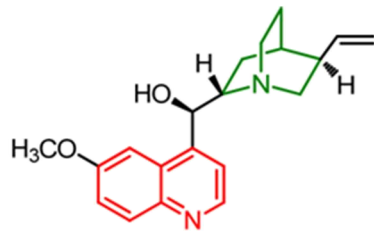


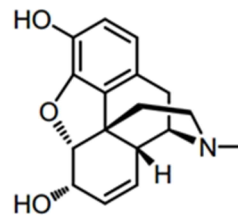
Paris 12
ECUE SANTE 2

**SEANCE N°1 : SOURCES ACTUELLES ET
FUTURES DES PRINCIPES ACTIFS**
(Fiches de cours correspondantes : 1, 2 et 3)

QCM 1 : Principes actifs d'origine naturelle



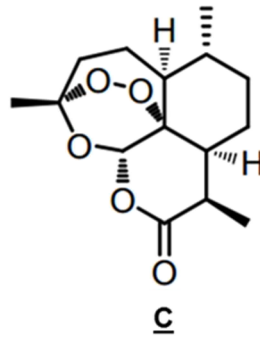
Y



Z

- A. Les molécules Y et Z sont des alcaloïdes isolés à partir d'opium provenant du pavot somnifère
- B. La codéine peut être produite par hémisynthèse à partir de la molécule Z
- C. La molécule Z est un antalgique
- D. La molécule Y possède un noyau quinuclidine et un noyau quinoléine
- E. A pH fortement basique (pH =12), les deux fonctions amines de la molécule Y sont déprotonées

QCM 2 : Molécules d'origine naturelle



C

- A. La molécule C est un diterpène
- B. La molécule C est un antitumoral
- C. La molécule C est extraite de l'armoise annuelle par une première extraction liquide-liquide
- D. La molécule C peut être obtenue par hémisynthèse à partir de l'acide artémisinique, lui-même obtenu par génie génétique
- E. L'hémisynthèse est toujours préférée à l'extraction pour obtenir des principes actifs naturels

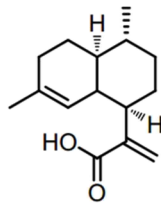
QCM 3 : Principe actif d'origine naturelle

- A. La cyclosporine est un peptide comme l'insuline
- B. La cyclosporine est un antibiotique
- C. La cyclosporine est isolée à partir d'un champignon macroscopique
- D. L'insuline est naturellement produite par le pancréas et est hypoglycémiant
- E. Un polypeptide contient entre 11 et 100 acides aminés

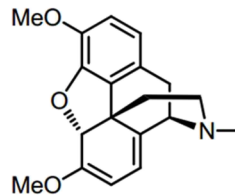
QCM 4 : Les drogues végétales

- A. Une drogue végétale est un composé stupéfiant
- B. La plante entière de drosera est une drogue végétale aux propriétés antitussives
- C. Les parties souterraines de la rhubarbe des jardins est une drogue végétale aux propriétés laxatives.
- D. La gomme arabique est un exsudat formé d'un polysaccharide, possédant des propriétés gélifiantes
- E. L'écorce de bourdaine est une drogue végétale aux propriétés anti-inflammatoires et anti-échymoses

QCM 5: Matières premières



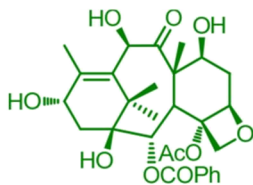
A



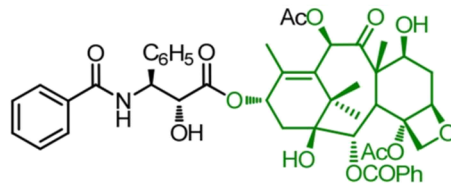
B

- A. La molécule **A** peut être produite par fermentation d'un microorganisme génétiquement modifiée et isolée par une extraction liquide-liquide
- B. La molécule **B** est un terpène
- C. La molécule **B** est la morphine, alcaloïde majoritaire contenu dans l'opium
- D. L'hémisynthèse peut être réalisée à partir d'une matière première qui n'est pas utilisée en thérapeutique
- E. Seuls des principes actifs sont produits par hémisynthèse

