

Cocher la (les) réponse (s) juste (s)

1/ Dans la synthèse des dérivés nitrés :

- ☒ a- La nitration s'effectue par un mélange acide sulfurique et acide nitrique.
- b- La nitration s'effectue par un mélange acide sulfurique et nitrite de sodium.
- ☒ c- Le mélange donne un dioxoammonium $O=N^+=O$
- ☒ d- Le mélange donne un nitrosonium $O=N^+$

2/ Le Nicorandil :

- ☒ a- Est synthétisé à partir de l'acide nicotinique
- ☒ b- Active l'ouverture des canaux potassiques
- ☒ c- Possède une fonction ester nitrique responsable de l'augmentation du taux de GMP cyclique intracellulaire.
- d- Aucune de ces réponses n'est juste.

3/ Développement des recherches des antihistaminiques H1 :

- ☒ a- La découverte est à partir du pipéroxanne.
- ☒ b- La série A représente les éthylènes diamine.
- c- Développement de la série B à partir du diphenylacétonitrile.
- d- Les antihistaminiques H1 de deuxième génération réduit l'acidité gastrique.

4/ Réaction de mannich :

- a- Met en jeu un composé possédant une fonction énolisable.
- ☒ b- Nous faisant réagir l'aldéhyde formique en présence d'une amine secondaire en milieu acide
- ☒ c- Le cation ainsi formé réagira avec l'énol pour donner une amino cétone.
- d- Aucune de ces réponses n'est juste.

5/ Le Chlorambucil

- a- Lors de la synthèse du chlorambucil, l'estérification de l'acide 4-(4-nitrophényl) butanoïque peut se faire après la réduction de la fonction nitro en amine primaire.
- b- Lors de la synthèse du chlorambucil, l'estérification de l'acide 4-(4-nitrophényl) butanoïque se fait avant la réduction de la fonction nitro en amine primaire.
- ☒ c- Le doublet libre de l'azote est entraîné dans la mésomérie du cycle benzénique
- d- La résonance dans la molécule du chlorambucil augmente la vitesse de formation de l'ion éthylèneiminium.

6/ La chlorméthine :

- a- Sous la forme protonée, le produit subit une réaction d'élimination
- b- Est stable sous sa forme neutre.
- c- L'éthylèneiminium est très réactif car il représente un centre nucléophile très puissant.
- ☒ d- Aucune de ces réponses n'est juste.

7/ Les nitrosourées :

- ☒ a- Les molécules dont la DCI se termine par « mustine » sont des chloroéthylnitrosourées (CENU)
- b- Les molécules dont la DCI se termine par « mustine » sont des nitrosurées aminoglycosylées
- ☒ c- 1-méthyl-1-nitrosourée (MNU) est actif sur des modèles animaux de leucémie mais ce composé est instable
- d- La 1-méthyl-1-nitrosourée (MNU) est commercialisée en portant la DCI carmustine.

8/ Les Sulfonyle alcane :

- ☒ a- Le busulfane est synthétisé par estérification par le chlorure de méthane sulfonyle en milieu pyridinique
- b- Les pontages covalents ADN-protéines modifient la flexibilité d'ADN
- ☒ c- Le tréosulfan est un alkylant direct
- d- L'improsulfan a deux fonction ester propane sulfonyle.

9/ Cytarabine :

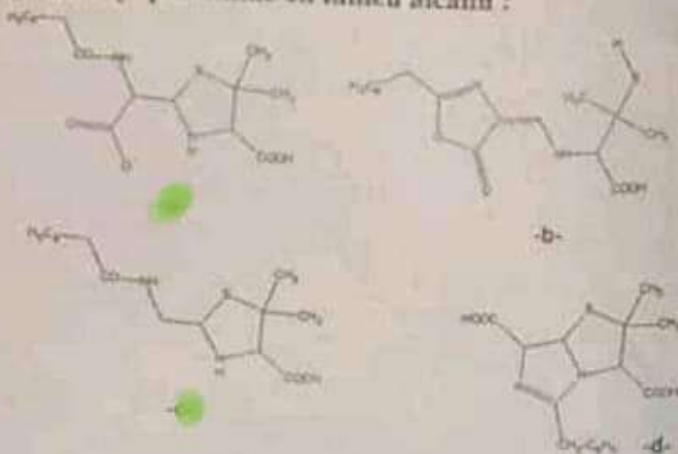
- ☒ a- Analogue de la cytidine où le ribose est remplacé par l'arabinose.
- b- L'Ara-C a été obtenue par chauffage de la cytidine dans l'acide sulfurique
- c- Est convertie par la voie de récupération des purines, en cytosine-arabinose-5'-monophosphate (Ara-CMP) par la dCyd kinase.
- ☒ d- Inhibe les ADN polymérases.

