

Chimie Thérapeutique EMD 02 – 2020 (V1)

1- les aminosides :

- A- sont des dérivés de polyols cycliques à 5 chaînons.
- B- Comprennent dans leur structure des osamines.
- C- Comportent des liaisons osidiques en 4,5 pour la génine streptidine.
- D- Comportent des liaisons osidiques en 4,5 pour la génine 2-désoxystreptidine.
- E- Sont des oligosaccharides basiques sous forme anionique à PH physiologique.

2- Les céphalosporines :

- A- Ont pour noyau l'acide 6-aminocéphalosporanique.
- B- L'insaturation en 2-3 est importante pour l'activité bactérienne.
- C- Les molécules de 1^{ère} génération sont les plus actives sur les bactéries à gram positif.
- D- Les molécules de 1^{ère} génération sont les moins actives sur les bactéries à gram positif.
- E- Sont des oligosaccharides basiques sous forme anionique à PH physiologique.

ResiPharmaTM

3- Les tétracyclines :

- A- Selon l'UPAC, le noyau de base des cyclines est nommé « naphthalènes ».
- B- L'oxytétracycline possède un substituant chloro- sur le cycle D.
- C- A cause de leur spectre large, ils perturbent la flore intestinale et peuvent donc entraîner des mycoses digestives.
- D- Ils sont contre-indiqués chez la femme enceinte et les enfants.
- E- Sont des oligosaccharides basiques sous forme anionique à PH physiologique.

4- Tétracyclines et MLS :

- A- Les tétracyclines bloquent la synthèse protéique et se fixant sur une protéine spécifique aux procaryotes.
- B- Les tétracyclines inhibent la phase d'élongation (empêchant l'interaction codon-anticodon).
- C- L'épimérisation en 4, qui peut se produire en milieu acide, est sans effet sur l'activité des tétracyclines.
- D- Malgré leurs structures dissemblables, les médicaments du groupe MLS (Macrolides-Lincosamides-synergistines) possèdent tous un large spectre d'action.
- E- En inhibant la translocation, les macrolides bloquent la phase d'élongation lors de la synthèse protéique.

5- Les macrolides :

- A- La sélectivité d'action des macrolides sur les procaryotes résulte du remplacement de l'une des deux adénines nécessaires à leur fixation par une thymine chez les eucaryotes.
- B- La résistance croisée à l'intérieur du groupe MLS résulte de la synthèse d'une méthylase qui dénature l'adénine du chromosome bactérien et empêche ainsi la fixation de l'antibiotique.
- C- Il s'agit d'une résistance chromosomique.
- D- L'érythromycine est utilisée en association aux bêta-lactamines s'allergie ou résistance.
- E- La pristinamycine PYOSTACINE[®] est un antibiotique de la famille des Synergistines, efficace contre les infections staphylococciques (méningites exclues).

6- Activité et résistance des quinolones :

- A- La norfloxacin est une fluoroquinolone urinaire.
- B- Ce sont des antibiotiques bactériostatiques.
- C- Les quinolones inhibent deux enzymes appartenant au groupe des topoisomérases de type II, et qui sont spécifiques aux procaryotes.

- D- Ils se fixent sur les deux sous-unités A de la gyrase et inhibent spécifiquement l'activité ligase (empêchent la soudure des brins coupés de l'ADN)
- E- A résistance acquise est très fréquente, et est due à une modification des enzymes cibles.

7- Les quinolones :

- A- Sont produits par héli-synthèse à partir d'extraits de *streptomycètes*.
- B- La structure générale des quinolones dérivé de l'acide 1,4-dihydro-4-oxoquinoléine-3-carboxylique.
- C- Le chef de file des quinolones est l'acide nalidixique.
- D- Ils peuvent être utilisés chez la femme enceinte en cas de pneumopathie atypique.
- E- Les quinolones de 2^{ème} génération sont également appelés fluoroquinolones, à cause de leur substituant fluoro- en 6.

8- Amino-alcools :

- A- L'hydroxyde de (2-hydroxyéthyle)-triméthylammonium est communément appelé acétylcholine.
- B- La choline est un parasymphatomimétique faible, mais à cause de son hépatotoxicité, elle ne peut pas être utilisée en thérapeutique.
- C- Les analogues de l'acétylcholine sont des agonistes cholinergiques ou cholinomimétiques directs, sélectifs aux récepteurs muscariniques.
- D- Pour ces agonistes muscariniques, la chaîne alkyle reliant l'atome d'azote quaternaire à l'ester peut comporter 2 ou 3 carbones.
- E- La méthacholine est 3 fois plus stable vis-à-vis de l'hydrolyse que l'acétylcholine grâce à gêne stérique créée par le groupement méthyle surnuméraire.