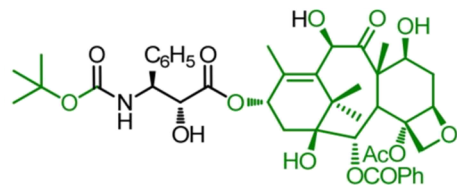
QCM 6 : Principes actifs d'origine naturelle



C



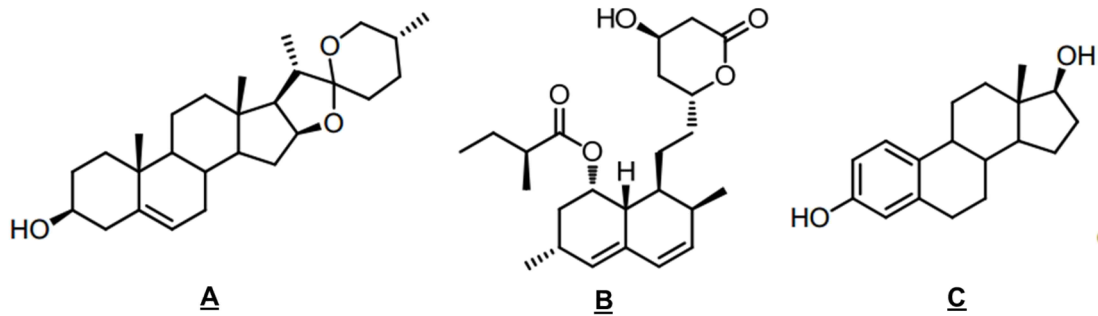
D



E

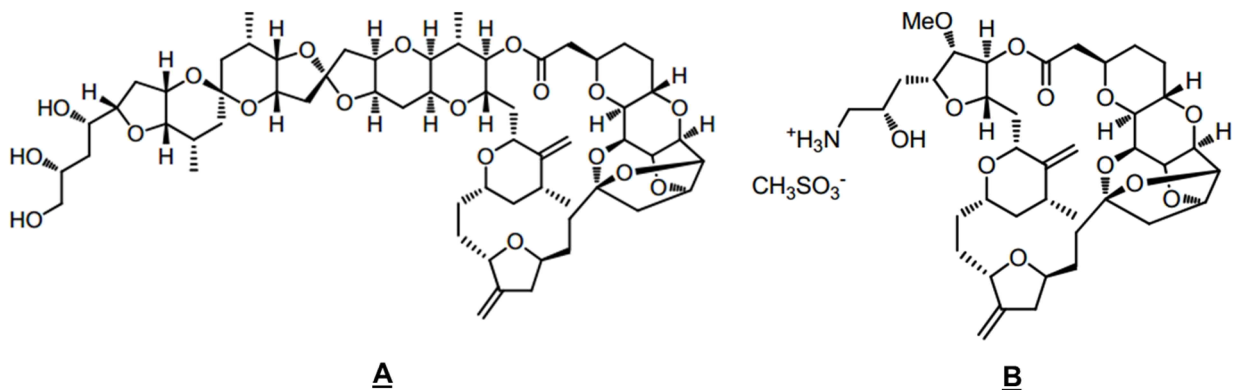
- A. Les molécules **C**, **D** et **E** sont utilisés en thérapeutique en tant qu'antitumoraux
- B. Les molécules **C** et **E** sont obtenues industriellement par extraction
- C. La molécule **D** est un analogue hémisynthétique de la molécule **E** et est moins active que la molécule **E**
- D. L'hémisynthèse donne accès à de nouveaux principes actifs n'existant pas à l'état naturel
- E. Le criblage est une méthode de découverte de nouveaux principes actifs, basée sur le hasard

