

QCM Cochez la (les) bonne (s) réponse (s)

01/Concernant les relations structure activité des phénolés :

- ☒ a- La substitution sur le noyau aromatique ne peut être qu'en position para.
- ☒ b- La substitution d'un hydrogène par un méthylsulfonyl augmente l'activité.
- ☒ c- La substitution du groupe nitro par un méthylsulfonyl augmente l'activité.
- ☒ d- La substitution d'un hydrogène par un méthylsulfonyl réduit la toxicité.
- ☒ e- Un groupement dichloro-acétyle sur la chaîne latérale donne un maximum d'activité.

02/Concernant l'activité de ce composé :



- ☒ a- présente comme cible d'action la leucylaminoacyl-tRNA synthétase.
- ☒ b- Le remplacement de l'atome de fluor par un chlore diminue l'activité.
- ☒ c- La méthylation de l'azote piperazinique diminue la résistance bactérienne.
- ☒ d- Un reste carboxylique en position 3 est indispensable.
- ☒ e- Le remplacement de l'oxygène par un soufre augmente l'activité thérapeutique.

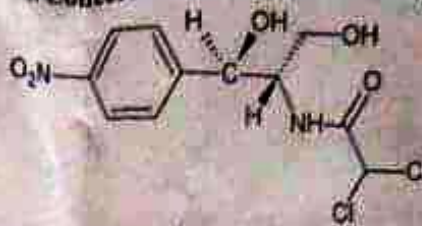
03/ La stéréochimie de l'amoxicilline est :

- ☒ a- 2R 5R 6R.
- ☒ b- 2R 5R 6S.
- ☒ c- 2S 5R 6S.
- ☒ d- 2S 5S 6R.
- ☒ e- 2S 5R 6R.

04/ La pénicilline G est produite par condensation des 3 acides aminés suivants :

- ☒ a- L-valine, L-glucine et L-leucine.
- ☒ b- L-valine, L-leucine, L-sérine.
- ☒ c- L-valine, L-cystéine et l'acide 2-aminohexanedioïque.
- ☒ d- L-valine, L-cystéine et l'acide L-α-asparagine.

05/ Concernant l'action de ce composé :



- ☒ a- Le site d'action est la sous-unité 30 S du ribosome.
- ☒ b- Le site d'action est la sous-unité 50 S du ribosome.
- ☒ c- L'isomère 1R, 2S est inactif.
- ☒ d- Le groupement dichloroacétyle facilite la pénétration dans la bactérie.
- ☒ e- C'est un inhibiteur de la péptidylsynthétase.

06/ La dégradation de la pénicilline G en milieu gastrique donne :

- ☒ a- l'acide pénicillénique.
- ☒ b- l'acide pénicillanique.
- ☒ c- l'acide pénilloïque.
- ☒ d- l'acide pénicilloïque.
- ☒ e- l'acide-6-aminopénicillanique.

07/ Parmi les propositions suivantes laquelle (lesquelles) qui permet (permettent) d'obtenir une quinolone :

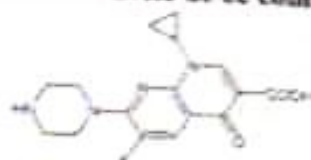
- ☒ a- Un mélange entre : aniline, éthoxyméthylènemalonate de diéthyle, iodoéthane.
- ☒ b- Un mélange entre : aniline, éthoxyéthylènemalonate de diéthyle, iodoéthane.
- ☒ c- Un mélange entre : aniline, éthoxyméthylènemalonate de diéthyle, un halogénure d'alkyle.
- ☒ d- mélange entre : arylamine, malonate de diéthyle, iodoéthane.
- ☒ e- Aucune proposition n'est juste.

Q2/M Cochez la (les) bonne (s) réponse (s)

01) Concernant les relations structure activité des phénolés :

- ☒ a- La substitution sur le noyau aromatique ne peut se faire qu'en position para.
☒ b- La substitution d'un hydrogène par un méthylsulfonyl augmente l'activité.
☐ c- La substitution du groupe nitro par un méthylsulfonyl augmente l'activité.
☒ d- La substitution d'un hydrogène par un méthylsulfonyl réduit la toxicité.
e- Le groupement dichloro-acétyle sur la chaîne latérale donne un maximum d'activité.

