

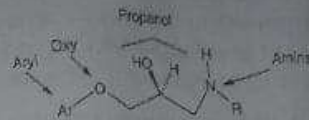
Cochez (la) ou (les) réponse(s) juste(s)

1-Parmi les antidiabétiques oraux, on distingue :

- a) Les agents insulinosensibilisateurs qui agissent par interaction avec les récepteurs SUR1 du pancréas
- b) Les agents insulinosécréteurs dont l'effet thérapeutique est associé à l'interaction avec les récepteurs SUR2A et SUR2B du système cardiovasculaire
- c) Les inhibiteurs de la dipeptidylpeptidase IV qui diminuent la charge de glucose absorbé par l'organisme
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte

2-Dans la série des aryloxypropanolamine, quels sont les substituants ou motifs structuraux qui confèrent à la molécule bêta bloquante une cardio-sélectivité ?

- a) un enchaînement -NH-CO- au niveau du groupement R porté par l'azote de la fonction amine
- b) un enchaînement -NH-CO- en position para sur le cycle aromatique
- c) un enchaînement -NH-CO- au niveau de l'aryle en position ortho et méta
- d) une chaîne arylalkyl ramifiée sur l'azote de la fonction amine.



3-Le Methazolamide :

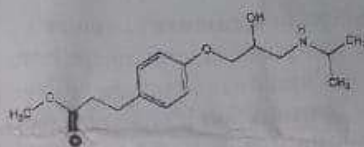
- a) est un inhibiteur de l'anhydrase carbonique comportant un hétérocycle aromatique
- b) diffère de l'Acétazolamide par la présence d'un groupe alkyle sur le cycle le rendant moins actif en raison de l'encombrement stérique
- c) renferme deux groupes sulfamides non substitués indispensables à l'activité
- d) Toutes les réponses sont fausses

4-Les sulfonylurées de deuxième génération sont un groupe d'agents thérapeutiques :

- a) Développé par introduction d'un fragment phénylalanine sur des antidiabétiques de la classe des glinides
- b) Développé par introduction d'un fragment urée sur des sulfonylurées de première génération
- c) Incluant le repaglinide comme chef de file de cette classe
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

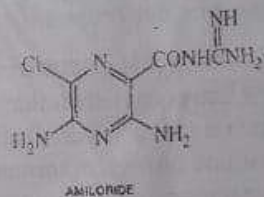
5-Le groupement polaire -COOCH₃ confère à la molécule ci-contre :

- a) une cardiosélectivité
- b) une courte durée d'action suite à une hydrolyse rapide
- c) une activité antagoniste alpha
- d) une sélectivité bêta-1 grâce à une interaction par liaison hydrogène supplémentaire.



6-Soit la molécule ci-contre :

- a) il s'agit d'une molécule apparentée aux sulfamides thiazidiques car ayant le même mode d'action tout en étant dépourvue du groupe sulfamide
- b) la molécule est plane grâce au phénomène de résonnance ce qui est indispensable à l'activité
- c) c'est une molécule appartenant à la classe des inhibiteurs calciques
- d) Aucune réponse n'est juste



7-Les biguanides sont des agents thérapeutiques :

- a) Faisant partie des agents insulinosécréteurs utilisés pour le traitement du diabète de type 1
- b) Faisant partie des agents insulinosensibilisateurs utilisés pour le traitement du diabète de type 2
- c) Incluant la phénformine et buformine comme principaux agents utilisés actuellement
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

8-Le losartan :

- a) est le chef de file des antagonistes des récepteurs de l'angiotensine II
- b) est un dérivé du biphenyltétrazole, substitué par un imidazole
- c) a été mis au point suite à des modifications structurales réalisées sur un des analogues de l'acide 5-imidazole acétique
- d) a été mis au point suite à des modifications structurales réalisées sur un analogue peptidique de l'angiotensine

9-Dans la biosynthèse des hormones thyroïdiennes :

- a) l'iode est apporté exclusivement par l'alimentation sous forme d'iodure
- b) l'hypo-iodite est obtenu par réduction catalytique
- c) la TPO catalyse la fixation d'iode sur la globuline
- d) T3 et T4 sont synthétisées instantanément suite à la baisse de leur taux dans le sang périphérique

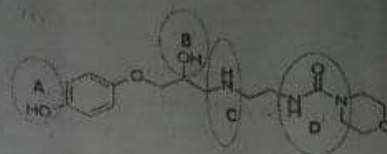
10-Les diurétiques hypokaliémiantes :

- a) appartiennent obligatoirement aux composés sulfamidés
- b) sont des molécules planes
- c) agissent au niveau du tube collecteur en raison de leur analogie structurale avec l'aldostérone
- d) Toutes les réponses sont fausses

ResiPharmaTM

11-Quelles sont les éventuelles interactions mises en jeu entre la molécule donnée ci-contre et le site actif du récepteur adrénergique ?

