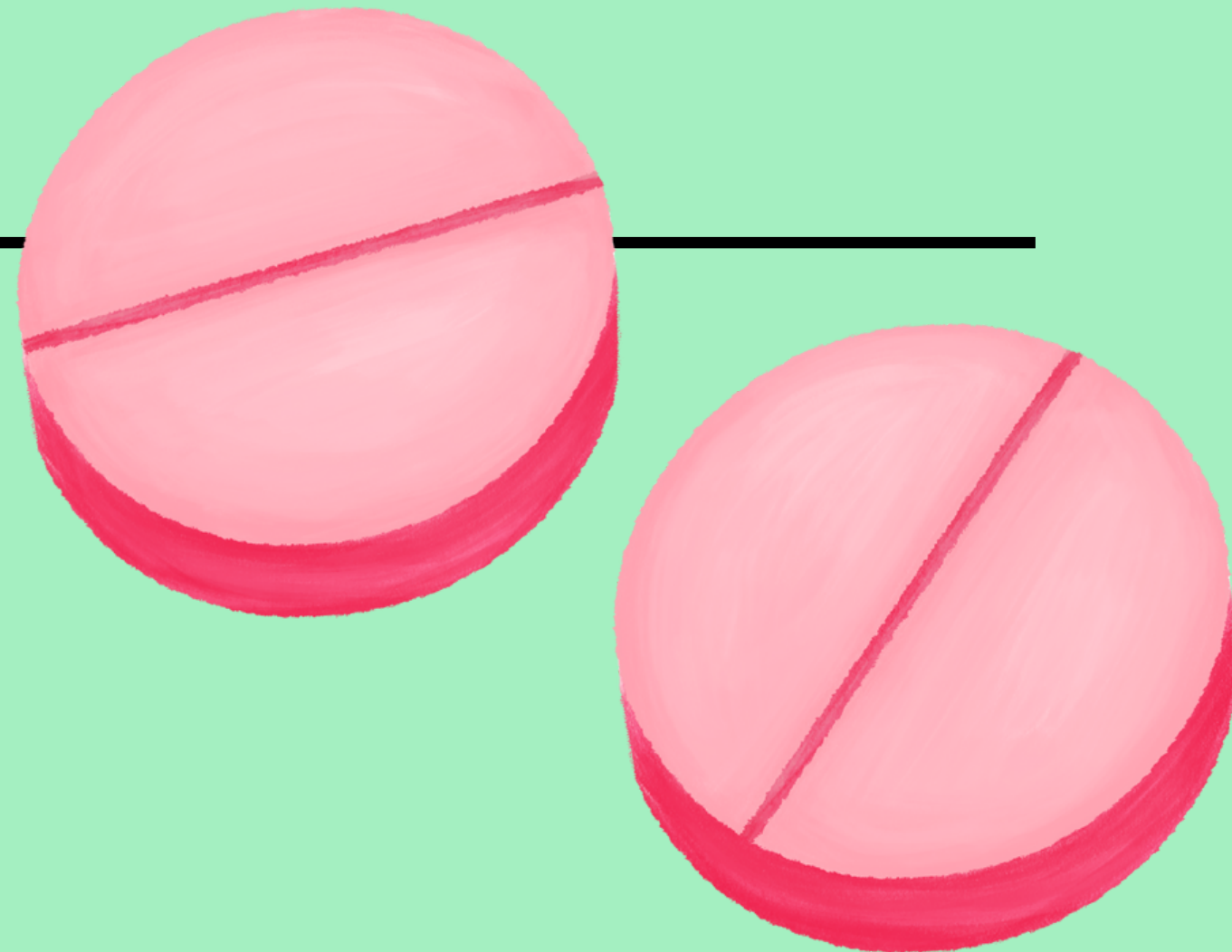


PharmacoSTAR



PHARMACODYNAMIE

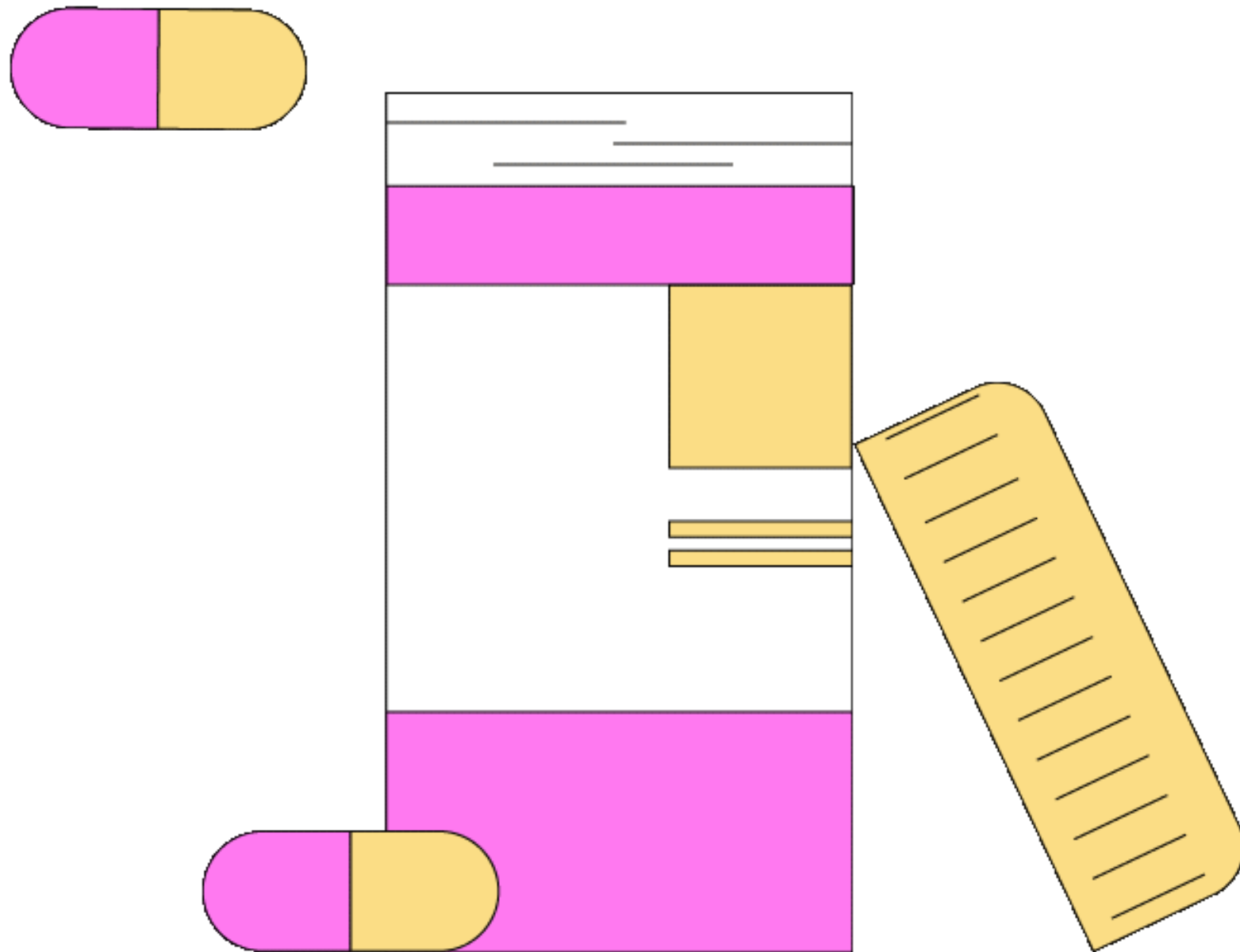
PR. GARAFFO



Assyl-CoA

LA PHARMACODYNAMIE

C'EST QUOI ?



c'est l'étude :

