

Choisissez la bonne réponse

1/ Quel est le rôle chimique du groupement amine dans les anesthésiques locaux ?

- a- Augmenter la lipophilie
- b- Favoriser l'hydrolyse rapide
- c- Jouer un rôle dans l'ionisation et la solubilité
- d- Inhiber les enzymes de dégradation

2/ Concernant les β -bloquants et leur interaction avec les récepteurs adrénergiques, quelle affirmation est correcte ?

- a- Le groupement hydroxyle (-OH) interagit par liaison ionique avec le récepteur.
- b- Le groupement aryle (phényle) interagit via des liaisons hydrogène.
- c- Le groupement amide ou éther influence la β 1-sélectivité.
- d- L'isopropyle favorise la β 1-sélectivité sur les récepteurs.

3/ Laquelle des affirmations suivantes à propos des phénylalkylamines est fausse ?

- a- Les deux cycles aromatiques sont indispensables pour l'activité.
- b- Les composés R sont généralement plus actifs que les composés S.
- c- L'amine tertiaire est optimale pour l'activité.
- d- Le remplacement du groupe méthyle sur l'azote par un groupement encombrant diminue l'activité.

4/ Concernant la lidocaïne, laquelle de ces affirmations est correcte ?

- a- Elle appartient à la famille des amino-alcools.
- b- Elle est issue de la 2,5-diméthylaniline.
- c- Sa résistance aux hydrolases est due à l'encombrement stérique causé par ses deux groupes méthyles.
- d- Sa durée d'action est plus courte que celle de la rocaïne.

5/ Concernant l'indométacine, quelle affirmation est exacte ?

- a- Elle dérive de l'acide arachidonique.
- b- C'est un inhibiteur de la cyclo-oxygénase avec une inhibition plus marquée sur COX-1.
- c- Son action inhibitrice cible préférentiellement COX2.
- d- Elle appartient à la famille des indolidiones.

6/ Quelle affirmation est exacte concernant la relation structure-activité de la morphine ?

- a- L'azote du noyau pépéridine se lie au récepteur par une interaction de type hydrophobe.
- b- La transformation du groupement hydroxyle en position 3 renforce l'effet analgésique.
- c- L'élimination de la double liaison entre les carbones 7 et 8 maintient l'activité analgésique.
- d- La structure aromatique n'est pas requise pour l'interaction avec le récepteur.

7/ À propos des antidiabétiques oraux, quelle affirmation est correcte ?

- a- Les biguanides agissent en augmentant la libération d'insuline.
- b- Les inhibiteurs de l'aldose réductase sont utilisés pour contrôler la glycémie après les repas.
- c- Les inhibiteurs de l'alpha-glucosidase accélèrent la transformation du glucose en sorbitol.
- d- Aucune de ces affirmations n'est exacte.

8/ Quelle est la molécule de départ utilisée pour la synthèse du chlórdiazépoxide (Librium) ?

- a- 2-amino-5-chlorobenzophénone
- b- Benzaldéhyde
- c- Acide pipérique
- d- Acétophénone

9/ Quelle fonction chimique est présente dans la structure finale du chlórdiazépoxide (Librium) ?

- a- Amide
- b- Époxyde
- c- Cétone
- d- Ester

10/ Quel est l'effet principal des benzodiazépines sur la neurotransmission ?

- a- Elles bloquent la libération du GABA.
- b- Elles inhibent l'entrée des ions chlorure (Cl^-) dans le neurone post-synaptique.
- c- Elles augmentent l'effet inhibiteur du GABA en facilitant l'entrée des ions chlorure (Cl^-).
- d- Elles excitent directement le neurone post-synaptique.

11/ Quelle modification structurale est essentielle pour l'activité anxiolytique des benzodiazépines ?

- a- La présence d'un noyau quinoléine
- b- Un cycle diazépine fusionné avec un noyau benzénique
- c- Un groupement hydroxyle en position 1 du cycle diazépine
- d- Un groupement méthyle en position 5 du cycle diazépine

14) Quel effet ont les substituants électro-attractifs en position 1 ?