10/ Gemcitabine :

- a- Porte un fluor en position 2'
- b- Porte deux chlore en position 2'
- ☒ c- Inhibiteur de la RiboNucléotide Réductase RNR.
- d- Ne Peut pas être incorporé dans l'ADN.

ResiPharmaTM

d/ Parmi les structures suivantes laquelle (lesquelles) est (sont) obtenu (es) après dégradation de la benzyl pénicilline en milieu alcalin :



21/L'acétazolamide :

a- Est un sulfamide diurétique de l'anse.

☒ b- Renferme dans sa structure un noyau thiazole.

☒ c- La dernière étape de sa synthèse passe par un mécanisme d'addition-élimination.

☒ d- Favorise l'élimination du bicarbonate de sodium.

22/Le but de la découverte des dérivés oxazophorines est :

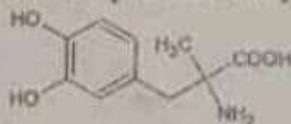
☒ a- Synthétiser une prodrogue qui ne sera active qu'en milieu intracellulaire par bioreduction.

☒ b- Diminuer la réactivité chimique avec les entités nucléophiles autres que les bases de l'acide nucléique.

☒ c- Diminuer la toxicité cellulaire sur les tissus sains.

d- Améliorer la pharmacocinétique des moutardes d'azote.

23/La synthèse du composé suivant passe par :



☒ a- La réaction de SHIMAZAKI.

b- La réaction de MANNICH.

☒ c- La réaction de BUCHERER.

☒ d- La condensation de CLAISEN.

24/Concernant le mode d'action de la mitomycine C :

☒ a- Elle donne une alkylation monofonctionnelle sur le carbone 10.

☒ b- Elle donne une alkylation sur l'azote 2 de la guanine.

c- Elle donne essentiellement une monoalkylation à partir du dérivé de réduction leucoazirinomitosène.

☒ d- Le méthoxyle en 9a est indispensable.

25/Concernant le Disaziquone :

☒ a- Le groupement pharmacophore est le cycle éthylène-imine.

☒ b- La fonction quinone n'est pas indispensable.

☒ c- Il est actif après bioreduction.

d- Les groupements carbonates sont indispensables pour l'activité.

26/L'hydrolyse de la mitomycine C en milieu acide :

a- Donne un mélange cis/trans 2,7 diamino-1-hydroxy-mitosène.

b- Passe par un composé intermédiaire « azirinomitosène » isolable.

☒ c- A pH=1 donne plus de composés d'hydrolyse de configuration cis que trans.

d- A pH=1 donne un mélange de composés cis et trans à proportions égales (50/50).

27/Concernant les complexes de platine :

☒ a- Ils sont dégradables à 100°C.

b- Pour la synthèse d'un composé de configuration trans, on démarre notre synthèse à partir du tétra-aminoplatinate.

☒ c- La photoréactivité dépend du pH du milieu.

☒ d- Les ligands chloro sont facilement déplaçables par les thiols intracellulaires au niveau rénal.

28/ Concernant l'amoxicilline :

☒ a- Il s'agit d'une amidobenzylpénicilline.

☒ b- Elle peut être obtenue par la même stratégie de synthèse que l'ampicilline.

☒ c- Nécessite pour sa synthèse les réactifs suivants : chloroformate de benzyle et d'éthyle, éthanol, HBr.

d- Il s'agit du carboxybenzylpénicilline.

29/ Concernant la mêtécilline :

☒ a- Obtenue par une réaction d'amidification entre l'acide 2,6-diméthoxybenzoïque et le 6-APA.

b- Très sensible aux pénicillinases.

c- Il s'agit de la pénicilline V diméthoxylé.

☒ d- Elle Résiste aux pénicillinases grâce à l'encombrement stérique autour de la liaison amide provoqué par les groupements méthoxyles.

30/ Concernant les dihydro-1,4-pyridines :

☒ a- Les composés avec une pyridine N substituée sont biologiquement actifs.

b- La suppression du groupement nitro ne modifie pas l'activité thérapeutique.

☒ c- Ils présentent tous une sélectivité pour les vaisseaux.

☒ d- Les groupes esters renforcent l'activité biologique.