- des **effets** des Principes actifs
- des **mécanismes d'action** de ces PA

1. ETUDE DOSE-RÉPONSE

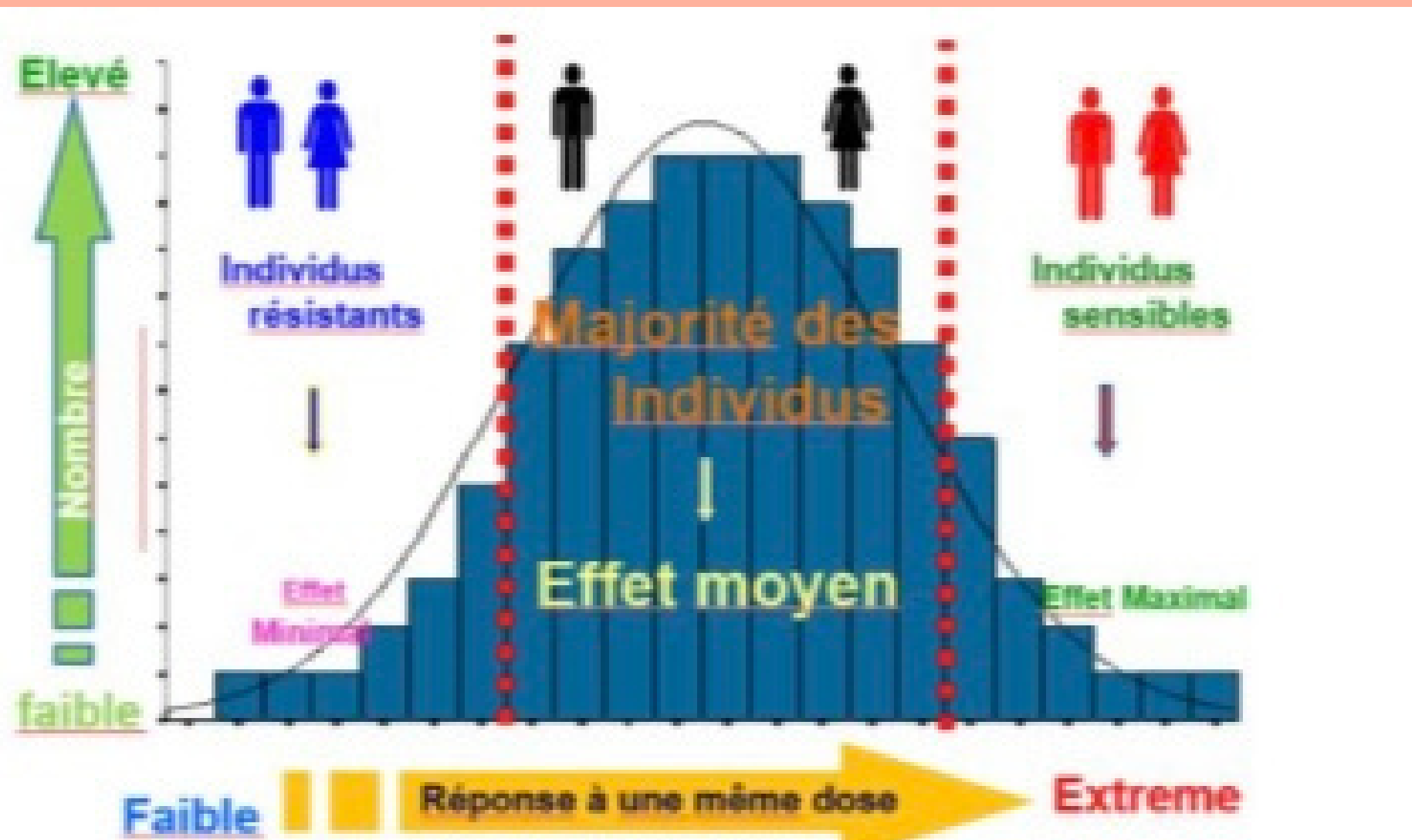
Variabilité pharmacodynamique

DANS UNE POPULATION

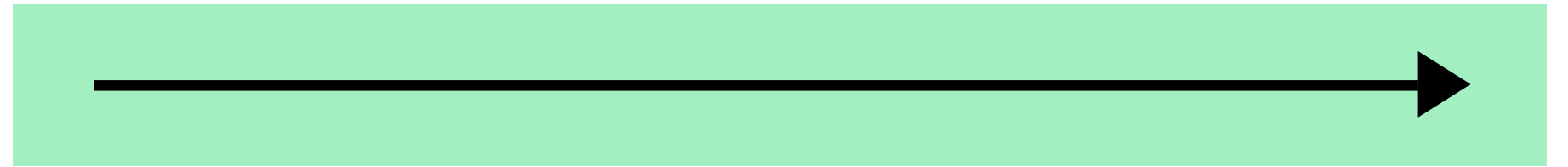
Au centre : l'*effet moyen*
escompté, majorité de la
population

