

10/ Les fluoroquinolones :

- ☐ Ils se caractérisent par la présence d'un fluor en position 7.
- ☒ A cause de sa diffusion tissulaire médiocre, la ciprofloxacine est une fluoroquinolone urinaire.
- ☒ Le groupement acétamide en position 3 est indispensable à l'activité thérapeutique.
- ☒ Les fluoroquinolones sont des antibiotiques bactéricides.

11/ Parmi les propositions suivantes concernant les quinolones laquelle est fausse :

- ☒ Le chef de file des quinolones est l'acide nalidixique.
- ☒ La synthèse des quinolones peut être réalisée selon la méthode de GOULD et JACOB.
- ☒ Sont produits par hémisynthèse à partir d'extraits de *Streptomyces* sp.
- ☒ Les quinolones forment avec les métaux des complexes chélatés.

12/ L'activité des quinolones :

- ☒ Les quinolones inhibent la topoisomérase de type I.
- ☒ Ils se fixent sur les deux sous-unités A de la gyrase et empêchent la coupure des brins de l'ADN.
- ☒ La structure d'acide bêta-cétonique autorise la chélation des divers cations divalents.
- ☒ Les quinolones de première génération ne sont pas indiquées dans les infections urinaires.

13/ L'éthambutol :

- ☒ Comporte un axe de symétrie.
- ☒ Comporte 4 carbones asymétriques.
- ☒ Il présente 4 énantiomères.
- ☒ Parmi les stéréo-isomères il y a un qui n'a pas de pouvoir rotatoire.

14/ La synthèse de la Rifampycine :

- ☒ Elle se fait totalement par synthèse chimique.
- ☒ Elle passe par la réaction de Mannich.
- ☒ La rifampycine SV est un antituberculeux.
- ☒ La fonction immonium s'hydrolyse en une fonction alcool.

15/ Parmi les propositions suivantes concernant la Streptomycine laquelle est fausse :

- ☒ Est un macrolide.
- ☒ Est un aminoside.
- ☒ Est un inhibiteur de la synthèse protéique.
- ☒ Donne une ototoxicité.

16/ La chaîne en position 8 de la pamaquine est :

- ☒ N¹-N¹-diéthylpentane-1,4-diamine
- ☐ Pentane-1,4-diamine
- ☐ N¹-N¹-diéthylbutane-1,4-diamine

17/ Parmi les propositions suivantes quelle est celle qui permet d'obtenir des céphalosporines de 2^{ème} génération résistant aux β -lactamases :

- ☒ a- L'encombrement stérique provoqué par la chaîne en position 7 autour du noyau β -lactame.
- ☐ b- L'encombrement stérique provoqué par le substituant en position 3 autour du noyau β -lactame.
- ☐ c- L'encombrement stérique provoqué par le substituant en position 4 autour du noyau β -lactame.
- ☐ d- L'insaturation en position 2,3.

18/ La méfloquine est un dérivé de :

- ☐ a- L'8-amino-quinoléine.
- ☐ b- L'9-amino-quinoléine.
- ☐ c- L'4-amino-quinoléine.
- ☒ d- Le 4-quinolénylméthanol.

19/ Parmi les propositions suivantes laquelle est fausse :

- ☒ La chloroquine est un dérivé de la 8-amino-quinoléine.
- ☒ Le proguanil est obtenu à partir de la 4-chloro-aniline.
- ☐ c- La céphalosporine C est obtenue à partir de *penicillium acremonium*.
- ☒ Dans les céphalosporines, le cycle β -lactame est plus résistant que dans les pénicillines.

20/ Concernant la relation structure-activité des tétracyclines :

- ☒ a- Le remplacement du groupe carboxamide en 2 par un nitrile est favorable.
- ☐ b- Un substituant chloré en 9 est défavorable.
- ☐ c- Un substituant amine en 7 est défavorable.
- ☒ d- La configuration R du carbone 4 augmente l'activité.

21/ La céphalosporine C :

- ☒ a- Est facilement isolée.
- ☒ b- Possède une chaîne apolaire.
- ☒ c- Est facilement hydrolysée en milieu acide.
- ☒ d- Possède une configuration absolue 6R, 7R.

22/ Concernant les céphalosporines :

- ☐ a- Le noyau céphème est caractérisé par un cycle bêtalactame accolé à un cycle 1,3-dihydrothiazine.
- ☒ b- Le principe de la synthèse consiste à agrandir le cycle thiazolidine des pénicillines par incorporation d'un méthyle en 3.
- ☒ c- La synthèse à partir de la céphalosporine C passe par la réaction de PUMMERER.

