

****Choisissez la bonne réponse****

1/ Concernant l'activité des barbituriques :

- a- Les barbituriques diminuent la fréquence d'ouverture du canal à chlorures du récepteur GABA.
- ☒ b- La substitution du carbone en position 5 par un groupement phényle favorise l'activité antiepileptique.
- c- La substitution de l'oxygène lié au C₂ par un soufre favorise l'activité antiepileptique.
- d- Les thiobarbituriques sont des composés inactifs.

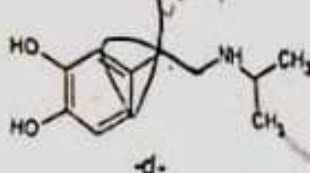
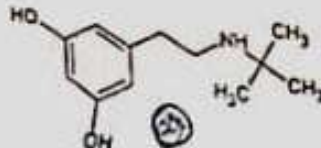
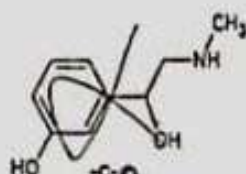
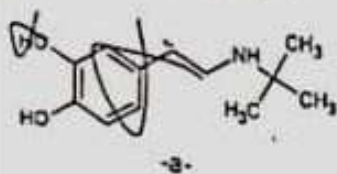
2/ Concernant le Salbutamol :

- ☒ a- La présence d'un tert-butyle sur l'azote entraîne une sélectivité de type β_2 .
- b- Il s'agit d'un dérivé de catécholamine métaphénolique utilisé comme bronchodilatateur.
- c- La présence d'un isopropyle sur l'azote entraîne une sélectivité de type β_2 .
- d- Il s'agit d'un dérivé de catécholamine paraphénolique utilisé comme bronchoconstricteur.

3/ La synthèse des acides barbituriques substitués se fait par condensation de l'urée avec les esters maloniques substitués :

- a- L'ester malonique substitué est synthétisé par action d'un halogénoalcane convenable sur l'anhydride acétique activé en présence d'éthylate de sodium.
- ☒ b- L'éthylate de sodium est un catalyseur dont le rôle est de créer un centre nucléophile (carbanion) sur l'acide malonique
- c- L'ester malonique substitué par un groupe phényle est synthétisé par action d'un halogénoaryle convenable sur l'ester malonique non substitué.
- d- Toutes les réponses sont justes.

4/ Parmi ces substances la quelle est utilisée comme sympathomimétique :



5/ Dans la synthèse du diclofénac, la réaction entre l'acide 2-chlorobenzolique et la dichloroaniline est une réaction de :

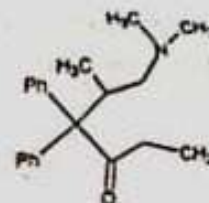
- a- Substitution électrophile.
- ☒ b- Addition électrophile.
- c- Substitution nucléophile.
- d- Substitution radicalaire.

6/ Les études de relation structure activité ont montré une différence de l'activité antalgique entre la morphine et la normorphine :

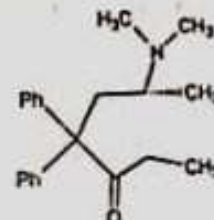
- ☒ a- La normorphine plus polaire, moins lipophile que la morphine passe facilement au niveau central.
- b- La normorphine moins polaire, plus lipophile que la morphine passe facilement au niveau central.
- c- La morphine moins polaire, plus lipophile que la normorphine passe facilement la barrière hématoencéphalique.
- d- La morphine plus polaire, plus lipophile que la normorphine passe facilement la barrière hématoencéphalique.

7/ Dérivés de structure diarylpropylamine :

- ☒ a- La structure suivante est celle du produit majoritaire dans la synthèse.



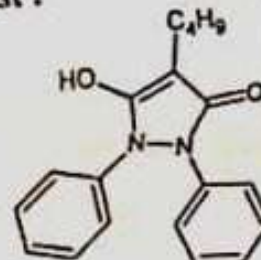
b- Le composé suivant est plus actif que la morphine.



c- La (R) méthadone est moins active que la morphine.

☒ d- La (S) isométhadone est plus active que la morphine.

8/ Ce composé est :



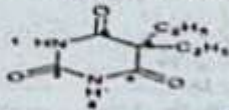
phénylbutane-2-one

ResiPharmaTM

Obtenu par un mécanisme de substitution électrophile.

- Obtenu par un mécanisme d'addition-élimination.
 Un dérivé du pyrrole.
 Obtenu par un mécanisme d'addition nucléophile sur un groupe ester.

9/ Concernant le barbital: le phénomène d'ionisation se fait sur l'azote (3) et le carbone (2) et non pas sur l'azote (3) et le carbone (4):



cela peut être expliqué par le fait que:

- a- Le carbone 2 soit présent entre 2 atomes d'azote.
- b- Le carbone 4 soit plus électropositif que le carbone 2.
- c- La densité électronique sur le carbone 4 soit plus importante que celle du carbone 2.
- d- Aucune réponse n'est juste.

