

Cochez-la (les) bonne (s) réponse (s)

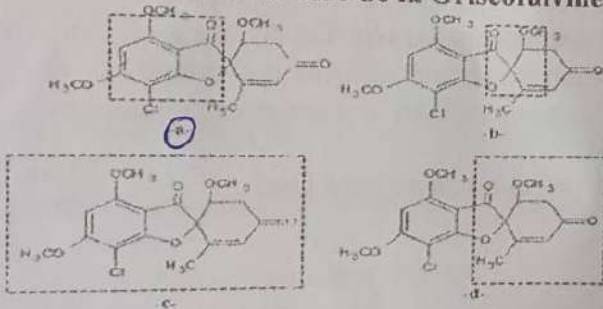
01/Concernant la relation structure activité des phénicolés :

- a-La substitution du noyau benzénique par des noyaux isostères supprime l'activité. ✗
- b-La substitution du groupement dichloroacétyle par un méthyle diminue l'activité à 60%. ✗
- c-La substitution du groupe nitro par un méthylsulfonyl augmente l'activité. ✓
- d-La substitution du groupe nitro par un méthylsulfonyl réduit la toxicité. ✓

02/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. ✓

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



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.

04/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. ✓

05/Le produit X est :

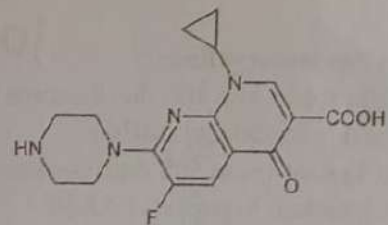
- a-L'éthambutol. ✗
- b-La Griséofulvine. ✗
- c-L'Hydrazide isonicotinique. ✓

d-L'isoniazide. ✗

06/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. ✓

07/Concernant l'activité de ce composé :



- 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. ✓

08/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 pyridine-2-carboxamide. ✗
- c-Préparé à partir de la 4-méthylpyridine. ✗
- d-Est un dérivé de l'acide isonicotinique. ✓

09/ Parmi ces réactions laquelle (lesquelles) est (sont) utilisé (s) dans la synthèse du miconazole :

- a-Oxydation ✗
- b-Amination ✗
- c-Ethérification ✗
- d-Amidification ✓

10/Concernant les quinolones :

- a-L'atome d'azote du noyau doit être libre. ✓
- b-Le noyau B doit être aromatique. ✗
- c-Elle présentent un polymorphisme. ✗
- d-Peuvent se comporter comme base en présence d'acide. ✗

11/Céphalosporines

- a-Le noyau 2-céphème est inactif
- b-Céphalosporine C est un ester de l'acide δ -aminoadipique et l'acide 7-aminocéphalosporanique
- c-La céphalosporine C est inactive par voie orale
- d-Les céphalosporines de deuxième génération sont résistantes aux céphalosporinases

12/A propos de la synthèse des céphalosporines à partir de la pénicilline

- a-Le principe est l'incorporation sur le noyau thiazolidinyle d'un méthyle en 2
- b-La réaction d'extension du cycle est réalisée à partir de l'époxyde.
- c-Le réarrangement de l'époxyde en céphalosporine passe par un ion épi sulfonium selon la réaction de SKRAUP
- d-Un traitement par la diéthylamine conduit à la désacétoxycephalosporine par une réaction d'élimination.

13/Mode d'action des tétracyclines :

- a-Leur fixation sur la sous unité 30S du ribosome bloquent la fixation des aminoacyl-ARN-t
- b-Leur fixation sur la sous unité 50S du ribosome empêchent la translocation du peptidyl-ARNt
- c-Leur fixation sur la sous unité 30S du ribosome bloquent l'activité de la peptidyl-transférase
- d-Leur fixation sur la sous unité 50S du ribosome empêchant l'interaction codon-anticodon

14/L'hémisynthèse de la minocycline

- a-On part de 6-diméthyltétracycline
- b-La première étape est une réaction d'amination réductrice.
- c-Le produit final possède deux CH_3 en position 6
- d-Aucune de ces réponses n'est juste

15/Les macrolides

- a-Ce sont des antibiotiques à spectre étroit.
- b>Comportent dans leurs structures des liaisons osidiques avec divers oses
- c>Ils sont bactéricides à faibles concentrations
- d>Aucune de ces réponses n'est juste

16/Les macrolides :

- a>Spiramycine A est le produit utilisé en thérapeutique
- b>Azithromycine est un macrolide à cycle à 14 atomes
- c>Clarithromycine possède un méthoxy en position 7
- d>Josamycine est le 10 hydroxy- spiramycine

17/Les propriétés chimiques de la quinoléine :

- a>La substitution nucléophile se fait sur le noyau pyridinique qui est pauvre en densité électronique
- b>La chloration par un mécanisme de substitution électrophile peut se faire en position 7 du noyau quinoléine.

c-Le doublet de l'azote participe à la mésomérie du cycle.

d>L'oxydation de la quinoléine donne l'acide quinoléique qui peut facilement être décarboxylé en acide nicotinique

18/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.