****Cochez la bonne réponse****

01 / Les antibiotiques de la famille des bêta-lactamines :

- ☒ a- Ils se fixent au niveau de protéine enzymatique ayant une affinité élevée au bêta-lactamines.
- ☐ b- Ils représentent les pénicillines.
- ☒ c- Ils peuvent être inactivés par des enzymes bactériennes toujours codées par des gènes plasmidiques.
- ☒ d- Aucune molécule d'entre eux n'est active sur les bactéries du genre *Pseudomonas*.

02 / L'activité antibiotique des bêta-lactamines nécessite en outre :

- ☐ a- la présence d'une fonction à caractère acide sur le carbone en position 3.
- ☐ b- la présence d'une fonction ester liée au cycle azetidienne.
- ☒ c- La configuration exacte de deux ou plusieurs centres de chiralité.
- ☒ d- La présence obligatoire d'un soufre en position 4.

03 / Parmi les propositions suivantes concernant la résistance des bactéries aux Bêta-lactamines, laquelle est fausse :

- ☐ a- Elle peut être acquise.
- ☐ b- Le support génétique peut être un plasmide.
- ☒ c- Elle ne peut pas être due à une mutation.
- ☐ d- Elle peut correspondre à une inactivation enzymatique de l'antibiotique.

04 / Dans la synthèse de l'Ampicilline :

- ☒ a- Le reste R en position 6 est obtenu par voie microbiologique.
- ☒ b- La condensation se fait entre le 6-APA et le para aminophénol en position 6.
- ☒ c- La dernière étape est la libération de la fonction amine.
- ☒ d- Elle peut être obtenue par une simple hydroxylation de l'Amoxicilline.

05 / L'Amoxicilline :

- ☐ a- Inhibe la synthèse des phospholipides chez les bactéries.

- ☒ b- Peut-être dégradée par les bêta-lactamases bactériennes.
- ☐ c- Est une molécule naturelle.
- ☒ d- L'association avec l'acide clavulanique favorise son absorption intestinale.

06 / A propos des pénicillines :

- ☒ a- La pénicilline V possède un atome d'oxygène supplémentaire par rapport à la pénicilline G.
- ☒ b- La pénicilline G n'est active que sur les bactéries Gram négatif.
- ☒ c- La dégradation des pénicillines en milieu acide donne l'acide pénique qui comporte un seul hétérocycle pentagonal dans sa structure.
- ☒ d- La dégradation des pénicillines en milieu alcalin donne un acide qui comporte deux hétérocycles dans sa structure.

07 / Les phénicolés :

- ☒ a- Inhibe la synthèse protéique en se fixant sur la sous-unité 30 S du ribosome.
- ☒ b- Le chloramphénicol peut présenter un effet bactéricide avec certains germes.
- ☒ c- La chaîne dichloroacétamide n'est pas favorable à l'activité.
- ☒ d- Le groupement méthylsulfone est responsable de la toxicité de la molécule.

08 / Le Chloramphénicol :

- ☒ a- Est un composé naturel.
- ☒ b- Est fabriqué maintenant par voie microbiologique.
- ☒ c- Il comporte dans sa structure 4 carbones asymétriques.
- ☐ d- L'énantiomère lévogyre [1R, 2R] est le produit officinal.

09 / La synthèse du Chloramphénicol :

- ☒ a- Peut-être synthétisé à partir de l'acétophénone.
- ☐ b- Sa synthèse à partir du p-nitroacétophénone passe par la réaction de Michael.
- ☐ c- L'hydrogénation sélective du groupement carbonyle conduit à l'énantiomère érythro.
- ☐ d- L'hydrogénation sélective du groupement carbonyle conduit à l'énantiomère thréo.

Les autres réponses sont justes

3/Concernant les relations structure-activité des antipaludéens à noyau quinoléine :

a-Le groupement méthoxy est indispensable pour l'activité.

b-L'atome de chlore en position 7 sur le noyau quinoléine lui confère une activité optimale.

c-Le groupe trifluorométhyle en position 2 conditionne une activité antipaludique élevée.

d-Le groupe trifluorométhyle en position 8 prolonge l'activité et diminue la phototoxicité.

4/Les céphalosporines à structure α -aminée sont caractérisées par :

a-Un carbone asymétrique supplémentaire avec une configuration (S).

b-Un caractère lipophile dominant.

c-Ce sont des antibiotiques de 3^{ème} intention.

d-Un pKa situé entre 5 et 6.