QCM 7 : Molécules d'origine naturelle



- A. Les molécules **A**, **B** et **C** sont des stéroïdes
- B. La molécule **B** est extraite de la levure de riz rouge
- C. La molécule **B** est à l'origine d'analogues synthétiques appartenant à la classe des statines obtenus par pharmaco-modulation
- D. Les statines sont utilisées pour le traitement des intoxications aux opiacées
- E. L'ethnopharmacologie est une technique de découverte de nouveaux principes actifs basée sur le savoir traditionnel conservé par certaines populations

QCM 8 : Principes actifs d'origine naturelle



- A. La molécule **B** est l'éribuline, utilisée en chimiothérapie
- B. La molécule **B** est obtenue par hémisynthèse à partir de la molécule **A**
- C. La molécule **A** est une molécule naturelle isolée d'une éponge par une première extraction liquide-liquide
- D. Le pharmacophore est la partie de la molécule responsable de l'activité pharmacologique de la molécule modèle
- E. L'ethnopharmacologie est basée sur une corrélation entre la position d'un organisme dans la classification des êtres vivants et sa composition chimique

QCM 9 : Conception de molécules actives

- A. Statistiquement une molécule sur 1000 synthétisées deviendra un médicament
- B. La conception d'un médicament nécessite une cible thérapeutique définie par le biologiste et des molécules synthétisées par le chimiste
- C. Le criblage simple systématique et la modélisation moléculaire permettent de découvrir des chefs de files originaux
- D. Les molécules de perfectionnement peuvent permettre d'améliorer l'index thérapeutique du chef de file
- E. Les cibles thérapeutiques sont obligatoirement des protéines ou des lipides

QCM 10 : Analogue structural – Bioisostère – Pharmacophore - Prodrogue

- A. Le pharmacophore correspond à l'arrangement spatial de groupes d'atomes, reconnu par la cible et indispensable à l'activité biologique
- B. Les relations structure-activité correspondent aux relations établies entre la structure chimique d'une molécule et son activité biologique
- C. Un bioisostère possède théoriquement la même activité thérapeutique que la molécule mère
- D. Un analogue structural est forcément une molécule pharmacologiquement inactive
- E. Une prodrogue améliore en général la biodisponibilité de la molécule mère.