02) Concernant l'activité de ce composé :



- a- Présente comme cible d'action la topoisomérase I.
☒ b- Le remplacement de l'atome de fluor par un chlore diminue l'activité.
☒ c- La méthylation de l'azone pipérazinique diminue la résistance bactérienne.
d- Un reste carboxylique en position 3 est indispensable.
e- Le remplacement de l'oxygène par un soufre augmente l'activité thérapeutique.

03) La stéréochimie de l'amoxicilline est :

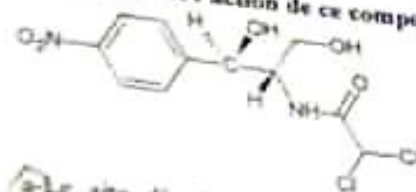
- a- 2R 5R 6R.
b- 2R 5R 6S.
c- 2S 5R 6S.
d- 2S 5S 6R.
☒ e- 2S 5R 6R.

04) La pénicilline G est produite par condensation des 3 acides aminés suivants :

- a- L-valine, L-glucine et L-leucine.
b- L-valine, L-leucine, L-sérine.
☒ c- L-valine, L-cystéine et l'acide 2-aminohexanedioïque.
d- L-valine, L-cystéine et l'acide L- α -asparagine.

a- L-valine, L-cystéine et l'acide L- α -aminoadipique.

05) Concernant l'action de ce composé :



- ☒ a- Le site d'action est la sous-unité 30 S ribosome.
b- Le site d'action est la sous-unité 50 S ribosome.
c- L'isomère 1R, 2S est inactif.
☒ d- Le groupement dichloroacétyle facilite la pénétration dans la bactérie.
e- C'est un inhibiteur de la péptidylsynthèse.

06) La dégradation de la pénicilline milieu gastrique donne :

- a- L'acide pénicillénique.
☒ b- L'acide pénicillanique.
c- L'acide pénilloïque.
d- L'acide pénicilloïque.
e- L'acide-6-aminopénicillanique.

07) Parmi les propositions suivantes (lesquelles) qui permet (permettent) une quinolone :

- ☒ a- Un mélange entre : aniline, éthoxyméthylénemalonate de diéthyle, iodoéthane.
b- Un mélange entre : aniline, éthoxyéthylénemalonate de diéthyle.
☒ c- Un mélange entre : aniline, éthoxyméthylénemalonate de diéthyle, halogénure d'alkyle.
☒ d- Un mélange entre : arylamine, malonate de diéthyle, iodoéthane.
e- Aucune proposition n'est juste.

9/ Les carbapénèmes diffèrent des pénèmes par :

- ☒ a- Une double liaison entre carbone 2 et 3.
- ☐ b- Une double liaison 2-3 et substitution d'un atome de soufre par un carbone.
- ☒ c- Remplacement de l'atome de soufre par un atome de carbone.
- ☐ d- Remplacement du cycle thiazolidine par un cycle dihydrothiazine.
- ☐ e- Aucune réponse n'est juste.

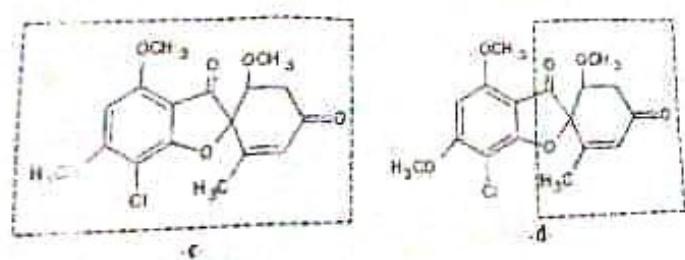
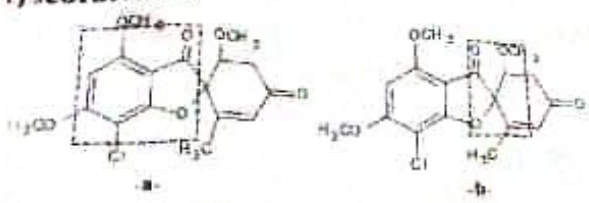
10/ L'addition de 2 groupements méthoxyle sur le noyau aromatique de la méthicilline, entraîne :

- ☐ a- Une instabilité en milieu acide.
- ☒ b- Un encombrement stérique autour du noyau.
- ☐ c- Un encombrement stérique autour de la liaison amide.
- ☐ d- Une activité sur les bacilles à gram négatif.
- ☐ e- Une hydrolyse enzymatique.