A gauche de la courbe : réponse faible
donc *effet minimum* → individus
résistants

A droite de la courbe : Réponse forte donc
effet maximum → individus
hypersensibles



2. AGONISTE / ANTAGONISTE



Une fois que le médicament (clé) se fixe sur le récepteur (serrure), deux types d'actions envisageables

Déclenchement/s

timulation : il y a

potentialisation

d'un phénomène physiologique → elle est **agoniste**.



Suppression /dépression :

L'action ira à l'encontre du processus physiologique → elle est **antagoniste**



3. DIFFÉRENTS TYPES DE RECEPTEURS

• Récepteurs nucléaires

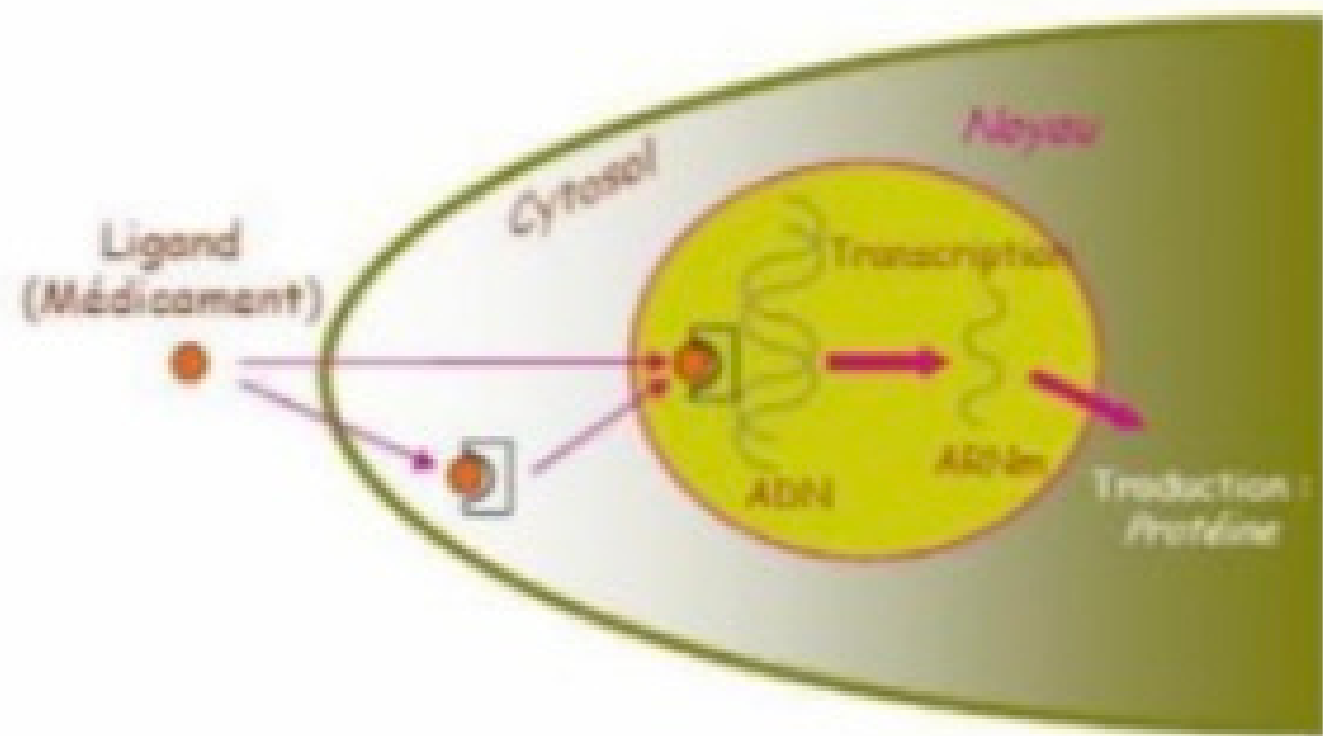
- situés dans le noyau (d'où le nom nucléaire) mais aussi dans le **cytosol**.

