

DM n°1 : Chimie thérapeutique

Tutorat 2024-2025 : 20 QCMS – Durée : 20min



QCM 1 : A propos de la chimie thérapeutique, quelle(s) est (sont) la (les) réponses exacte(s) :

- A) C'est un domaine uni-disciplinaire étudiant la conception et la synthèse de molécule à visée thérapeutique
- B) Elle nécessite uniquement des connaissances en pharmacologie
- C) Le médicament perturbe l'équilibre biologique interne en agissant sur des facteurs externes et génétiques
- D) Les étapes d'optimisation et de découverte de la molécule active sont concomitantes
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 2 : A propos de la chimie thérapeutique, quelle(s) est (sont) la (les) réponses exacte(s) :

- A) Une cible thérapeutique peut être une protéine
- B) Pour identifier la cible il faut : une quantification de la modulation de l'activité de la cible, que la cible ait la capacité de se lier à une petite molécule, qu'elle soit « drugable » (liste exhaustive)
- C) L'objectif de l'étude des interactions entre la molécule et sa cible est de créer des interactions plus sélectives vis-à-vis des différentes cibles
- D) Les enzymes sont les catalyseurs de la vie
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 3 : A propos des récepteurs en chimie thérapeutique, quelle(s) est (sont) la (les) réponses exacte(s) :

- A) Les récepteurs membranaires se situent dans les zones très hydrophiles de la membrane
- B) Les récepteurs endoplasmiques se situent dans le cytoplasme, donc plutôt dans des zones hydrophobes
- C) Leur caractérisation repose sur une étude in vivo et in vitro (exhaustif)
- D) Dans l'interaction ligand-récepteur, on a dans l'ordre : Reconnaissance, Amplification, Transduction, puis modulation de l'activité
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 4 : A propos des ligands en chimie thérapeutique, quelle(s) est (sont) leur(s) caractéristique(s) ?

- A) L'affinité du ligand qui correspond aux agonistes, antagonistes ou mixtes
- B) L'activité intrinsèque qui correspond à l'activité pharmacologique mesurée directement sur la cible
- C) L'activité extrinsèque qui correspond à l'activité pharmacologique sur les autres cibles de l'organismes
- D) L'activité thérapeutique qui est la résultante de toutes les interactions avec les différentes cibles de l'organisme
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 5 : L'activité intrinsèque d'un ligand est due à ses propriétés :

- A) Géométriques
- B) Electroniques
- C) Thermiques
- D) Physico-chimiques
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 6 : A propos des acides aminés et des protéines, indiquez la(les) proposition(s) exacte(s) :

- A) La liaison peptidique est une liaison faible
- B) Les acides aminés essentiels sont synthétisés par notre organisme
- C) Alanine, asparagine, thréonine et phénylalanine sont des acides aminés essentiels
- D) Un acide aminé est caractérisé par quatre atomes de carbone, chacun portant un groupement différents (NH₂, H, R, COOH)
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 7 : A propos de la liaison peptidique, indiquez la(les) proposition(s) exacte(s) :

- A) C'est une fonction amine primaire
- B) Elle se met en place entre deux AA au niveau de la fonction carboxylique d'un AA et la fonction amide d'un autre AA
- C) Grace aux liaisons CONH qui permettent l'enchaînement des acides aminés, on obtient la structure primaire de la protéine
- D) La liaison dipolaire est caractéristique de la structure secondaire de la protéine
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 8 : A propos des protéines, indiquez la(les) proposition(s) exacte(s) :

- A) L'hélice alpha et le feuillet bêta sont caractéristiques de la structure tertiaire de la protéine
- B) Dans l'hélice α , les chaînes latérales pointent en dehors et perpendiculairement à l'axe de l'hélice
- C) Dans le feuillet β , il y a superposition de deux chaînes protéiques parallèles, avec les carbones alpha qui se trouvent aux extrémités du feuillet
- D) La liaison hydrogène se met en place entre un accepteur (fonction amine NH) et un donneur (doublets non liants de l'oxygène de la fonction carbonyle CO)
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 9 : Les interactions entre le ligand et la cible protéique dépendent :

- A) Des liaisons faibles électroniques
- B) De la nature des fonctions du ligand et de la cible
- C) De leur conformation spatiale
- D) De la complémentarité entre le ligand et la cible
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 10 : Quelle(s) est (sont) la (les) réponses fausse(s) a propos de la cystéine :

- A) Elle a un pKa de 8,4 avec une fonction thioéther
- B) Elle peut faire les liaisons suivantes : liaisons hydrogènes, des liaisons ioniques, des liaisons dipolaires et des ponts disulfures
- C) C'est un acide aminé essentiel
- D) Si le ligand est accepteur de liaison hydrogène, l'interaction est favorisée du côté gauche- ou gauche+
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 11 : Quelle(s) est (sont) la (les) réponses exacte(s) à propos de la lysine :

- A) Elle s'ionise a pH physiologique (Pka=6,1) en ion ammonium
- B) C'est une base chargée négativement grâce à sa fonction NH₂ qui interagit avec un ligand chargé positivement
- C) Elle peut faire des liaisons ioniques qui sont des liaisons fortes et des liaisons dipolaires
- D) Le coté syn est favorisé dans la stéréochimie de liaison ionique pour la lysine
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QRU 12 : Quelle quantité d'énergie est mise en jeu lorsque se forme une liaison hydrophobe ?