11/ L'amoxicilline est un :

- ☐ a- Aminobenzylpénicilline.
- ☐ b- Oxapénèmes.
- ☐ c- Carbapénèmes.
- ☒ d- Carboxybenzylpénicillines.
- ☐ e- Uréidopénicillines.

12/ Quelle partie de la molécule est responsable de l'activité anti-inflammatoire de la Glisofulvine :



e- Aucune réponse n'est juste

12/ Le pyrazinamide est un antituberculeux majeur :

- ☒ a- Préparé par l'action de l'ammoniaque sur la pyrazine-2-carboxylate d'éthyle.
- ☒ b- Dont le nom est pyridazine-2-carboxamide.
- ☐ c- Préparé à partir de la 4-méthylpyridine.
- ☒ d- Est un dérivé de l'acide isonicotinique.
- ☒ e- Préparé à partir de l'acide pyrazine-2-carboxylique.

Un produit « X » est obtenu via le mode opératoire suivant :

On fait traiter la 4-méthylpyridine par le permanganate de potassium concentré et à chaud pour donner (A).
On fait réagir sur le composé (A) un mélange d'acide sulfurique et d'éthanol, pour donner un composé (B).
Le composé (B) réagit sur un réactif (C) pour donner le produit X.

13/ Concernant la réaction entre le composé (B) et le réactif (C) :

- ☒ a- Le réactif (C) est l'ammoniaque.
- ☐ b- Le réactif (C) est l'hydrazine.
- ☒ c- Il s'agit d'une réaction de substitution électrophile.
- ☒ d- Il s'agit d'une réaction d'addition-élimination.
- ☐ e- Toutes les réponses sont justes.

14/ Le produit X est :

- ☐ a- Un dérivé de la pyrimidine.
- ☐ b- Un dérivé de la pyridazine.
- ☐ c- Un dérivé de la pyrazine.
- ☒ d- Un dérivé de l'acide isonicotinique.
- ☐ e- L'Hydrazide isonicotinique.

15/ Développement des recherches des antipaludiques :

- ☐ a- Passe par le bleu de méthylène.
- ☒ b- Les dérivés de l'acridine colorent en jaune les téguments
- ☒ c- L'élimination du noyau qui porte le Cl de la quinacrine donne la chloroquine.
- ☒ d- le groupement OCH_3 est nécessaire à l'activité.
- ☐ e- Aucune de ces réponses

15/ Quinoléine :

- a Sa structure correspond à l'accolement d'un cycle benzénique à un cycle pyridinique en position 2,3.
- ☒ b Le doublet de l'azote participe à la mésomérie
- c Son oxydation donne l'acide quinoléique
- d L'Acide quinoléique peut facilement être décarboxylé en acide isonicotinique
- e Aucune de ces réponses

17/ La substitution sur le noyau quinoléine.

- ☒ a La nitration se fait sur le noyau quinoléique sur les carbones 4 et 7.
- ☒ b La nitration se fait sur le noyau benzénique sur les carbones 5 et 8.
- ☒ c La substitution nucléophile se fait sur le noyau pyridinique qui est pauvre en densité électronique
- ☒ d La substitution électrophile se fait sur le noyau pyridinique qui est pauvre en densité électronique
- e Aucune de ces réponses *est juste*

18/ Le procédé de Skraup :

- ☒ a Est une voie de synthèse du noyau quinoléine non substitué.
- ☒ b En fait réagir l'aniline et l'acroléine.
- ☒ c En fait réagir l'o-aminobenzaldéhyde et l'acroléine.
- ☒ d Utilise le KMnO_4 comme oxydant doux dans la dernière étape.
- e Aucune de ces réponses

19/ la quinine :

- a Caractérisée par la stéréochimie des carbone 8 et 9 : Quinine 8R et 9R.
- b Caractérisée par la stéréochimie des carbone 8 et 9 : Quinine 8S et 9R.
- c Caractérisée par la stéréochimie des carbone 8 et 9 : Quinine 8R et 9S.
- d Sa structure comporte un noyau quinoléique et un noyau quinuclidinique.
- e Aucune de ces réponses

