes pour les deux énantiomères

8- Les Oxicams sont des anti-inflammatoires non stéroïdiens (AINS) :

- a) dérivés 1-aryl-3,5-pyrazolidinedione
- b) distingués des autres AINS conventionnels par leur acidité attribuée au noyau pyrazole
- ☒ c) distingués des autres AINS conventionnels par leur acidité attribuée au 4-OH énolique
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte

9- La synthèse chimique de l'alphaméthyl dopa comporte plusieurs étapes parmi lesquelles ces deux transformations décrites par les réactions suivantes :



- ☒ a) Les transformations décrites font appel à la synthèse de Bücherer-Bergs des acides aminés
- ☒ b) L'obtention de l'hydantoïne nécessite l'emploi de cyanure de potassium KCN en plus du carbonate d'ammonium
- ☒ c) L'hydrolyse de l'hydantoïne nécessite l'emploi de HBr pour aboutir à l'acide aminé
- ☒ d) L'acide aminé obtenu est doué d'activité optique

ResiPharmaTM

10- Le Chlorothiazide :

- a) Est une molécule monocyclique
- b) Présente un seul groupe sulfamide
- c) La saturation de la liaison C3-C4 donne l'Hydrochlorothiazide d'activité moindre
- ☒ d) Est un inhibiteur de l'anhydrase carbonique

11- Relation structure activité de la morphine :

- ☒ a) La fonction alcool en 6 n'est pas nécessaire pour son activité analgésique
- ☒ b) Le cycle aromatique est capital pour son activité analgésique
- c) L'hydroxyle phénolique non libre est indispensable pour son activité analgésique
- ☒ d) La présence de l'azote dans le cycle D est indispensable pour son activité

12- La synthèse des inhibiteurs calciques dérivés des phényl-4 dihydro-1,4pyridines (Nifédipine) :

- ☒ a) Fait intervenir la réaction d'addition de Michael.
- ☒ b) Est basée sur la condensation de deux composés B-dicarbonylés avec une molécule d'aldéhyde en présence d'ammoniac.
- c) Se termine avec une réaction de substitution nucléophile d'une molécule d'ammoniac suivie d'une double déshydratation.
- d) Se termine avec une réaction d'addition nucléophile d'une molécule d'ammoniac suivie d'une double déshydratation.

13- Le mécanisme d'action anti-inflammatoire de l'acide méfénamique implique :

- a) Une interaction ionique avec la phospholipase A2
- b) Une fixation covalente à la phospholipase A2
- c) Une acétylation d'un résidu arginine de la COX-1
- ☒ d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

14- Concernant le mécanisme d'action des antihypertenseurs centraux :

- ☒ a) La méthyldopa est transformée en un composé qui stimule les récepteurs alpha-2 adrénergiques
- ☒ b) La clonidine stimule les récepteurs adrénergiques alpha-2 et les récepteurs aux imidazolines
- c) Rilmenidine et moxonidine agissent uniquement en stimulant les récepteurs alpha-2 adrénergiques
- d) La méthyldopa stimule directement les récepteurs alpha-2 adrénergiques

15- Les diurétiques sulfamides aminobenzoïques :

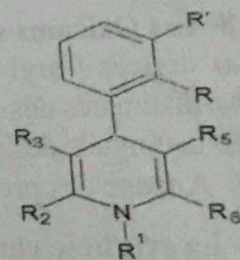
- a) Le substituant en position 1 est obligatoirement une fonction amide
- ☒ b) Il en existe deux familles chimiques selon la position du groupe amino
- c) Agissent au niveau du tube contourné distal
- ☒ d) Le Furosémide en est un exemple

16- Péthidine :

- a) Est un antalgique du deuxième palier
- ☒ b) A une analogie structurale avec la morphine et l'atropine
- ☒ c) Est un antalgique du troisième palier
- d) Appartient à la classe des 4-anilino-pipéridines

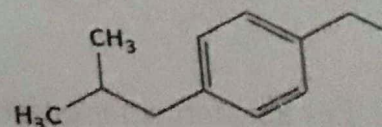
17- Les dihydro-1,4-pyridines : relation entre la structure et l'activité anticalcique :

- a) L'orientation des groupements esters et la formation de liaisons Hydrogènes, deux facteurs qui peuvent attribuer à la molécule une activité agoniste partielle
- ☒ b) Les substituants volumineux en position ortho sur le cycle Benzénique favorisent l'activité anticalcique
- c) l'activité anticalcique diminue avec l'accroissement de la chaîne ester.
- d) Les esters symétriques sont plus vasodilatateurs que les dissymétriques.