10/ La synthèse de l'ibuprofène passe par une réaction de Fridel et craft:

- a- Il s'agit d'une réaction de substitution nucléophile sur un cycle aromatique.
- b- Il s'agit d'une réaction d'alkylation d'un cycle aromatique.
- c- Il s'agit d'une réaction d'acylation d'un cycle aromatique.
- d- Aucune réponse n'est juste.

11/ Parmi ces réactions laquelle permet la synthèse du paracétamol à partir du para aminophénol:

- a- Estérification.
- b- Amidification.
- c- Oxydation.
- d- Réduction.



12/ Concernant l'activité des barbituriques:

- a- Le caractère basique favorise le passage de la BHE sous forme ionique.
- b- L'insaturation des groupements alkyles en 5 augmente l'effet antiépileptique.
- c- La lipophilie des molécules diminue en remplaçant l'oxygène par le soufre.
- d- L'effet hypnotique du phénobarbital est dû au groupement éthyle en 5.

13/ Concernant l'activité de l'acide valproïque:

- a- L'effet sédatif est proportionnel à la longueur de la chaîne alkyle jusqu'à 9 carbones.
- b- L'activité diminue avec la substitution de la chaîne alkyle.
- c- L'amidification de la fonction acide diminue l'activité.

d- C'est un inhibiteur des canaux calciques.

14/ Les (H)-profènes:

- a- Sont des arylcarboxyliques
- b- Sont des arylacétates.
- c- Sont indiqués dans le traitement de l'inflammation.
- d- Aucune réponse n'est juste.

15/ Concernant les OXICAMES:

- a- L'acidité est due au groupement sulfone.
- b- La nature de l'hétérocycle fixé sur la liaison amide influence la sélectivité de l'effet inhibiteur de la COX.
- c- Le Tenoxicam appartient aux oxicames de 2^{ème} génération.
- d- Ce sont tous des inhibiteurs sélectifs de la cyclo-oxygénase 2.

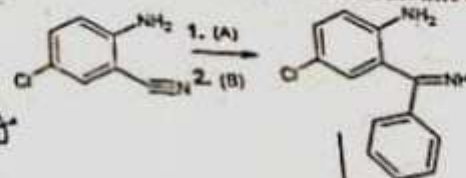
16/ Les médicaments du système nerveux central agissent dans le but de corriger les anomalies suivantes:

- a- Dans l'anxiété: l'activité du GABA est diminuée.
- b- Dans la schizophrénie: Hypofonctionnement dopaminergique.
- c- Dans la dépression: Hyperfonctionnement d'une ou de plusieurs monoamines.
- d- Dans la maladie de Parkinson: Déficit en dopamine au niveau du striatum, associé à une hyperactivité sérotoninergique relative.

17/ La synthèse du méprobamate:

- a- Met en jeu deux réactions de déshydratation.
- b- Met en jeu deux réactions d'aldolisation.
- c- Le diol formé comporte un carbone asymétrique.
- d- La déshydratation de l'alpha aldol donne un aldéhyde alpha éthylénique.

18/ Dans le schéma réactionnel suivant:



Produit X

4. KOH
Saponification

- a- A est un organomagnésien
- b- B est une déshydratation
- c- Le produit X est un ester
- d- C'est la forme sel

19/ Classification des neuroleptiques:

- a- Ils sont classés en 2 générations selon l'ordre chronologique d'apparition.
- b- Les thioxanthènes sont des neuroleptiques deuxième génération.
- c- Les phénothiazines occupent préférentiellement récepteurs 5HT2 que les récepteur D2.
- d- Les benzamides occupent préférentiellement récepteurs D2 que les récepteur 5HT2.

20/ L'Halopéridol est un dérivé de l'amino-4 fluorobutyrophénane

a-L'allongement du pont butyle améliore l'activité.
b-L'azote aminé tertiaire est engagé dans un cycle pipéraziné

c-Présente une fonction alcool tertiaire dans sa structure

d-Aucune de ces réponses n'est juste.