Les antipaludiques de synthèse

- a Comportent les dérivés de 9-aminoquinoléine
- ☒ b Comportent les dérivés de 8-aminoquinoléine
- ☒ c Méfloquine est un dérivé de la 4-quinoléinylméthanol
- d Comportent les dérivés de l'amino-4-acridine
- e Aucune de ces réponses

21/ Les céphalosporines :

- ☒ a Le noyau actif commun des céphalosporines est la céphalosporine C
- b Le noyau actif commun des céphalosporines L'acide 7-aminocéphalosporanique (7-ACA)
- c Le noyau céphème est caractérisé par un cycle bêtalactame accolé à un hétérocycle hexagonal insaturé
- d Le noyau céphème est caractérisé par un cycle bêtalactame accolé à un hétérocycle hexagonal saturé
- e Aucune de ces réponses

22/A propos de la Synthèse des céphalosporines

- ☒ a Elles peuvent être synthétisées à partir de la pénicilline.
- b La synthèse à partir de la pénicilline passe par la réaction de PUMMERER
- c La synthèse à partir de la céphalosporine C passe par la réaction de PUMMERER
- d La synthèse à partir de la pénicilline passe par la réaction de GABRIEL
- e Aucune de ces réponses

23/ Relation structure Activité des céphalosporines :

- ☒ a La modulation sur la chaîne latérale en position 7 conditionne l'activité antibactérienne.
- b La modulation sur la chaîne latérale en position 7 conditionne aussi la stabilité vis-à-vis des bêta-lactamases
- c Le radical en position 3 permet la formation des prodrogues.
- d La réponse C. est juste.
- e Aucune de ces réponses

24/ Les macrolides :

- a- Les macrolides sont des Hétérosides lipophiles
- b- Agissent sur la sous unité 50S du ribosome sur le site P
- c- Agissent sur la sous unité 50S du ribosome sur le site A
- d- Agissent sur la sous unité 30S du ribosome sur le site P.
- e- Aucune de ces réponses

25/ L'érythromycine

- a- L'érythromycine est un macrolide à cycle à 16 atomes
- b- L'érythromycine est un macrolide à cycle à 14 atomes
- c- L'érythromycine (A) constitue le produit utilisé en thérapeutique.
- d- L'érythromycine est un mélange de plusieurs substances voisines : A,B,C,D utilisé tel quel en thérapeutique.
- e- Aucune de ces réponses

26/ La spiramycine :

- a- La spiramycine est un macrolide à cycle à 16 atomes.
- b- La spiramycine est un macrolide à cycle à 14 atomes
- c- La spiramycine (1) est le produit utilisé en thérapeutique.
- d- C'est un mélange de trois substances hétérosidiques très voisines utilisées tel quel en thérapeutique.
- e- Aucune de ces réponses

27/ Les tétracyclines

- a- Possèdent en commun un noyau naphtacène carboxamide
- b- Agissent sur la sous unité 50S du ribosome sur le site A
- c- Agissent sur la sous unité 30S du ribosome.
- d- Sont des antibiotiques bactéricides.
- e- Aucune de ces réponses

28/ L'hémisynthèse de la minocycline :

- a- On part de 6-diméthyltétracycline (DMT)
- b- On part de 6-déméthyltétracycline (DMT)
- c- La nitration donne uniquement le composé 7-nitro.
- d- La dernière étape est une réaction d'amination réductrice.
- e- Aucune de ces réponses

Bon courage



Département de Pharmacie - Contrôle n°3 de Chimie Thérapeutique - A3 -

Date de l'épreuve : 04/07/2019

Corrigé Type - Variante 1

Barème par question : 0,714286

N°	Rép.
1	AE
2	BD
3	E
4	CE
5	BD
6	A
7	AC
8	C
9	C
10	A
11	A
12	AE
13	BD
14	DE
15	AB
16	AC
17	BC
18	AB
19	BD
20	BC
21	BC
22	AB
23	AB
24	AB
25	BC
26	AD
27	AC
28	BD

Dr. GUEROUL M
Maitre Assistant HU
En Chimie Thérapeutique