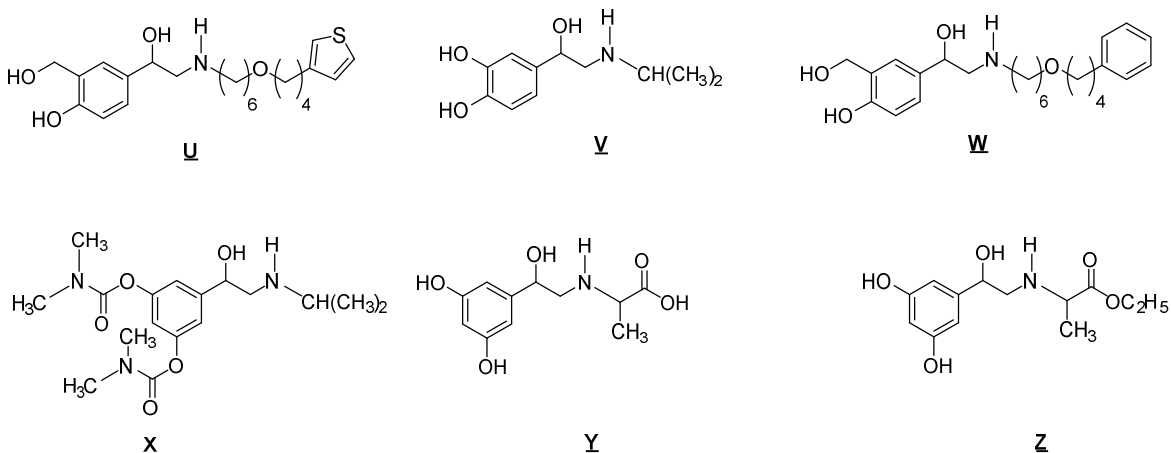
QCM 11 : Criblage - Sérendipité

- A. Le criblage consiste à tester *in silico* les éventuelles propriétés biologiques de molécules appartenant à des chimiothèques
- B. La sérendipité est une approche moléculaire utilisant le criblage à haut débit
- C. Le criblage à haut débit permet de s'affranchir des essais *in vitro*
- D. Les criblages simple systématique et à haut débit permettent d'obtenir des rendements élevés en découverte de molécules actives
- E. La sérendipité nécessite de la part du chercheur une disponibilité intellectuelle

QCM 12 : Modélisation moléculaire

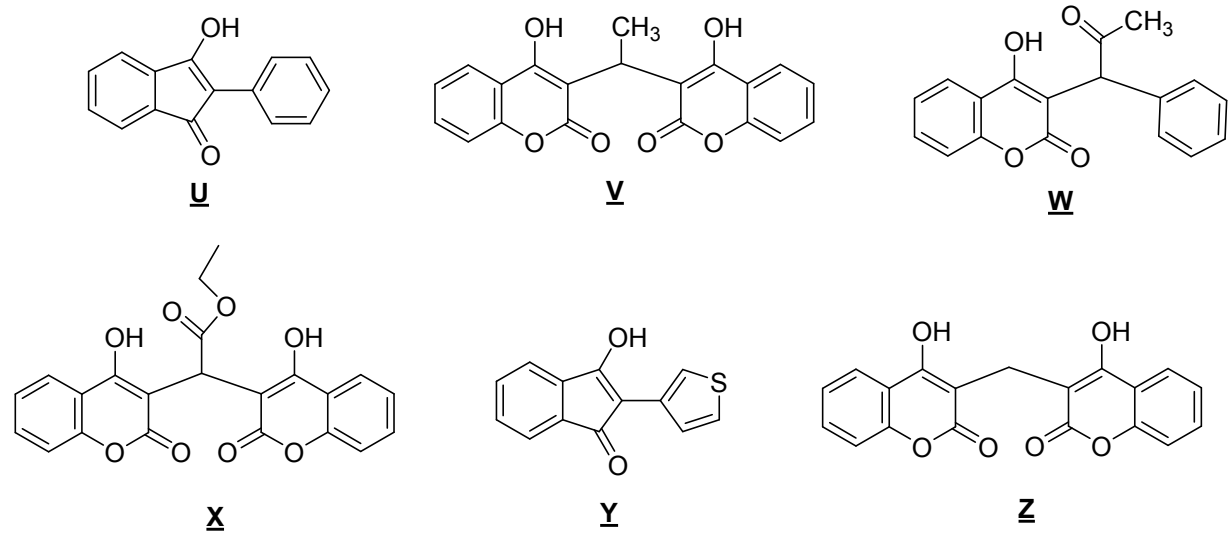
- A. La modélisation moléculaire est réalisée par le chimiste et le biologiste
- B. La modélisation moléculaire permet de tester *in silico* de nouvelles molécules d'intérêt pharmaceutique sur une cible donnée
- C. La modélisation moléculaire directe consiste à modéliser le pharmacophore
- D. La modélisation moléculaire permet de s'affranchir des essais sur l'animal
- E. La pénicilline G a été découverte par modélisation moléculaire