Le ligand (mdc) va se lier à son récepteur qui se trouve ;

- déjà dans le noyau → se lie directement à l'ADN
- dans le cytosol → traverse la membrane nucléaire pour se lier à l'ADN

• Récepteurs transmembranaires

- **A activité de canal ionique**, qui permet le passage d'ions
- **Couplés aux protéines G**, permettant l'induction de seconds messagers
- **Couplés à une enzyme**



Représentation simplifiée de la modulation directe de la synthèse protéique

Liaison → Amplificateur → Effecteur →
Réponse biologique

4. LIAISON MDC-RC

IL EXISTE DEUX TYPES DE LIAISONS

Liaison spécifique :

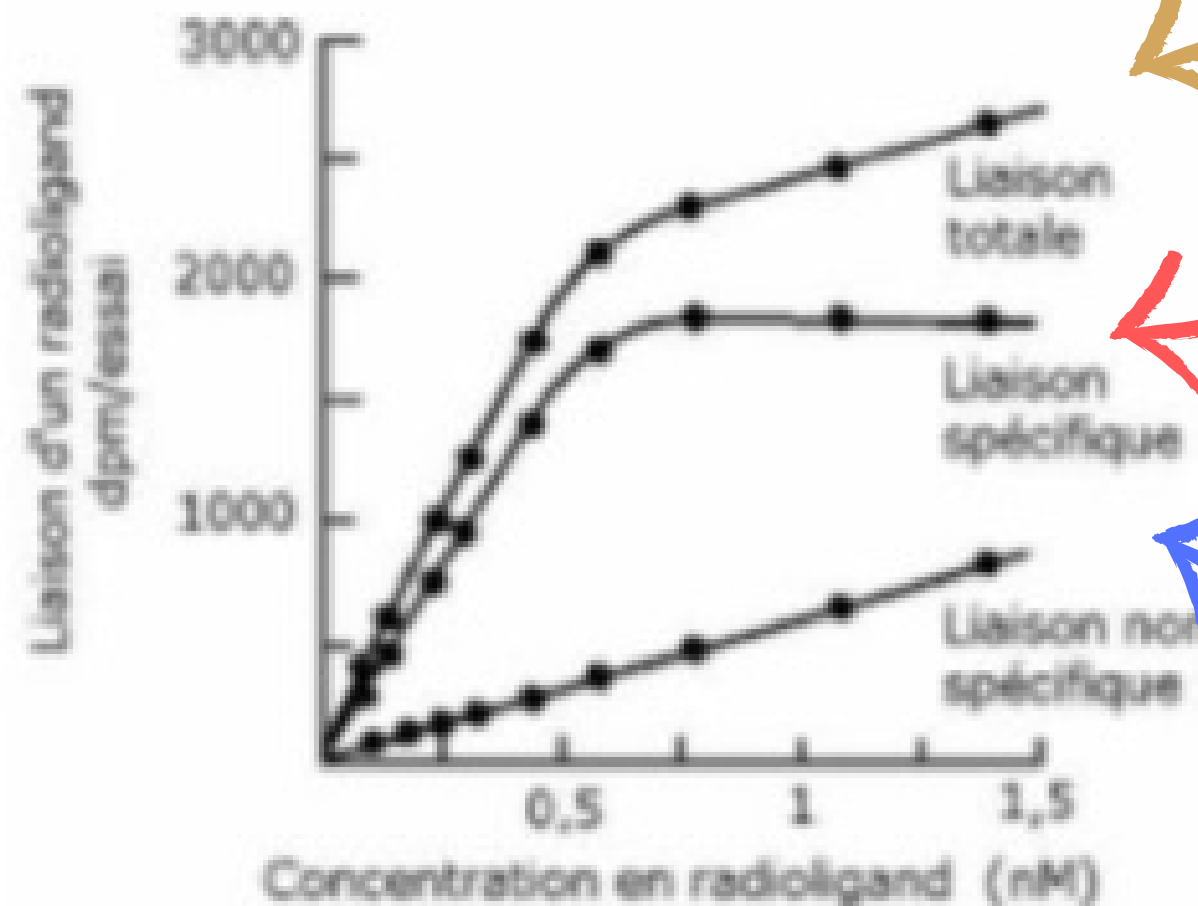
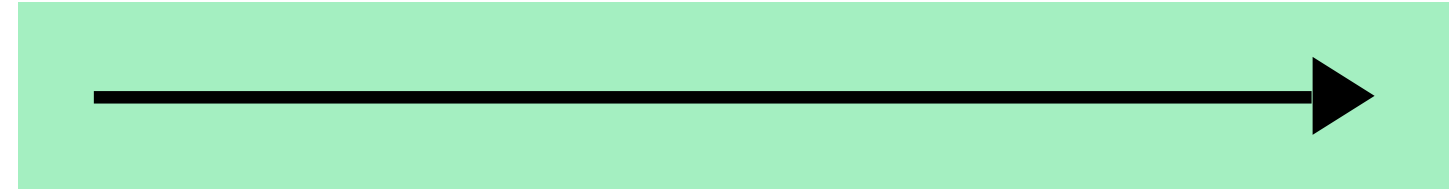
- Forte affinité
- Induit l'effet Biologique
- saturable



