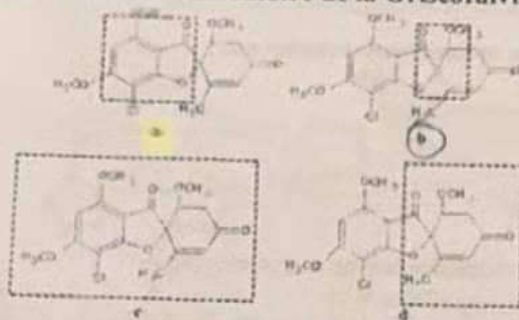
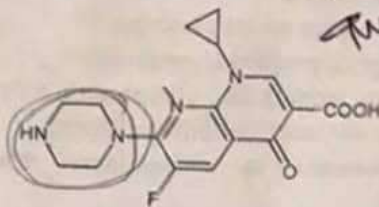


QCM Cochez la (les) bonne (s) réponse (s)

01/Quelle partie de la molécule est responsable de l'activité anti-inflammatoire de la Griséofulvine :



02/ Concernant l'activité de ce composé :



- A ☒ a-Il présente comme cible d'action la topoisomérase II.
☒ b-Le remplacement de l'atome de fluor par un chlore augmente l'activité.
☒ c-La méthylation de l'azote pipérazinique diminue la résistance bactérienne.
☒ d-Le remplacement de l'oxygène par un soufre est défavorable.

03/Les carbapénèmes diffèrent des pénèmes par :

- ☒ a-Une double liaison entre les carbones 2 et 3.
☒ b-Une substitution d'un atome de soufre par un carbone.
☒ c-Le remplacement de l'atome de soufre par un atome de carbone avec saturation de la liaison 2-3.
☒ d-Le remplacement du cycle thiazolidine par un cycle dihydrothiazine.

04/Parmi les propositions suivantes quelle (s) est (sont) celle (s) qui permet (tent) d'obtenir des pénicillines résistant aux β -lactamases et au milieu acide :

- ☒ 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'encombrement stérique provoqué par un reste alkyle ou aryle autour de la liaison amide.

05/La fixation d'un hydroxyle en méta du noyau benzénique de l'ampicilline permet :

- ☒ a-D'améliorer ses paramètres pharmacocinétiques.
☒ b-L'utilisation par voie injectable.
☒ c-D'augmenter l'encombrement stérique autour de la liaison amide.
☒ d-Aucune réponse n'est juste.

06/Concernant les relations structure-activité des phénicolés :

- ☒ a-La substitution sur le noyau aromatique peut se faire sur n'importe quelle position.
☒ b-La substitution d'un hydrogène par un méthylsulfonyl augmente l'activité.
☒ c-La substitution du groupe nitro par un méthylsulfonyl ne modifie pas l'activité.
☒ d-La substitution du groupe nitro par un méthylsulfonyl réduit la toxicité.

07/Parmi les propositions suivantes la(les)quelle (s) est (sont) juste (s) :

- ☒ a-Le pyrazinamide présente le même nuage électronique que le nicotinamide.
☒ b-L'éthambutol est obtenu à partir du (S)-2-aminobutan-1-ol.
☒ c-L'amoxicilline est un carbapénème.
☒ d-L'oxacilline est une pénicilline du groupe I.

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

On fait traiter la 4-méthylepyridine 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).

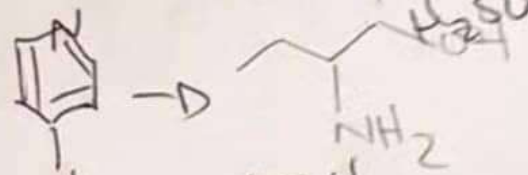
Le composé (B) réagit sur un réactif (C) pour donner le produit X.

08/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.

09/Le produit X est :

- ☒ a-L'éthambutol.
☒ b-La Griséofulvine.
☒ c-L'Hydrazide isonicotinique.
☒ d-Isoniazide.



10/ La minocycline :

- a-Possède un noyau naphtacène carboxamide.
- b-Possède un CH₃ en position 6. ☒
- c-Les cycles A et B sont en Cis. ☒
- d-Pour sa synthèse on part de la 6-diméthyltétracycline. ☒

11/ Développement des recherches des antipaludiques :

- a-La quinoléine est la première molécule utilisée comme antipaludique. ☒
- b-Les dérivés de l'acridine colorent en jaune les téguments. ☒
- c-La suppression du noyau qui porte le OCH₃ de la Mèpacrine donne la chloroquine.
- d-Le groupement OCH₃ est nécessaire à l'activité. ☒

12/ Quinololine :

- a-Le doublet de l'azote participe à la mésomérie du cycle. ☒
- b-La substitution nucléophile se fait sur le noyau pyridinique qui est pauvre en densité électronique. ☒
- c-Le procédé de Friedlander permet la préparation des quinoléines substituées. ☒
- d-Le procédé de Doebner Miller permet la préparation des quinoléines substituées. ☒

13/ La quinine :