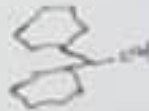
25/ Parmi ces substrats lequel est utilisé pour la synthèse de la Phéniramine :

a-Benzhydrol.

b-Phénol.

c-Acétophénone.

d-Pyridine-2-amine.



26/La quinine :

a-Caractérisée par la stéréochimie des carbone 8 et 9 : Quinine 8R et 9R.

b-Caractérisée par la stéréochimie des carbone 7 et 9 : Quinine 7S 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 quinaclidinique.

27/Les macrolides :

a-Sont des hétérosides hydrophiles.

b-Agissent sur la sous unité 50S du ribosome.

c-Agissent sur la sous unité 30S du ribosome.

d-Aucune de ces réponses.

28/Les tétracyclines

a-Possèdent en commun un noyau naphthalène.

b-Agissent sur la sous unité 50S du ribosome.

c-Agissent sur la sous unité 30S du ribosome.

d-Sont des antibiotiques bactéricides.

✓ 29/Concernant l'hémisynthèse de la minocycline :

a-Le substrat de départ est la 6-diméthyltétracycline (DMT).

b-Le substrat de départ est la 6-déméthyltétracycline (DMT).

c-La nitration en 7 donne un seul produit.

d-Aucune de ces réponses.

30/Concernant les antihistaminiques H₁ :

a-La fixation sur les récepteurs-H₁ nécessite une forme compacte de l'histamine.

b-Les antihistaminiques H₁ sont des inhibiteurs irréversibles de l'interaction de l'histamine avec les récepteurs-H₁.

c-Ils se combinent préférentiellement à la forme inactive du récepteur.

d-Ils se combinent préférentiellement à la forme active du récepteur.

Bon courage.

RP

ResiPharmaTM

Nº	Rép.
1	A
2	C
3	C
4	C
5	B
6	A
7	B
8	A
9	A
10	D
11	C
12	C
13	D
14	B
15	A
16	A
17	A
18	D
19	A
20	B
21	D
22	A
23	B
24	D
25	C
26	D
27	B
28	C
29	B
30	C

Cochez la (les) bonne (s) réponse (s)

1/Concernant ce montage :



- ☒ a- Il s'agit d'un montage de chauffage à reflux.
☐ b- Il est utilisé seulement dans les réactions à longue durée.
☐ c- Il est utilisé afin de diminuer les pertes des réactifs.
☐ d- Il n'a pas d'influence sur le rendement de la synthèse chimique.

2/ Si pour 1g de réactif R1 et 2mL de réactif R2 on obtient 90 % de produit. Quelle masse réelle de produit a-t-on obtenue dans ce cas ?

($MM_{R1} = 138,12 \text{ g/mol}$, $MM_{R2} = 102,08 \text{ g/mol}$,
 $d_{R2} = 1,08$; $MM_{\text{produit}} = 180,15 \text{ g/mol}$)

- ☐ a- 1,80 gr
☐ b- 1,51 gr
☐ c- 1,09 gr
☒ d- 1,17 gr

3/ Concernant l'utilisation de l'acide chlorhydrique dans la dernière étape de synthèse de la phénytoïne :

- ☐ a- Permet de diminuer la solubilité de la phénytoïne dans le solvant.
☒ b- Permet de transformer la phénytoïne sodique en phénytoïne.
☒ c- Il s'agit d'un phénomène de relargage.
☒ d- Il s'agit d'un phénomène de recristallisation.

4/ Le test de Mac Nally permet de chercher la présence d'une fonction :

- ☒ a- Ester.
☒ b- Alcool.
☒ c- Phénol.
☒ d- Amide.

5/ Le solvant utilisé dans la synthèse de l'aspirine est :

- ☒ a- L'anhydride acétique.
☐ b- L'eau.
☐ c- L'acide sulfurique.
☐ d- Aucun.

22

6/ Parmi les proposition (s) suivante (s) laquelle (lesquelles) est (sont) juste (s) :

- ☐ a- L'aspirine est très soluble dans l'eau.
☒ b- Le point de fusion de l'aspirine est de 135°C .
☐ c- On utilise le bunc kofler directement après son allumage.
☒ d- L'aspirine donne en présence du chlorure ferrique une couleur bleue violette.

7/ Concernant le point de fusion d'un médicament :

- ☐ a- Il permet de vérifier la pureté du produit.
☒ b- Il permet de vérifier l'identité du produit.
☐ c- Il est constant quelle que soit la pression.
☐ d- Aucune réponse n'est juste.