18 - La méthylation du 2-(4-isobutylphényl)acétonitrile (ci-contre) au niveau du carbone porteur du groupe nitrile:

- ☒ a) implique l'utilisation d'une base forte permettant la formation d'un carbanion attaqué par l'iodure de méthyle
- b) implique l'utilisation d'un acide fort permettant la formation d'un carbocation attaqué par le formaldéhyde en présence d'un catalyseur $ZnCl_2$
- ☒ c) conduit à un intermédiaire porteur d'un groupement nitrile dont l'hydrolyse basique permet l'obtention d'un anti-inflammatoire non stéroïdien de la série des acides aryles acétiques
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.



ResiPharmaTM

19- Le développement des antihypertenseurs appartenant à la classe des ARAII :

- a) A débuté en mettant au point des analogues peptidiques de l'angiotensine I
- ☒ b) A progressé en étudiant l'effet antihypertensif d'une série d'analogues de l'acide 5-imidazole acétique
- ☒ c) A conduit à la mise au point et la commercialisation du losartan puis de ses analogues
- d) A abouti à des molécules ne possédant aucune analogie structurale

20- Les inhibiteurs de l'enzyme de conversion :

- a) Le Lisinopril en est un dérivé dicarboxylique
- b) L'Enalaprilat est un analogue de dipeptide
- ☒ c) Le Captopril se lie au zinc par le groupe SH
- d) Le Captopril est un analogue de tripeptide

ResiPharmaTM

21- Buprénorphine :

- a) Est un antalgique du deuxième palier
- b) N'a aucune analogie structurale avec la morphine et l'éphédrine
- ☒ c) Est un antalgique du troisième palier
- ☒ d) Est hautement lipophile

22- Les antagonistes calciques :

- a) Se fixent sur plusieurs sous unités au niveau du récepteur.
- b) Le Vérapamil se fixe sur un site allostériquement lié au site des 1,4-dihydropyridines et provoque une augmentation de leur affinité pour leur site.
- c) Le Diltiazem se fixe sur un site qui va diminuer l'affinité des 1,4-dihydropyridines pour leur récepteur.
- ☒ d) Se lie à des sites spécifiques au niveau de la sous unité α_1 du canal VOC de type L.

23- Le développement de l'indométacine :

- ☒ a) a été initié par la supposition que la sérotonine était un médiateur important de l'inflammation
- b) a été basé sur la découverte des propriétés antirhumatisme du célécoxib
- c) a permis l'introduction d'une nouvelle classe d'anti-inflammatoires dérivés de l'acide benzoïque
- d) aucune des propositions précédentes n'est exacte

24- Les SARTAN actuellement commercialisés :

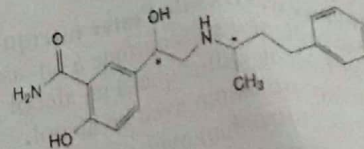
- a) Ont un fort caractère basique
- ☒ b) Comportent un cycle imidazole ou un équivalent isostérique qui mime le cycle de l'histidine de l'angiotensine II
- c) Qui comportent un cycle tétrazole ont une faible biodisponibilité par voie orale
- d) Possèdent une excellente liposolubilité

25- Les inhibiteurs de l'enzyme de conversion de seconde génération :

- a) Sont rapidement inactivés en raison de la présence du groupe COO-
- ☒ b) Sont administrés sous forme de prodrogue
- c) Le Captopril en est le chef de file
- ☒ d) Renferment au moins un carbone asymétrique au sein de leur structure

26- La structure suivante correspond à :

- a) Un dérivé de la classe des aryloxypropanolamines.
- ☒ b) Un dérivé de la classe des aryléthanolamines.
- c) Un dérivé de la classe des sulfonamides.
- d) Un dérivé de la classe des tétrazolés.



27- Le candesartan :

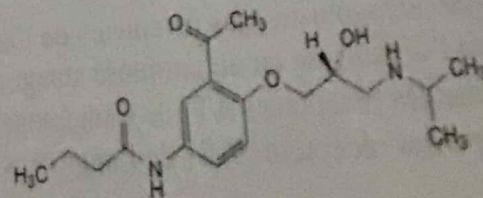
- a) Est métabolisé in vivo en candésartan cilexetil
- ☒ b) Comporte dans sa structure un groupement acide carboxylique
- ☒ c) Est transformé par estérification en une prodrogue commercialisée dans le but d'améliorer sa biodisponibilité par voie orale
- d) Comporte dans sa structure une spirocyclopentane qui augmente les interactions hydrophobes avec le récepteur

28- l'activité agoniste partielle des β -Bloquants :

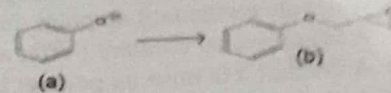
- a) Est due à l'introduction d'un groupement acylaminé sur la chaîne des aryléthanolamines.
- b) Est due à l'introduction d'un groupement aryloxyéthyle sur la chaîne des phényléthanolamines.
- c) Est due à l'introduction d'un groupement aryloxyéthyle sur la chaîne des aryloxypropanolamines.
- ☒ d) Est due à l'introduction d'un groupement acylaminé sur la chaîne des aryloxypropanolamines.