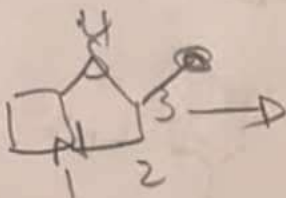
- a-Sa structure comporte un noyau 6-chloroquinoléique et un noyau quinuclidinique.
- b-Caractérisée par la stéréochimie des carbone 8 et 9 : Quinine 8R et 9R.
- c-Active la protéase qui dégrade la globine de l'Hb.
- d-Aucune de ces réponses n'est juste. ☒

14/ Au cours de la synthèse de la primaquine à partir de la 4-méthoxy-2-nitroaniline :

- a-Le noyau quinoléine substituée de la primaquine est préparé par réaction de skraup. ☒
- b-La réaction de skraup ne donne pas directement le noyau 8-aminoquinoléine.
- c-Le 1,4-dibromopentane doit être transformé en phthalimide avant sa fixation sur le noyau 8-aminoquinoléine.
- d-Aucune de ces réponses n'est juste.

15/ Dans la synthèse chimique des céphalosporines :

- a-Le principe est l'incorporation sur le noyau dihydrothiazine d'un méthyle en 2. ☒
- b-L'ester pénicilloïque est transformé en sulfoxyde.
- c-La réaction d'extension du cycle est réalisée à partir du sulfoxyde. ☒
- d-Le réarrangement du sulfoxyde en céphalosporine passe par un ion epi sulfonium selon la réaction de SKRAUP.

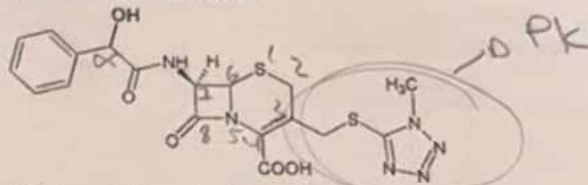


Page 2 sur 2

- a-La fonction acide carboxylique en 2 des céphalosporines permet la formation des « pro-drogues » par estérification. ☒
- b-Le radicale en position 3, conditionne la résistance aux bêta-lactamases.

- c-La modulation sur la chaîne latérale en position 7 conditionne l'activité antibactérienne.
- d-Aucune de ces réponses n'est juste.

17/ La molécule suivantes est :



- a-Une céphalosporine α -hydroxylée. ☒
- b-Une pénicilline V.
- c-Une céphalosporine de 2^{ème} génération.
- d-Une céphalosporine de 3^{ème} génération.

18/ Les macrolides

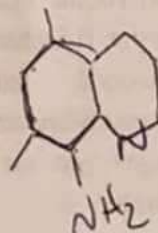
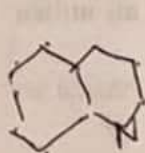
- a-Très actif sur les entérobactéries. ☒
- b-Sont des glycoprotéines lipophiles. ☒
- c-La fonction lactone est indispensable à l'activité. ☒
- d-Actifs sur les bactéries intracellulaires.

19/ Concernant le mécanisme d'action des macrolides

- a-Agissent sur la sous unité 50S du ribosome sur le site ☒
- b-Agissent sur la sous unité 30S du ribosome sur le site ☒
- c-Agissent sur la sous unité 30S du ribosome sur le site ☒
- d>Bloquent l'activité de la peptidyl-transférase. ☒

20/ Les tétracyclines :

- a-Un groupe d'antibiotiques à large spectre.
- b-Leurs complexes avec les divers cations di et tri-valents sont inactifs. ☒
- c-La fixation sur la sous unité 30S du ribosome empêchant l'interaction codon-anticodon. ☒
- d-La substitution sur le groupe carboxamide en 2 réduit à 90% l'activité.



Bon Courage.

Cochez la (les) bonne (s) réponse (s)

1/ Le test de Codex (FeCl_3) permet de chercher la présence d'un :

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

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 ?

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

- 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.

6/ La préparation de la protéine lors du docking moléculaire nécessite :

- a- D'ajouter les hydrogènes non polaires.
- ☒ b- D'éliminer les molécules d'eau.
- c- D'ajouter les charges de type "gasteiger".
- ☒ d- D'enregistrer le fichier en format pdbqt.

7/ Le docking moléculaire nous permet de prédire :

- a- Les meilleures conformations de la protéine.
- ☒ b- L'énergie libre du complexe protéine-ligand.
- c- Le type d'interaction d'une molécule chimique.
- d- Aucune réponse n'est juste.

8/ Parmi les proposition (s) suivante (s) laquelle (lesquelles) est (sont) fausse (s) :

- a- Le fichier texte avec l'extension glg contient les calculs d'affinité entre les différents types d'atomes de la protéine (C, H, O, N et S) et le ligand.
- b- Le fichier texte avec l'extension dlq fournit les meilleures positions de chaque ligand simulé dans le site actif de la cible.
- c- Le fichier texte avec l'extension dpf nous permet de pouvoir lancer les calculs de docking moléculaire.
- ☒ d- Aucune réponse n'est juste.