Liaison non spécifique :

- Liaison sur d'autres sites que le récepteur avec une faible affinité
- Pas d'effet biologique mais possible toxicité
- Liaison non saturable (accumulation de médicament dans le tissu) —

3 TYPES DE COURBES :



La liaison totale

la **somme des types de liaison du radio-ligand**

Spécifique + non spécifique = totale

La liaison spécifique

saturable = on atteint un plateau

La liaison non spécifique

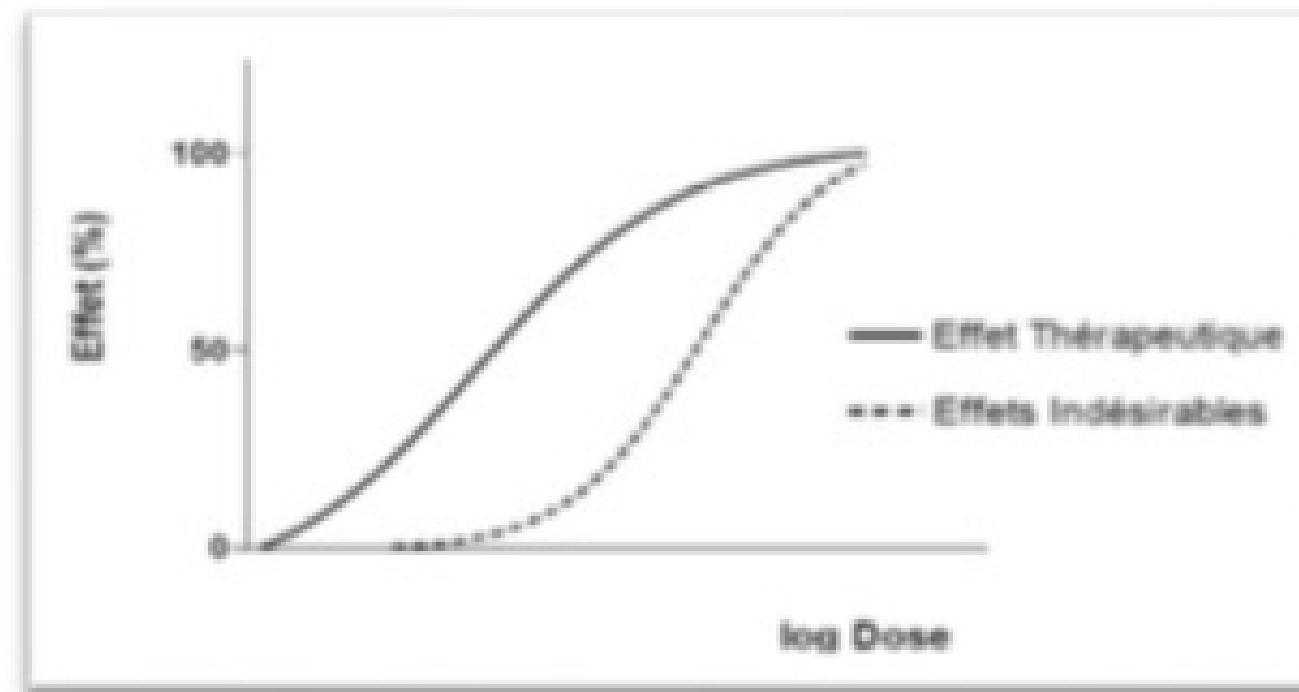
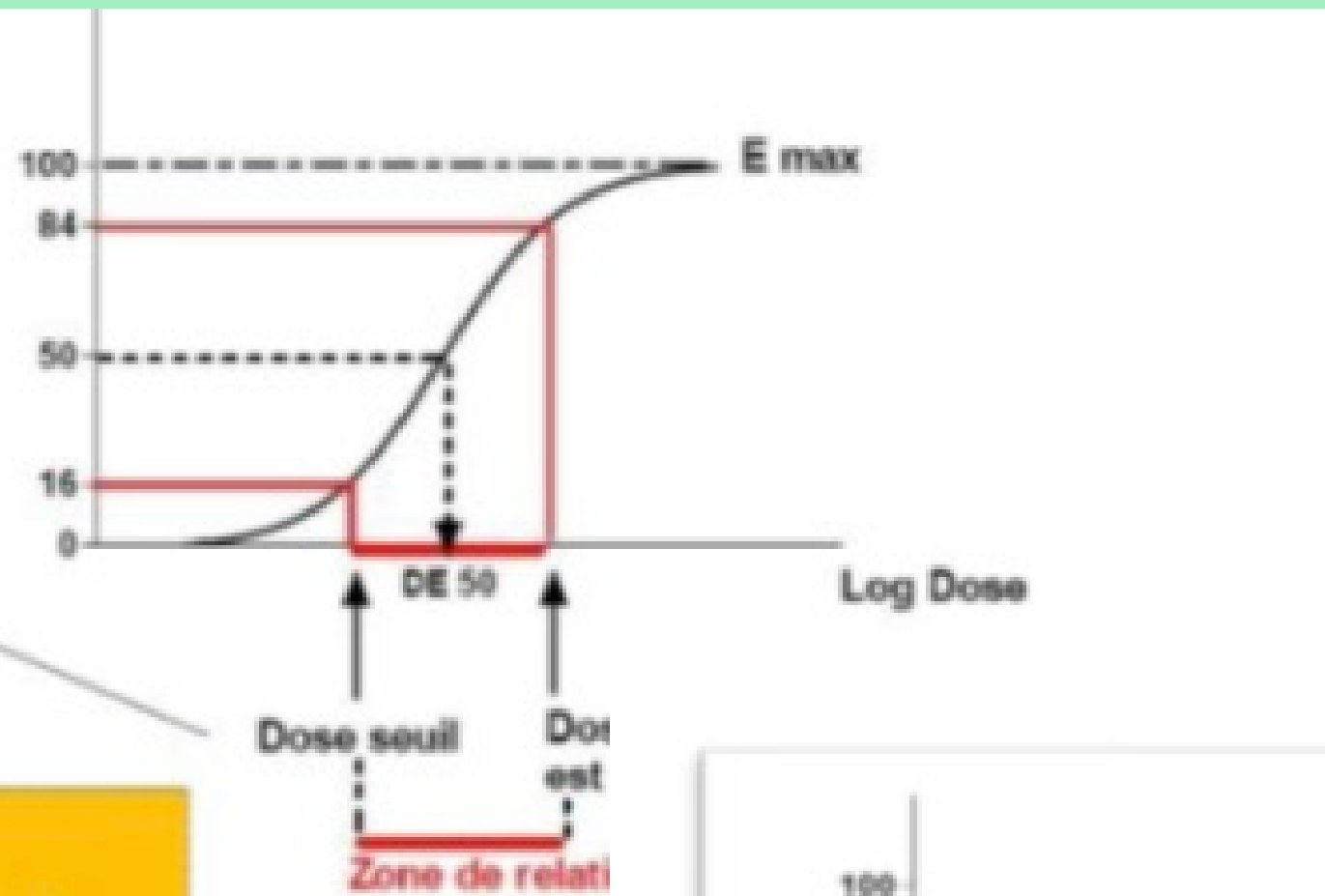
non saturable = linéaire

KD c'est : la concentration en ligand nécessaire pour obtenir 50% d'occupation des récepteurs +++.