- A) 100 à 200 kcal.mmol⁻¹
- B) 0,5 kcal.mmol⁻¹
- C) 1 à 10 kcal.mmol⁻¹
- D) 0,5 à 7 kcal.mmol⁻¹
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 13 : A propos de la « découverte de la molécule active », quelle(s) est (sont) la (les) réponse(s) exacte(s) :

- A) La molécule tête de série ou « Hot », est la première molécule que l'on découvre, qui sert de point de départ à la conception du médicament
- B) La molécule tête de série possède l'activité pharmacologique recherchée, elle est donc directement qualifiée de candidat médicament
- C) Le hasard n'est pas une source de découverte
- D) Il est inimaginable d'utiliser un médicament déjà mis sur le marché pour développer une nouvelle molécule en exploitant une indication médicale ou un effet indésirable dans un autre contexte
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 14 : A propos de la « découverte de la molécule active » et du criblage , quelle(s) est (sont) la (les) réponse(s) exacte(s) :

- A) Il permet de tester un grand nombre de structures chimiques pour les trier en fonction de leur intérêt thérapeutique
- B) Les substances criblées proviennent uniquement de substances d'origine naturelle : végétales, microbiologiques, marines ou animales
- C) Le paclitaxel, un anti-cancéreux, a été développé à partir de l'écorce de l'If grâce au criblage
- D) C'est une technique très peu couteuse et très efficace c'est pourquoi c'est la technique utilisée actuellement
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 15 : A propos de la « découverte de la molécule active », quelle(s) est (sont) la (les) réponse(s) exacte(s) :

- A) L'ethnopharmacologie et l'étude des pratiques médicales des civilisations anciennes a permis de découvrir 2000 substances utilisées dans le traitement du paludisme
- B) A partir des 2000 substances, on a trouvé l'Artémisia annua, à partir de laquelle on a isolé l'artémisinine (antipaludique)
- C) Si la structure 3D de la cible protéique est inconnue, il est possible de réaliser un Docking à partir de la structure 3D d'une protéine analogue ayant une homologie de séquence supérieure à 99%
- D) Si la structure 3D de la protéine ciblée a été déterminée on réalise tout de même un Matching
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 16 : A propos de « l'isolement et la purification d'une molécule tête de série », quelles sont la (les) réponse(s) exacte(s) :

- A) C'est une étape facultative
- B) La technique de choix utilisée est la chromatographie
- C) La structure et la qualité du composé influent sur la facilité d'isolement et de purification
- D) La stabilité et la température influent sur la facilité d'isolement et de purification
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 17 : A propos de « l'établissement de la structure d'un composé », quelle(s) est (sont) la (les) réponse(s) exacte(s) :

- A) La cristallographie par diffraction aux rayons X est une technique très précise, mais nécessite une forme cristalline et une petite quantité de produit
- B) La spectroscopie par RMN nécessite, quant à elle, une grande quantité de produit
- C) La spectroscopie de masse nécessite des quantités astronomiques de produit
- D) La synthèse totale va comparer les propriétés physico-chimiques de la molécule obtenue avec celles de la molécule originale
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 18 : A propos de l'optimisation de la molécule, quelle(s) est (sont) l'(les)objectif(s) de cette étape :

- A) Augmenter l'activité pharmacologique sur la cible étudiée
- B) Minimiser les effets secondaires indésirables en maximisant les interactions avec d'autres cibles de l'organisme
- C) Améliorer les propriétés pharmacocinétiques et diminuer la toxicité
- D) Définir les pharmacophores (ce sont les groupements qui interagissent avec la cible et qui sont responsables de son activité pharmacologique uniquement)
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 19 : Les relations structure-activité (RSA) qui relient la notion de pharmacophores à l'activité intrinsèque sont :

- A) La nature des fonctions chimiques
- B) Les chaînes (aliphatiques) et/ou cycles
- C) La balance hydrophilie / hydrophobie
- D) Les liaisons faibles électrostatiques
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses

QCM 20 : Les relations structure-activité (RSA) qui relient la notion de pharmacophore aux propriétés pharmacocinétiques sont :

- A) La répartition électronique
- B) L'acidobasicité et l'amphotarité
- C) De nature physico-chimiques
- D) La géométrie et position par rapport à d'autres groupements fonctionnels
- E) Les propositions A, B, C et D sont fausses