11/ Mode d'action des antipariques :

- a- Thioguanine inhibe la formation de phosphoribosylamine
- b- La pentostatine perturbe le catabolisme de la cytosine.
- c- la cladribine inhibent l'ADN polymérase
- d- La mercaptopurine s'incorpore comme faux nucléotides dans l'anabolisme de l'ARN et l'ADN

12/ La 6-mercaptopurine :

- a- La synthèse se fait à partir d'un dérivé pyrimidinique
- b- La synthèse se fait à partir de l'hypoxanthine
- c- La synthèse met en jeu le POCl_3 comme agent chlorant.
- d- Aucune de ces réponses n'est juste.

13/ Céphalosporines :

- a- Le noyau actif commun des céphalosporines est la céphalosporine C
- b- Le noyau céphème est caractérisé par un cycle bêtalactame accolé à un cycle 1,3-dihydrothiazine
- c- La modulation du groupement R, en position 3, conditionne les propriétés pharmacocinétiques
- d- Le principe de la synthèse consiste à agrandir le cycle dihydrothiazine des pénicillines par incorporation d'un méthyle en 2.

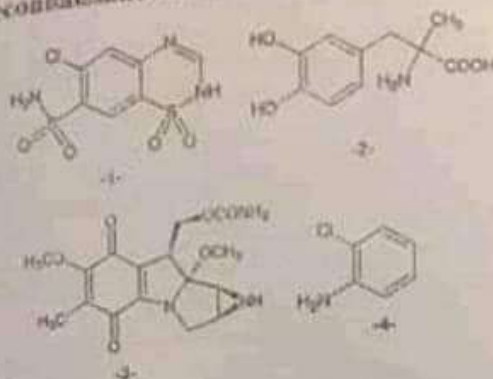
14/ La chloroquine

- a- Est un dérivé de la 4-aminoquinoléine
- b- Est un dérivé de la 8-aminoquinoléine
- c- Le chlore en position 7 sur le noyau quinoléine donne une meilleure activité antiparasitaire
- d- Inhibe la détoxification de l'hème issue de la dégradation de l'hémoglobine.

15/ La quinoléine :

- a- Synthétisée par addition de l'acroléine sur l'aniline suivie d'une oxydation douce.
- b- La substitution électrophile se fait sur le noyau pyridinique
- c- Le doublet libre de l'azote ne participe pas à la mésomérie
- d- Aucune de ces réponses n'est juste.

16/Reconnaissance des structures :



- a- 1 et 2 sont des antihypertenseurs.
- b- 4 est un réactif de départ pour la synthèse du Chloramidophénamide.
- c- 3 est utilisé comme anticancéreux.
- d- 2 agit sur les récepteurs α_2 périphériques.

17/Concernant l'activité des sels de platine :

- a- Ils donnent essentiellement des liaisons intercaténales.
- b- Les ligands azotés sont indispensables pour la liaison avec l'ADN.
- c- Les ligands chlorés sont meilleurs que les ligands nitrés.
- d- L'utilisation de thiosulfate diminue la néphrotoxicité provoquée par les sels.

18/L'interaction du captopril avec le site actif de l'enzyme de conversion met en jeu :

- a- Une liaison hydrogène.
- b- Une liaison ionique entre un résidu de l'enzyme chargé positivement et un groupement carboxyle chargé négativement.
- c- Une complexation entre le groupement carboxylate et le zinc.
- d- Une liaison ionique entre un résidu de l'enzyme chargé positivement et un groupement thiol chargé négativement.

19/ Dans le Vérapamil :

- a- La présence d'une amine tétra-substituée confère à la molécule une activité optimale.
- b- La présence d'un centre chiral implique qu'il existe deux formes optiquement actives où les énantiomères S bloquent plus les canaux calciques que les énantiomères R.
- c- Au niveau du carbone benzylique di-substitué : les groupements cyano et isopropyle ne sont pas essentiels pour l'activité.
- d- La nature et la position des substituants sur le cycle A et le cycle B n'influencent pas la réponse biologique.

ResiPharmaTM

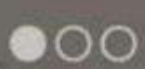
402.

Barème par question

N°	Rép.
1	AC
2	ABC
3	AB
4	ABC
5	BC
6	D
7	AC
8	ABC
9	AD
10	C
11	AD
12	ABC
13	BC
14	ACD
15	AC
16	AB
17	CD
18	AB
19	ABC
20	AC
21	CD
22	BC
23	CD
24	BD
25	AC
26	AC
27	CD
28	BC
29	AD
30	CD



Dr. G.
Maître
En Chimie



SHOT ON MI 9 LITE
AI TRIPLE CAMERA