- a) Tous les groupements entourés (A, B, C, D) sont engagés dans des liaisons hydrogène
- ☒ b) L'azote de la fonction amine (entouré C) après protonation est engagé dans une liaison ionique



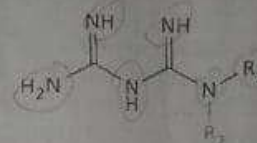
- c) Seuls les groupements A et B sont engagés dans des liaisons hydrogène
- d) Seuls les groupements B et D sont engagés dans des liaisons hydrogène.

12-Les diurétiques sulfamides aminobenzoïques :

- a) possèdent un substituant en position 1 qui est obligatoirement un groupe carboxyle
- b) possèdent sur le cycle aromatique une fonction amine obligatoirement primaire
- c) ont le même mode d'action diurétique que l'acide étacrynique
- d) Aucune réponse n'est juste

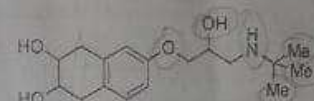
13-Soit la structure ci-contre :

- a) Il s'agit de la structure de base du groupe des glinides
- b) L'introduction d'un cyclohexyle plutôt qu'un phényléthyle en R1 est à l'origine d'une meilleure activité thérapeutique
- c) L'introduction d'un méthyle plutôt qu'un cyclohexyle en R1 est à l'origine d'une meilleure activité thérapeutique
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.



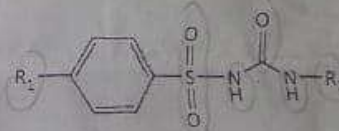
14-La molécule bêtabloquante ci-contre :

- a) est lipophile car elle renferme dans sa structure un motif bicyclique
- b) étant très lipophile, son élimination est hépatique et est distribuée dans le SNC
- c) est hydrophile car la partie benzénique renferme des groupements polaires
- d) Aucune des propositions ci-dessus n'est juste.



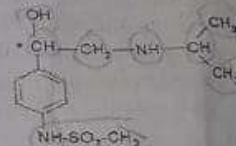
15-Soit la structure ci-contre :

- a) Il s'agit de la structure de base du groupe des sulfonylurées
- b) Il s'agit de la structure de base du groupe des biguanides
- c) L'introduction d'un cyclohexyle plutôt qu'un n-propyle en R2 en plus d'un substituant approprié en R1 correspond à des agents de 2^{ème} génération
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

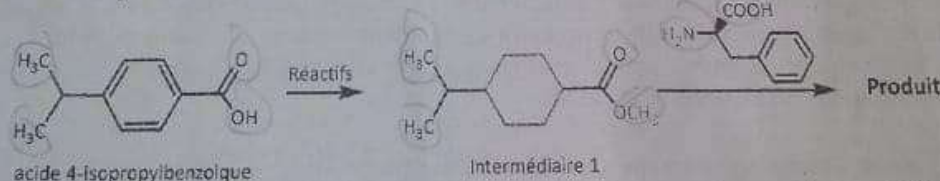


16-La molécule ci-contre :

- a) est une phényléthanolamine, antagoniste des récepteurs adrénergiques β -1 et β -2
- b) est un antagoniste sélectif des récepteurs adrénergiques β -1
- c) est une phényléthanolamine, antagoniste des récepteurs adrénergiques α et β
- d) est une aryloxypropanolamine, antagoniste des récepteurs adrénergiques β -1 et β -2.



17-Soit le schéma de synthèse suivant :



- a) Il s'agit d'une réduction suivie d'une estérification par de l'éthanol pour former l'intermédiaire 1
- b) Il s'agit d'une condensation entre l'intermédiaire 1 et la L-phénylalanine pour former le produit
- c) Il s'agit de la synthèse d'un agent thérapeutique qui stimule la sécrétion de l'insuline
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte

18-Les sartans, sont des médicaments qui :

- a) agissent par blocage des récepteurs AT1 de l'angiotensine II
- b) agissent par blocage des récepteurs AT2 de l'angiotensine II
- c) sont utilisés dans le traitement de l'hypertension artérielle
- d) s'opposent aux effets de l'angiotensine II

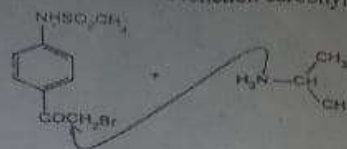
19-L'acétazolamide :

- a) appartient au groupe des sulfamides hétérocycliques
- b) est un diurétique épargneur de potassium
- ☒ c) la présence d'un groupe sulfamide est indispensable à l'activité diurétique
- d) agit par inhibition de l'anhydrase carbonique

ResiPharma™

20-Quelles sont les réactions mises en jeu lors de la synthèse du sotalol ?