21/ Relation structure activité des antidépresseurs tricycliques:

a-Le cycle central des antidépresseurs tricycliques qui possède deux carbones hybridés sp^3 fait que l'angle de torsion soit nul.

b-Les amines III^{me} inhibe préférentiellement la recapture de la noradrénaline

c-Les amines I^{me} sont les plus actives

d-Aucune de ces réponses n'est juste

22/ Mécanisme d'action des antidépresseurs:

a-L'iproniazide est un inhibiteur de MAO - A uniquement.

b-A faible concentration les ISRS bloquent la recapture des autres neuromédiateurs

c-Les IRSNA ont une forte affinité pour récepteurs post synaptique $\rightarrow$ Effets indésirables faibles par rapport au ATC

d-Les ANASS sont des Antagonistes sur les récepteurs α_2 présynaptique

23/ Les antiparkinsoniens:

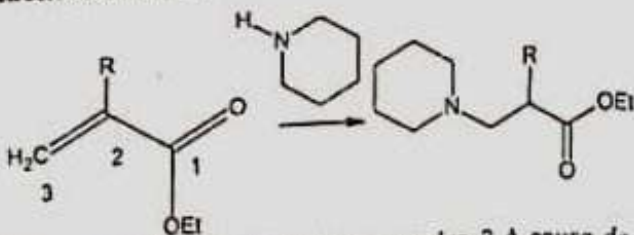
a-Les inhibiteurs de la DOPA-décarboxylase (DDC) permettent d'augmenter la disponibilité cérébrale de la dopamine en empêchant sa décarboxylation.

b-La dopamine est métabolisée par la COMT et la MAO pour donner l'acide homovanilique.

c-La sélegiline est un inhibiteur sélectif réversible de la MAO-A

d-Aucune de ces réponses n'est juste

24/ Dans la synthèse du Trihexyphényldyle la réaction suivante:



a-L'azote se fixe sur le carbone numéro 3 à cause de l'effet mésomère donneur du groupement ester.

b-Cette réaction est une addition électrophile.

c-Cette réaction est une réaction de Michael

d-La réaction suivante avec 2 PhMgBr donne un alcool secondaire.

25/ La cocaïne:

a-Est un benzoate de tropanol.

b-C'est une molécule dextrogyre

c-Comporte deux fonctions ester dans sa structure

d-Aucune de ces réponses n'est juste.

26/ Concernant les anesthésiques locaux, ces propositions sont justes sauf une laquelle?

a-L'est la forme ionisée à pH physiologique qui peut traverser la membrane cellulaire.

b-Ils bloquent les canaux sodiques à partir de la face interne de la membrane

c-Ils empêchent l'entrée des ions Na^+ à l'intérieur de la cellule nerveuse.

d-La liaison amide est plus stable que la liaison ester; expliquant la durée d'action plus longue des anesthésiques locaux à fonction amide.

27/ La metformine:

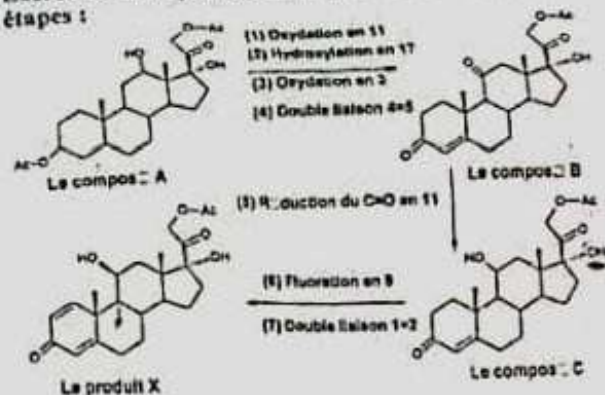
a-Sa synthèse commence par le cyanamide.

b-Est un insulinosécréteur

c-Risque de diminuer le taux de glycémie chez les sujets sains.

d-Agit au niveau du pancréas.

Exercice: La synthèse d'un produit X se fait en 7 étapes:



28/ Question 01:

a-Le composé A est l'acide désoxycholique (acide biliaire)

b-Le composé B est le cortisol.

c-Le composé C est un minéralocorticoïde

d-Le produit X est réservé à l'usage externe en raison de ses effets minéralocorticoïdes intenses.

29/ Question 02:

a-L'Oxydation en 11 se fait par l'action du OsO_4 .

b-L'hydroxylation en 17 passe par la réaction d'acétylation par l'acétate d'isopropényle

c-La création de la double liaison 4=5 se fait par une réaction d'oxydation.

d-Oxydation en 3 est une oxydation forte de l'alcool secondaire en cétone.

30/ Question 03:

a-La réduction du carbonyle en 11 est sélective et ne risque pas de réduire les carbonyles en 3 et 20,

b-Lors de la fluoration en 9 l'attaque du fluor se fait à l'arrière du plan.

c-La fluoration en 9 se fait en bétaméthasone.

d-Le produit X est la prédnisolone



Snow Drop
Active Now

Corrigé Type - Variante 1
Barème par question : 0,666667

N°	Rép.
1	B
2	A
3	B
4	C
5	C
6	C
7	B
8	B
9	C
10	C
11	B
12	D
13	A
14	D
15	B
16	A
17	B
18	A
19	D
20	C
21	D
22	D
23	B
24	C
25	C
26	A
27	A
28	D
29	B
30	B



Dr. GUEROU
Maître Assistant
En Chimie Thérapeutique



More



Edit