Exercice 01 :

Dans le but de synthétiser 2 g de paracétamol pure, on a calculé les quantités de matières premières nécessaires pour synthétiser théoriquement 4 g, et on a effectué deux étapes :

Etape 01 : La réaction chimique de synthèse :

Les quantités calculées théoriquement pour la synthèse de 4 g de paracétamol :

- X g de para-aminophénol
- 10mL d'une solution d'acide acétique à 2mol.L⁻¹.
- 4.5 mL d'anhydride acétique (en excès)

A la fin de la synthèse on a trouvé 3.5 g de produit brute.

Etape 02 : La purification

On a fait une recristallisation dans l'eau.

le produit pure final est : 2.8 g.

Donnés : $M(\text{paracétamol}) = 151,2 \text{ g/mol}$, $M(4\text{-aminophénol}) = 109,2 \text{ g/mol}$, $M(\text{acide acétique}) = 60,1 \text{ g/mol}$, $M(\text{anhydride}) = 102,9 \text{ g/mol}$, $d(\text{anhydride}) = 1,08$, $\rho_{\text{eau}} = 1 \text{ g/mL}$.

9/ la quantité X égale :

- a- X = 2.88 g
- b- X = 3.66 g
- c- X = 5.54 g

$$\frac{2.8}{60} = 0.0467$$

d-X= 1.80 g

10/ Le rendement de notre synthèse:

a-87.50%

b-70.00%

c-80.00%

d-60.50%

11/ Le choix du solvant pour la recristallisation est fait de tel sorte que :

a-Notre produit est soluble dans le solvant à chaud et insoluble à froid et les impuretés sont solubles à chaud et à froid. ☒

b-Notre produit est insoluble dans le solvant à chaud et soluble à froid et les impuretés sont solubles à chaud et à froid. ☐

c-Notre produit est soluble dans le solvant à chaud et insoluble à froid et les impuretés sont insolubles à chaud et à froid. ☒

d-Notre produit est insoluble dans le solvant à chaud et insoluble à froid et les impuretés sont solubles à chaud et à froid. ☐

12/ A propos de la réaction de synthèse :

a-C'est une réaction d'amidification. ☒

b-On peut utiliser l'acide sulfurique comme catalyseur sans problème. ☒

c-L'azote dans le groupe amine a un caractère nucléophile. ☒

d-Le groupe -OH est plus nucléophile que le groupe -NH₂. ☒

13/ Filtration sous vide :

a-Est une technique de séparation solide-liquide. ☒

b-Est plus efficace que la filtration classique. ☒

c-La pression dans la fiole à vide est inférieure à la pression atmosphérique. ☒

d-La trompe à eau est utilisée comme source d'eau. ☒

Exercice 02 :

Après une étude de 4 composés synthétisés dans le but de trouver un nouveau anticancéreux inhibiteur d'une enzyme Tyrosine Kinase, capable d'être administré par voie orale, on a trouvé les résultats suivant :

Composé	Energie de liaison	Cluster RMSD	Liaison hydrogène au récepteur	Absorption gastro intestinale	Toxicité
Composé de Référence	-10.2	0.00	2	Oui	Non
Composé 1	-13.9	0.00	3	Non	Cardiaque
Composé 2	-8.7	0.08	1	Oui	Non
Composé 3	-11.3	0.06	2	Non	Mutagène
Composé 4	-13.2	0.00	2	Oui	Non

14/ Parmi les données suivants lesquelles sont issues du docking moléculaire par AUTODOCK :

a-Energie de liaison. ☒

b-Cluster RMSD. ☒

c-Absorption gastro intestinale ☒

d-Nombre de Liaisons hydrogène au récepteur. ☒

15/ Si on ignore l'analyse qualitative des interactions avec le récepteur ; Quel est le composé de choix parmi les 4 composés testé:

a-Composé 1

b-Composé 2

c-Composé 3

d-Composé 4 ☒

+Stable
- énergique

Bon courage.

ResiPharmaTM



Département de Pharmacie - EMD3 - de chimie
thérapeutique - 3^{ème} année

Date de l'épreuve : 25/05/2022

Page 1/1

Corrigé Type

15 question(s) retirée(s) - Barème par question : 0,57

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



Département de Pharmacie - EMD3 - de chimie
thérapeutique - 3^{ème} année

Date de l'épreuve : 25/05/2022

Page 1/1

Corrigé Type - Variante 1

15 question(s) retirée(s) - Barème par question : 1,00000000 (au lieu de 0,57)

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



Département de Pharmacie - Contrôle de TP - de chimie
thérapeutique - 3^{ème} année

Date de l'épreuve : 25/05/2022

Page 1/1

Corrigé Type - Variante 1

20 question(s) retirée(s) - Barème par question : 1,33333333 (au lieu de 0,57)

N°	Rép.
1	X
2	X
3	X
4	X
5	X
6	X
7	X
8	X
9	X
10	X
11	X
12	X
13	X
14	X
15	X
16	X
17	X
18	X
19	X
20	X
21	CD
22	D
23	BC
24	A
25	A
26	BD
27	BC
28	D
29	A
30	B
31	A
32	AC
33	ABC
34	ABC
35	D

Dr. GUEROUA W
Maître Assistant PUJ
En Chimie Thérapeutique

ResiPharmaTM