- a) Formation d'un méthanesulfonamide en faisant réagir un composé phénolique avec l'épichlorhydrine en présence d'une base
- b) Acylation du $C_6H_5-NHSO_2CH_3$ par $BrCH_2COBr$ suivie de la réduction de la fonction carbonyle du composé obtenu
- c)
- d)



21-Lors de la synthèse de la metformine, la formation de la cyanoguanidine implique :

- a) Une dimérisation de la cyanamide suite à sa protonation initiale en milieu acide
- b) Une déprotonation initiale de la cyanamide en milieu acide
- c) Une protonation initiale du diméthylamine en milieu basique
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.

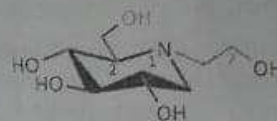
22-Les diurétiques de l'anse :

- a) sont des médicaments dits « épargneurs de potassium »
- b) sont représentés par la Furosémide
- c) sont tous des dérivés de l'acide aminobenzoïque
- d) Toutes les réponses sont fausses

ResiPharma™

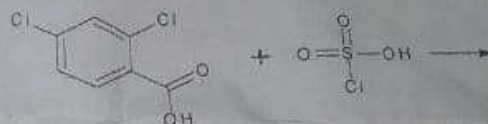
23-Le miglitol ci-contre est un agent qui :

- a) agit comme inhibiteur des α -glucosidases
- b) agit par interaction avec les récepteurs sulfonylurées
- c) peut-être synthétisé à partir d'une molécule de glucose comme substrat de départ
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte.



24-Soit la réaction ci-dessous entre l'acide-2,4-dichlorobenzoïque et l'acide chlorosulfurique, première étape de la synthèse de sulfamides diurétiques :

- a) Il s'agit d'une réaction de substitution nucléophile aromatique
- b) le produit de la réaction sera l'acide-2,4-dichloro-6-sulfobenzoylique
- c) on assistera à la formation d'un seul composé
- d) Toutes les propositions sont fausses



25-L'activité insulinothrompique des sulfonylurées au niveau des cellules β du pancréas est associée à :

- a) L'inhibition de la dipeptidyl peptidase IV
- b) Une interaction anionique avec les récepteurs SUR2A et SUR2B
- c) Une interaction covalente avec les récepteurs SUR2A
- d) Aucune des propositions précédentes n'est exacte

26-Au cours du développement des molécules diurétiques, il s'est avéré que :

- a) l'aromaticité du cycle- en ce qui concerne les sulfamides- n'était pas indispensable pour obtenir une activité diurétique : c'est d'ailleurs le cas pour l'acétazolamide
- b) Le groupe sulfamoyl des sulfamides ne doit jamais être substitué quel que soit le site d'action de la molécule
- c) le remplacement de l'un des groupes sulfamoyls dans les composés disulfamidés par un groupe isostère a permis de développer de nouvelles classes de molécules ayant des sites d'action différents
- d) Toutes les réponses sont fausses

27-Les molécules ARAII sont des prodrogues à l'exception de :

- a) Candesartan cilexetil
- b) Olmesartan medoxomil
- c) Azilsartan medoxomil
- d) Losartan

28-La molécule de Chlorothiazide :

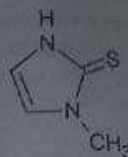
- a) est un apparenté aux thiazidiques renfermant un hétérocycle aromatique
- b) possède une action natriurétique des plus puissantes qui s'accompagne d'une élimination du potassium
- c) est obtenue par cyclisation qui consiste en une réaction d'addition-élimination intramoléculaire
- d) Toutes les réponses sont fausses

29-Les diurétiques dits d'épargne potassique :

- a) favorisent l'élimination des ions potassium par action sur la pompe Na^+/K^+
- b) sont représentés par les pseudo-antialdostérone qui comportent une analogie structurale avec l'aldostérone dont ils occupent le récepteur
- c) ont le Triamterene comme exemple
- d) Aucune réponse n'est juste

30- Soit la structure ci-contre ; il s'agit de :

- a) Carbimazole
- b) Méthimazole**
- c) Econazole
- d) Fluconazole.



