

CHIMIE THERAPEUTIQUE

UE PL2.11 : Introduction à la Chimie Thérapeutique

26 mai 2014, durée de l'épreuve : 30 minutes

Le sujet comporte 3 QROC, rédigées sur une page

Question 1

Pr Isabelle Bestel

(8 points)

Citez et commentez brièvement les paramètres moléculaires qui permettent de moduler l'absorption intestinale des médicaments.

Question 2

Pr Isabelle Bestel

(4 points)

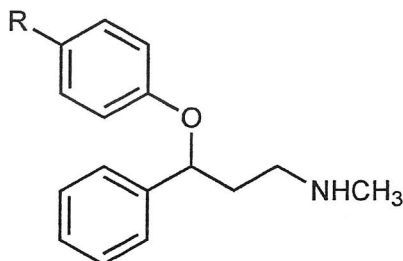
- 2a. Donnez la définition d'une prodrogue
- 2b. Citez une réaction chimique classiquement utilisée pour préparer une prodrogue.

Question 3

Pr Alain Nuhrich

(8 points)

Le tableau suivant montre la structure de la FLUOXÉTINE (C1) (médicament antidépresseur agissant sélectivement sur le transporteur de la sérotonine) et celle de deux composés apparentés (C2 et C3) se différenciant par la nature du substituant R.



Composés	Substituant R
C1 (Fluoxétine)	—CF ₃
C2	—CH ₃
C3	

- 3a. Donnez le nom respectif de chaque groupement R.
- 3b. Comparez les *effets stériques* induits par ces substituants. Le remplacement du groupement CF₃ par un CH₃ répond-il à la notion de bio-isostérie ?
- 3c. La sélectivité d'action de la FLUOXÉTINE dépend essentiellement des *effets électroniques* du groupement CF₃. Précisez la nature de ces effets.