8/ Lors de la synthèse de la phénytoïne, l'action de la base sur le benzyle donne :

- ☒ a- L'acide benzoïque.
☒ b- La phénytoïne sodique.
☐ c- Le benzylate de sodium.
☒ d- La benzoïne.

Exercice :

Introduire dans un erlenmeyer bien sec, 5,0 g d'acide salicylique.
 - Ajouter 6,0 mL d'anhydride acétique et 2 gouttes d'acide sulfurique concentré.
 - Chauffer à reflux en utilisant un réfrigérant à boule pendant 20 min à 70°C .

Données : $M(\text{Aspirine}) = 180,0 \text{ g/mol}$, $M(\text{acide salicylique}) = 138,0 \text{ g/mol}$, $M(\text{anhydride}) = 102,0 \text{ g/mol}$, $d(\text{anhydride}) = 1,08$, $\rho_{\text{eau}} = 1 \text{ g/mL}$.

09/ Les quantités de matière des réactifs utilisés :

- ☐ a- Acide salicylique : $2,4 \cdot 10^{-2}$ et Anhydride acétique : $1,2 \cdot 10^{-2} \text{ mol}$.
☒ b- Acide salicylique : $3,6 \cdot 10^{-2}$ et Anhydride acétique : $6,35 \cdot 10^{-2} \text{ mol}$.
☒ c- Acide salicylique : $4,2 \cdot 10^{-2}$ et Anhydride acétique : $5,1 \cdot 10^{-2} \text{ mol}$.

d-Acide salicylique : $6,5 \cdot 10^{-4}$ et Anhydride acétique : $7,3 \cdot 10^{-2}$ mol

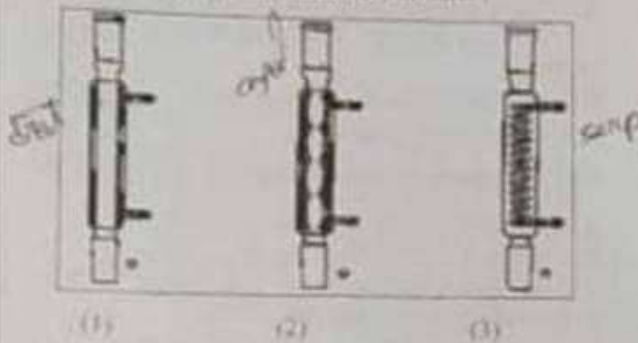
10/ La masse théorique d'aspirine.

- a-5,1 g
- b-3,6 g
- ☒ c-6,48 g
- d-4,2 g

11/ Calculer le rendement de la réaction si vous trouvez 3g de produit :

- ☒ a-46,29%
- b-58,82%
- c-71,42%
- d-83,33%

12/ Observer les instruments suivants :



- ☒ a- (1) est un réfrigérant serpentin
- ☒ b- (2) est le réfrigérant le plus performant
- c- Dans le réfrigérant (1) l'eau de robinet circule dans le compartiment interne
- ☒ d- Les instruments sont utilisés pour condenser la vapeur émise lors des réactions chimiques

13/ L'identification des produits de synthèse :

- ☒ a- La température de fusion est un critère d'identification.
- ☒ b- La réaction au chlorure ferrique est une réaction d'orientation qui détecte les énols et les phénols
- ☒ c- La réaction au chlorure ferrique est une réaction spécifique pour l'identification de l'aspirine.
- d- La UCM est une technique chromatographique qualitative qui permet la vérification de la pureté des produits de synthèse.

14/ La purification par recristallisation :

- ☒ a- Est une technique de purification des produits solides.
- ☒ b- La solubilisation du produit brute se fait à chaud.
- c- La cristallisation du produit pure se fait à chaud.
- ☒ d- Les impuretés sont solubles dans le solvant choisi à chaud et insoluble à froid.

15/ A propos de la synthèse de l'aspirine au laboratoire :

- a- On doit utiliser de la verrerie sèche pour éviter la dégradation de l'acide salicylique.
- ☒ b- L'anhydride acétique est un agent acétylant qui donne une réaction totale.
- ☒ c- On peut utiliser l'acide sulfurique comme agent acétylant.
- d- L'acide sulfurique est un réactif qui permet d'augmenter le rendement de la réaction.

N°	Rép.
1	AC
2	D
3	BC
4	A
5	A
6	B
7	AB
8	C
9	B
10	C
11	A
12	AD
13	ABD
14	AB
15	BC

Page 2 sur 3

ResiPharmaTM

Page 3 sur 3