31- Les diurétiques épargneurs de potassium :

- a) appartiennent à la famille des sulfamides
- b) agissent au niveau du tube contourné proximal
- c) sont représentés par les dérivés de l'acide phénoxy acétique
- d) Toutes les réponses sont fausses

32- Le propylthiouracile :

- a) inhibe la synthèse des hormones thyroïdiennes**
- b) diminue la conversion de T3 en T4
- c) est obtenu par condensation d'une cétone avec une thiourée
- d) n'est pas un mercaptoimidazole.

33- La structure ci-contre correspond à celle :

- a) de l'irbesartan
- b) du valsartan
- c) du candesartan
- d) d'un antagoniste des récepteurs de l'angiotensine II



34- Les médicaments diurétiques :

- a) renferment au sein de leur structure au moins un groupe sulfamoyle
- b) agissent uniquement sur les ions sodium dont ils augmentent l'élimination urinaire
- c) renferment la classe des diurétiques osmotiques dérivés de l'acide phénoxyacétique
- d) Toutes les réponses sont fausses

35- Le méthimazole :

- a) est une prodrogue ;
- b) est le métabolite actif du carbimazole**
- c) est un dérivé imidazolé
- d) est un diurétique.

ResiPharmaTM

36- Concernant le cycle tétrazole contenu dans la majorité des antagonistes des récepteurs de l'angiotensine II :

- a) dans les composés de bi phényle, le tétrazole doit être en position ortho pour une activité optimale
- b) il confère une bonne stabilité métabolique, une biodisponibilité orale et une lipophilie
- c) il peut être constitué lors de la synthèse chimique de ces médicaments en faisant appel à l'azoture de tributylétain $\text{Bu}_3\text{Sn N}_3$
- d) Toutes les propositions ci-dessus sont justes

37- La thyroxine :

- a) est obtenue par condensation de 2 molécules de diiodotyrosine ;
- b) est une tétraiodothyronine ;
- c) est appelée hormone T4
- d) Toutes les propositions sont fausses

38- Dans une molécule donnée, la présence de l'enchaînement thiouré :

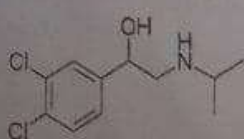
- a) est une condition nécessaire et suffisante à l'activité anti-thyroïdienne
- b) est une condition nécessaire mais insuffisante à l'activité anti-thyroïdienne
- c) peut-être corrélée à une activité anti-thyroïdienne ;
- d) Aucune des propositions n'est juste.

39- Dans la synthèse chimique du carbimazole :

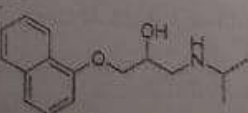
- a) il est d'abord obtenu la prodrogue ;
- b) l'action du $\text{Cl-COOC}_2\text{H}_5$ sur le méthimazole permet d'obtenir le produit actif
- c) il est nécessaire de condenser le méthylaminoacétaldéhyde avec le thioformamide
- d) la N-alkylation est assurée par un ester β -cétonique

40- Parmi les molécules dont les structures sont données ci-dessous quelles sont celles qui antagonisent de façon non sélective les récepteurs bêta adrénergiques (antagonistes β_1 et β_2) ?

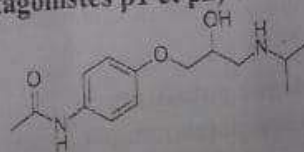
a)



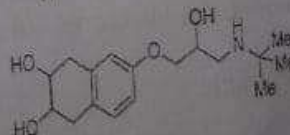
b)



c)



d)



Date de l'épreuve : 11/07/2021

Corrigé Type

Barème par question : 0,5000

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

N°	Rép./Alternatives 1&2		
36	ABCD	D	ABC
37	ABC		
38	C		
39	BC		
40	BD		



CHIHAB WALID

Date de l'épreuve

N°	
1	ABAD
2	ABAD
3	ABBA
4	ABBA
5	ABBA
6	ABDE
7	ABDE
8	ABDE
9	ABNO
10	ABRO
11	AFTI
12	AHDO
13	AIMA
14	AIME
15	AIT
16	AIT
17	AIT
18	AIT
19	AIT
20	AIT
21	AITA
22	AKN
23	AKR
24	AKT
25	AL H
26	ALH
27	ALI
28	ALI
29	ALL
30	ALM
31	ALS
32	AM
33	AM
34	AM
35	AM
36	AM
37	AN
38	AN
39	AO
40	AO