14/ Quel effet ont les substituants en position 2 du noyau phénothiazinique sur l'activité ? Associez pour le dosage l'effet à la position ?

a) Un groupement hydroxyle (10%)

b) Un atome de fluor (10%)

c) Un groupement hydroxyle (10%)

d) Un atome de fluor (10%)

15) Quelle modification structurelle des phénothiazines augmente leur lipophilie et accélère leur passage à travers la barrière hémato-encéphalique ?

a) L'ajout de groupements éthers en position 5

b) La saturation du cycle indole

c) L'ajout d'un atome de fluor en position 2

d) La saturation d'un atome d'oxygène par un atome de soufre en position 2

16) Quelle étape de la synthèse des phénothiazines est la plus sensible pour modifier leur activité pharmacologique ?

a) L'ajout d'un groupement hydroxyle sur le cycle phénothiazinique

b) La saturation du cycle par un atome d'oxygène

c) La nature et la structure de la chaîne greffée en position 10

d) L'oxydation du noyau phénothiazinique en sulfone

17) Quel facteur favorise la transposition de Smiles ?

a) La présence d'un groupement électro-attracteur sur l'aryle migrant

b) Une forte acidité du milieu réactionnel

c) L'absence de toute base dans le milieu réactionnel

d) Une température inférieure à 0°C

18) Quel facteur influence le plus la biodisponibilité des dérivés hydantoïnes ?

a) La saturation complète du cycle hydantoïne

b) La présence d'un groupement hydroxyle en position 5

c) La nature du substituant en position N3

d) L'absence totale de substituants sur le cycle

19) Quel impact aurait la transformation de la fonction carbonamide ($-C(=O)N-$) en une fonction ester ($-C(=O)O-$) sur l'activité pharmacologique de la carbamazépine ?

a) Une augmentation de la stabilité métabolique et de l'affinité pour les canaux sodiques

b) Une réduction de la solubilité aqueuse et une possible diminution de l'activité

c) Une meilleure interaction avec les récepteurs du GABA A

GABA A

20) Que signifie la conversion en un pro-drug et en effet pharmacologique ?

20/ Quel impact a le remplacement de l'atome de soufre du noyau phénothiazinique par une liaison -C-C- dans les phénothiazines comme la carbamazépine et l'aprimémine ?

a) Une modification de la distribution électronique affectant l'affinité pour les récepteurs

b) Une perte totale d'activité pharmacologique

c) Une augmentation de la polarité du noyau

d) Une conversion en isomère tautomère sans modification d'activité

21) Pourquoi la levodopa est-elle administrée en association avec un inhibiteur de la décarboxylase périphérique ?

a) Pour empêcher sa dégradation dans le foie et prolonger son effet

b) Pour réduire la conversion périphérique en dopamine et limiter les effets indésirables

c) Pour faciliter son passage à travers la barrière hémato-encéphalique

d) Pour augmenter directement la production de dopamine dans le cerveau

22) Pourquoi l'alkylation de Friedel-Crafts conduit-elle souvent à une polyalkylation, alors que l'acylation ne présente pas cet inconvénient ?

a) Parce que le carbocation formé lors de l'alkylation active davantage le noyau aromatique par effet inductif

b) Parce que l'ion acylium formé dans l'acylation est plus stable et désactive le noyau par effet mésomère attracteur

c) Parce que l'alkylation génère un intermédiaire radicalaire qui favorise plusieurs substitutions

d) Parce que l'acylation nécessite un excès de catalyseur pour se dérouler efficacement

23) Quelle modification structurelle favorise sélectivement l'activation des récepteurs β_2 adrénergiques par rapport aux récepteurs α_1 ?

a) L'introduction de groupes hydroxyles en position 3 et 4 du noyau aromatique

b) L'augmentation de l'encombrement stérique autour de l'azote du groupe aminé

c) La réduction du nombre de carbones séparant l'azote du cycle aromatique

d) L'ajout d'un atome de fluor sur le cycle benzénique

24) Quel est un des critères essentiels pour qu'une molécule ait une activité parasympatholytique ?

a) La présence obligatoire d'un atome de soufre

b) Une absence totale de fonction amine



Département de pharmacie - EMD1 de ch-thérapeutique- 3ème année

Date de l'épreuve : 09/04/2025

Page 1/1

Corrigé Type - Variante 1

Barème par question : 0,666667

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

Dr. Guerini



Corrigé Type - Variante 2

Barème par question : 0,666667

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

Dr. Guermi