ResiPharmaTM

9- Les agents alkylants :

- A- Sont des médicaments cytotoxiques récemment découverts.
- B- Les agents bi-fonctionnels lient toujours deux brins d'ADN.
- C- Les agents monofonctionnels sont nucléophiles.
- D- Les agents monofonctionnels sont électrophiles.
- E- Aucune proposition n'est juste.

10- La mitomycine C :

- A- Est un alkylant direct.
- B- Est un alkylant indirecte.
- C- Est un alkylant activé par bio oxydation.
- D- Est un alkylant activé par bio réduction.
- E- Aucune proposition n'est juste.

11- Les oxazophorines :

- A- Sont des agents anti-métabolites de faible toxicité.
- B- Sont des agents anti-métabolites activé par bio réduction.
- C- Sont des pro drogues.
- D- Les molécules possèdent une liaison double oxygène-phosphore.
- E- Aucune proposition n'est juste.

12- La quinine :

- A- La fonction OH de la quinine est en avant du plan.

- B- La fonction OH de la quinidine est en avant du plan.
- C- Est un dérivé de la 4-aminoquinoleine.
- D- Est un alcaloïde naturel extrait à partir de l'écorce du quinquina.
- E- Aucune proposition n'est juste.

13- L'amodiaquine :

- A- Est un dérivé de la 4-aminoquinoleine.
- B- Est un dérivé de la 8-aminoquinoleine.
- C- Est indiqué en cas de résistance à la chloroquine.
- D- Est un antipaludéen indiqué en cas de rechute.
- E- Aucune proposition n'est juste.

ResiPharmaTM

14- Les antipaludéens de synthèse :

- A- L'intégrité du noyau quinoléique est favorable pour l'activité.
- B- Les dérivés halogénés sont actifs sur les formes hépatiques du parasite.
- C- Pour une activité optimale, la chaîne intermédiaire doit se composer de 3 carbones.
- D- Pour une activité optimale, la fonction OH doit s'orienter en arrière du plan.
- E- Aucune proposition n'est juste.

15- Concernant la fonction amine terminale des catécholamines :

- A- La fonction est protonée au PH physiologique.
- B- La fonction est hydroxylée au PH physiologique.
- C- Les amines tertiaires et les ions ammonium sont les plus actifs.
- D- Les amines tertiaires et les ions ammonium sont inactifs.
- E- Aucune proposition n'est juste.

16- Concernant les catécholamines :

- A- Les sympathomimétiques indirectes ont une forte affinité pour les récepteurs alpha adrénergique.
- B- Les sympathomimétiques indirectes ont une forte affinité pour les récepteurs bêta adrénergique.
- C- Le changement de position des OH phénoliques ou leur substitutions protège contre la COMT.
- D- La noradrénaline n'est active que par voie parentérale
- E- Aucune proposition n'est juste.

17- La noradrénaline :

- A- Est une catécholamine mono hydroxylé.
- B- Est une catécholamine bihydroxylé.
- C- Est une catécholamine trihydroxylé.
- D- Est un dérivé de l'adrénaline N-substitué.
- E- Aucune proposition n'est juste.

18- L'Acétazolamide est un sulfamide :

- A- Utilisé comme diurétique.
- B- Utilisé en ophtalmologie comme hypotenseur de l'œil.
- C- Il entraîne des perturbations d'équilibre électrolytique.
- D- Utilisé comme hypoglycémiant.

E- Aucune proposition n'est juste.

19- Le Glubuthiazol est un sulfamide :

- A- Utilisé comme hypoglycémiant.
- B- Hypoglycémiant possédant également des propriétés bactériostatiques.
- C- Il entraîne des perturbations d'équilibre électrolytique.
- D- Utilisé comme diurétique.
- E- Aucune proposition n'est juste.

20- Le noyau tropane :

- A- Est une association de deux hétérocycles.
- B- Représente le tropanol.
- C- Représente le scopanol.
- D- Représente le tropane.
- E- Aucune proposition n'est juste.

• **Corrigé type :**

- 1- BD
- 2- BC
- 3- CD
- 4- BE
- 5- E
- 6- ACD
- 7- BCE
- 8- CE
- 9- D
- 10- D
- 11- CD
- 12- AD
- 13- AC
- 14- A
- 15- AD
- 16- CD
- 17- C
- 18- ABC
- 19- AB
- 20- ABCD