29- Le composé suivant correspondrai à :

- a) Un β -bloquant non cardio-sélectif.
- b) Un inhibiteur calcique des canaux VOC.
- ☒ c) Un β -bloquant cardio-sélectif.
- d) Un antihypertenseur à action centrale.



30- Pour passer du (a) vers le composé (b) :



- ☒ a) Faire réagir le phénolate approprié sur une épichlorhydrine selon deux voies possibles avec rétention de la configuration du carbone asymétrique central.
- ☒ b) En faisant réagir le phénolate avec une amine appropriée.
- ☒ c) Le phénolate peut simplement déplacer l'halogène d'une épichlorhydrine directement selon une SN2.
- d) Réaction d'Acylation selon Friedel et Craft du noyau aromatique.

31- Les liaisons intervenant pour une fixation inhibitrice des β -bloquants sur leur site au niveau du récepteur sont :

- ☒ a) Des interactions π pour les groupements aryles.
- ☒ b) Des liaisons intermoléculaires.
- ☒ c) Des liaisons hydrogène pour le groupement hydroxyle.
- ☒ d) Des liaisons ioniques pour les azotes protonés.

32- Les antiangoreux dérivant des sydnominines comportent principalement dans leurs structures chimiques :

- ☒ a) Un dérivé polycyclique
- ☒ b) Un composé hétérocyclique
- ☒ c) Un dérivé du benzène.
- d) Un dérivé de la pyridine.

33- Les sydnones :

- ☒ a) Ont un cycle de type 1-oxo oxadiazole-1,2,3
- ☒ b) Ont un cycle de type 1-oxo oxadiazole-2,3,4
- ☒ c) Ont un cycle de type 5-oxo oxadiazole-1,2,3
- d) Ont un cycle de type 5-oxo oxadiazole-2,3,4

34- La linsidomine:

- ☒ a) Est le métabolite actif de La molsidomine
- ☒ b) A le même mode de préparation que la molsidomine.
- ☒ c) Le réactif de départ est une aminomorpholine.
- d) A la même solubilité que la molsidomine et donc la même voie d'administration

35- La codéine est métabolisée :

- ☒ a) Dans sa totalité en morphine
- ☒ b) En partie en morphine
- ☒ c) Dans sa totalité en dihydrocodéine
- d) En partie en dihydrocodéine

36- Les opiacés utilisées comme antalgiques du deuxième palier sont :

- ☒ a) l'acide acétylsalicylique
- ☒ b) le tramadol
- ☒ c) la morphine
- ☒ d) la dihydrocodeine.

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

- ☒ a) additionnant un mélange sulfonitrique a un alcool
- ☒ b) additionnant de l'acide sulfurique à un alcool
- ☒ c) faisant réagir l'ion nitronium avec un alcool
- d) faisant réagir l'ion nitronium avec un acide fort

38- Les profènes sont un groupe de molécules :

- ☒ a) développées comme bioisostères azotés de l'acide acétylsalicylique
- ☒ b) dérivés de l'acide propanoïque
- ☒ c) dotés d'un centre de chiralité dont la stéréochimie est importante pour l'activité
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte

39- La clonidine a été conçue au départ comme :

- ☒ a) décongestionnant nasal agoniste des récepteurs α_1 adrénergiques
- ☒ b) inhibiteur de la dopa décarboxylase
- ☒ c) un agoniste des récepteurs α_2 adrénergiques
- d) un agoniste des récepteurs aux imidazolines

40- Le losartan :

- ☒ a) Est le chef de file des antagonistes des récepteurs de l'angiotensine II
- ☒ b) Est métabolisé dans l'organisme en un composé antagoniste des récepteurs AT_2 plus puissant que lui
- ☒ c) Agit par antagonisme des récepteurs AT_1 de l'angiotensine II
- d) Agit par antagonisme des récepteurs AT_2 de l'angiotensine II

ResiPharmaTM



UNIVERSITE D'ALGER 1
FACULTÉ DE MEDECINE

3ème Année de Pharmacie - EMD 1-2019/2020

Date de l'épreuve : 05/01/2020

Page 1/1

Corrigé Type

Barème variable par question

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

N°	Rép.	Barème
36	D	0,5
37	AC	0,5
38	BC	0,5
39	A	0,5
40	AC	0,5