19/La chloroquine

- a>Au cours de sa synthèse le noyau quinoléique est synthétisé par la réaction de skraup
- b>Le chlore en position 7 sur le noyau quinoléine donne une meilleure activité antiparasitaire
- c>Inhibe la détoxification de l'hème issue de la dégradation de l'hémoglobine.
- d>La résistance est due à la dégradation enzymatique par la chloroquinase.

20/La primaquine :

- a>Est un dérivé de la 4-aminoquinoléine
- b>Au cours de sa synthèse le noyau quinoléine substituée est préparé par réaction de skraup
- c>Le 1,4-dibromopentane doit être transformé en phthalimide avant sa fixation sur le noyau quinoléine substituée.
- d>Aucune de ces réponses n'est juste

ResiPharmaTM

BON COURAGE

Date de l'épreuve : 24/05/2023

N°	Rép.
1	AD
2	D
3	A
4	BD
5	CD
6	AD
7	AD
8	A
9	BC
10	BD
11	ACD
12	AD
13	A
14	D
15	AB
16	C
17	AD
18	AB
19	BC
20	BC

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

Cochez-la (les) bonne (s) réponse (s)

01/ 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- Vérifier s'il y a des atomes manquants ✓

02/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.

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

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

04/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 d'augmenter la solubilité de la phénytoïne dans le solvant.
- ☒ c- Il s'agit d'un phénomène de relargage.
- d- Il s'agit d'un phénomène de recristallisation. ✓

05/ Si pour 2 g 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- 2,34 gr.
- ☒ d- 1,17 gr.

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

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

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

- a- L'aspirine est très soluble dans l'eau.
- b- On utilise le banc kofler directement après son allumage.
- c- Le paracétamol donne en présence du réactif Mac Nally une couleur rose.
- ☒ d- Le point de fusion du paracétamol est 125°C .

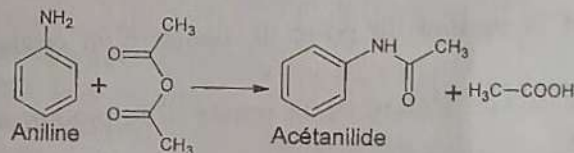
Exercice :

Dans un ballon rodé propre et sec, introduire lentement 7,0 mL d'acide acétique (solvant), 7,0 mL d'anhydride acétique, 5,0 mL d'aniline. Chauffer à reflux pendant 15 min.

Cristalliser le produit final par ajout de l'eau froide puis filtrer.

Purifier par recristallisation dans l'eau puis filtrer le produit pur.

On mesure la masse d'acétanilide obtenu, la balance indique 5,79 g



Produit s	Anilin e	Acide acétiqu e	Anhydrid e acétique	Acétanilid e
Masse molaire	93 g/mol	60 g/mol	102 g/mol	135 g/mol
Densité	1,02	1,05	1,08	Solide

08/ Type de réaction :

- a- C'est une réaction d'amidification
- b- C'est une réaction d'estérification
- c- C'est une réaction d'acétylation
- d- Aucune de ces réponses n'est juste.

09/ Le mécanisme réactionnel est le même que celui de la synthèse de :

- ☒ a- Aspirine
- b- Phénytoïne
- c- Paracétamol
- d- Il est différent.

10/ Le réactif limitant est :

- ☒ a-Aniline ✓
- b-Acide acétique
- c-Anhydride acétique
- d-Le mélange est stœchiométrique

11/ Le rendement de la réaction

- a-78 %
- b-58 %
- c-38 %
- d-Aucune de ces réponses n'est juste.

12/ Parmi les critères suivants quel sont les critères d'identification d'un produit de synthèse :

- a-Solubilité
- b-Température de fusion
- c-Le rendement de la réaction
- d-La masse théorique

13/ 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 soluble à froid.

14/Le bank kofler :

☒ a-Permet la mesure du point de fusion d'un produit solide

b-Permet la vérification de la pureté d'un produit de synthèse

c-On place premièrement les cristaux sur le côté le plus chaud ✗

d-Aucune de ces réponses n'est juste.

15/ AUTODOCK nous permet de calculer :

a-L'hydrosolubilité.

☒ b-Energie de liaison ✓

☒ c-Taux de fixation aux protéines plasmatiques

d-Le nombre de liaison hydrogène formées avec le récepteur.



BON COURAGE

Département de thé

Date de l'épreuve : 24/05/2023

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

ResiPharmaTM

Date d

N°

1

2

3

4

5

6

7

8

9

10

11

12

13

14

15

16

17

18

19

20

21

22

23

24

25

26

27

28

29

30