QCM 13 : Antihistaminiques - Prodrogue – Bioisostère - Analogue



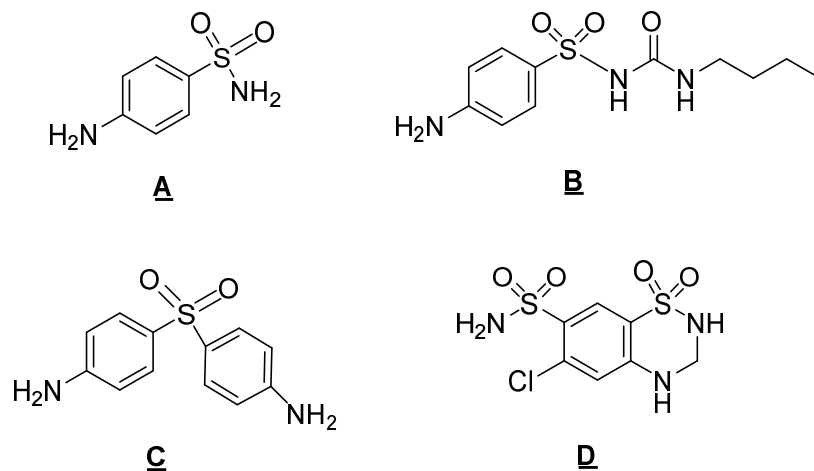
- A. Les molécules V, W, X, Y et Z sont des analogues structuraux
- B. La molécule U est un bioisostère de la molécule W
- C. La molécule Y est une prodrogue de la molécule Z
- D. La molécule X a la même durée d'action que la molécule V
- E. La molécule V se fixe uniquement sur les récepteurs β

QCM 14 : Anticoagulants oraux



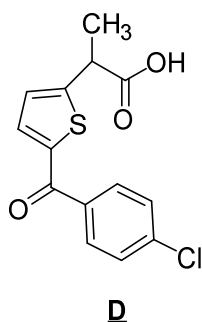
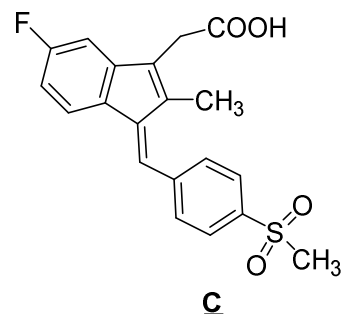
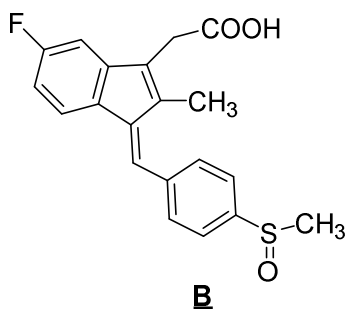
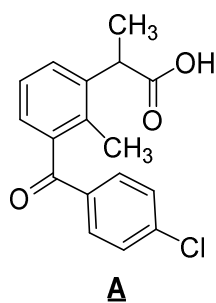
- Les molécules U, V, W, X, Y et Z sont des analogues structuraux
- La molécule Y est une prodrogue de la molécule U
- La molécule X est une prodrogue
- Les molécules U, V, W, X, Y et Z comportent un pharmacophore qui est une coumarine
- Les molécules V, X et Z présentent la même activité biologique

QCM 15 : Analogue – Bioisostère - Prodrogue



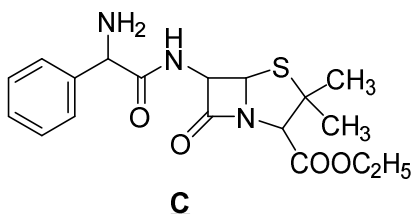
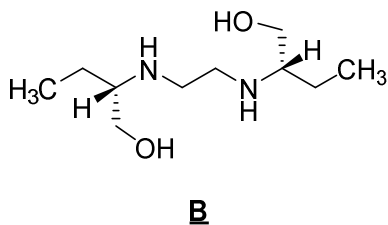
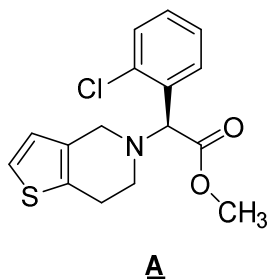
- La molécule A correspond au pharmacophore des sulfamides antibactériens
- La molécule C est une prodrogue de la molécule A
- La molécule D est un métabolite actif de la molécule A
- Les molécules B, C et D sont des sulfamides antibactériens
- Les molécules B, C, D ont été obtenues par pharmacomodulations successives à partir de la molécule A

QCM 16 : Prodrogue – Bioisostère – Métabolite



- A. La molécule **B** est une prodrogue
- B. La molécule **C** est un métabolite actif *in vivo*
- C. La molécule **D** est un bioisostère de la molécule **A**
- D. Les molécules **A**, **B** et **D**, sont des anticoagulants oraux
- E. Les molécules **A**, **B** et **D**, sont des analogues structuraux

QCM 17 : Molécules thérapeutiques



- A. Les molécules **A** et **C** sont des prodrogues
- B. Le métabolite actif de la molécule **A** inactive un récepteur impliqué dans l'agrégation plaquettaire
- C. La molécule **B** a été découverte par sérendipité
- D. La molécule **B** est un antituberculeux majeur, actif contre le bacille de Koch
- E. La molécule **C** est active par voie orale et présente la même biodisponibilité que l'ampicilline

QCM 18 : Les biomédicaments produits par ingénierie génétique

- A. Font appel à des techniques de synthèse chimique
- B. Permettent d'assurer la reproductibilité entre les lots
- C. Sont des molécules de taille inférieure à 1000 Da
- D. Peuvent être produits en grande quantité
- E. Permettent de garantir l'innocuité du matériel

QCM 19 : Les principaux outils du génie génétique incluent

- A. Des enzymes de restriction qui coupent l'ADN de manière définie et reproductible
- B. Des vecteurs qui transcrivent l'ARNm en ADNc
- C. Des cellules-hôte uniquement procaryotes, qui sont des usines de production des biomédicaments
- D. Une transcriptase inverse, qui est une enzyme de restriction
- E. Des protéines recombinantes, véhicules pour le transfert du matériel génétique

QCM 20 : Contrairement aux cellules eucaryotes, les cellules procaryotes :

- A. Sont uniquement pluricellulaires
- B. N'ont pas d'organites intracellulaires
- C. Présentent un génome de petite taille sous forme d'ADN circulaire
- D. Réalisent une maturation de l'ARN
- E. Présente une production protéique importante

QCM 21 : Parmi les biomédicaments issus de l'ADN recombinant, on trouve :

- A. Les oligonucléotides et plasmides
- B. Les médicaments dérivés du sang
- C. La thérapie tissulaire
- D. Les anticorps monoclonaux
- E. Les toxines

QCM 22 : Par rapport aux médicaments issus de la synthèse organique, les protéines recombinantes :

- A. Sont produites par des techniques d'hémisynthèse
- B. Se fixent à une cible extracellulaire
- C. Présentent une spécificité plus importante
- D. Nécessitent une administration orale et quotidienne
- E. Présentent une biodistribution plus restreinte

QCM 23 : L'insuline recombinante :

- A. Est obtenue à partir de l'insuline extraite du pancréas du porc
- B. N'est pas immunogène
- C. Est produite par une bactérie, *E.coli*
- D. Est un exemple de thérapie génique
- E. Est détoxifiée par action des enzymes du foie

QCM 24 : En médecine humaine, la thérapie génique

- A. peut utiliser des cellules multipotentes
- B. est réalisée dans des cellules somatiques pour le transfert de gène
- C. nécessite des vecteurs uniquement utilisés *in vivo* permettant d'injecter directement le gène d'intérêt dans l'organisme
- D. d'augmentation permet d'administrer le gène correcteur dans les cellules malades
- E. de destruction ciblée de cellules spécifiques est employée dans le traitement de cancer

QCM 25 : La thérapie cellulaire

- A. Fait partie de la médecine régénératrice
- B. Permet de remplacer les cellules disparues ou déficientes par des cellules saines
- C. Est une biothérapie
- D. Utilise de l'ADN recombinant
- E. Utilisent des cellules totipotentes