5. COURBE DOSE – RÉPONSE

Cette courbe mesure **l'effet pharmacologique** pour des doses croissantes de ligand



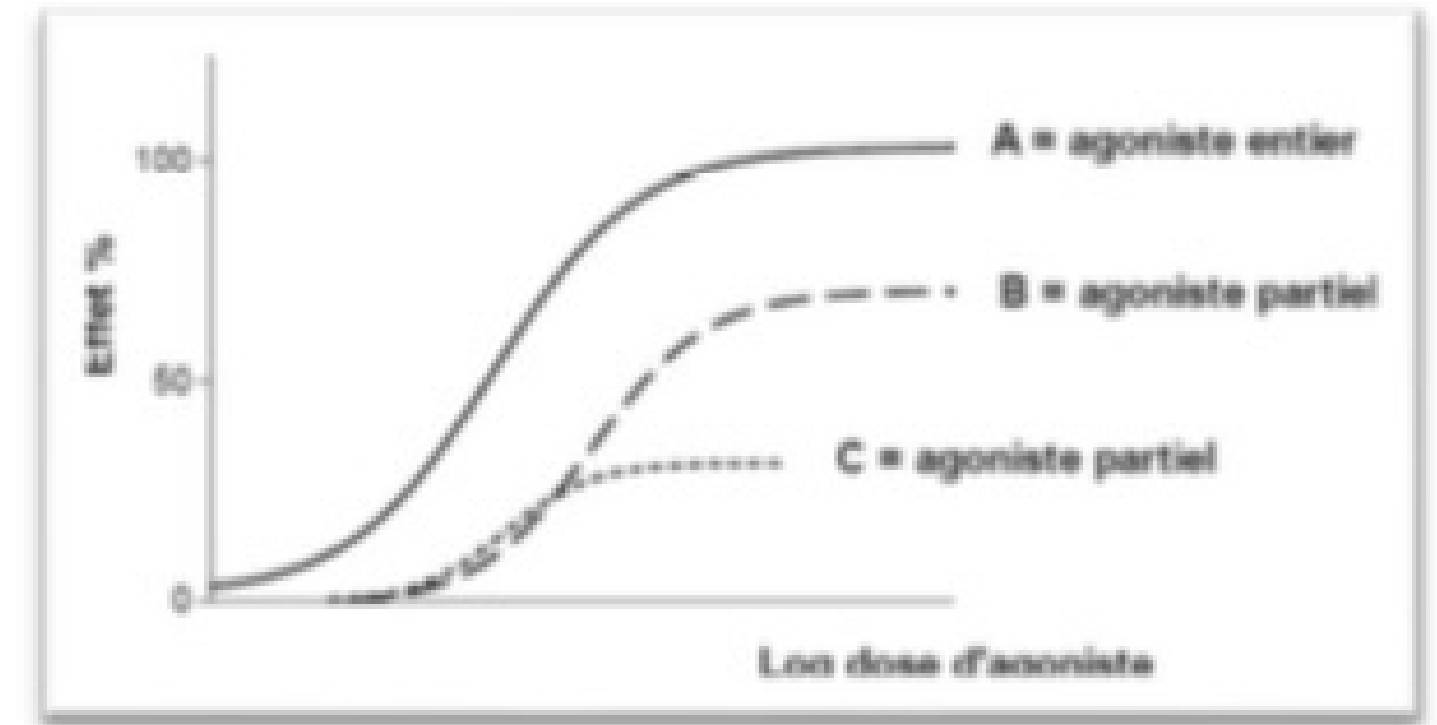
- **Dose seuil** : dose à partir de laquelle un effet apparaît
- **Emax** : effet maximum
- **DE50** : c'est la Dose Efficace 50, la dose qui donne 50% de l'effet maximum.

A) NOTION D'AGONISTE

Mdc avec Effet Comparable à celui du médiateur naturel +++

Efficacité de l'agoniste :

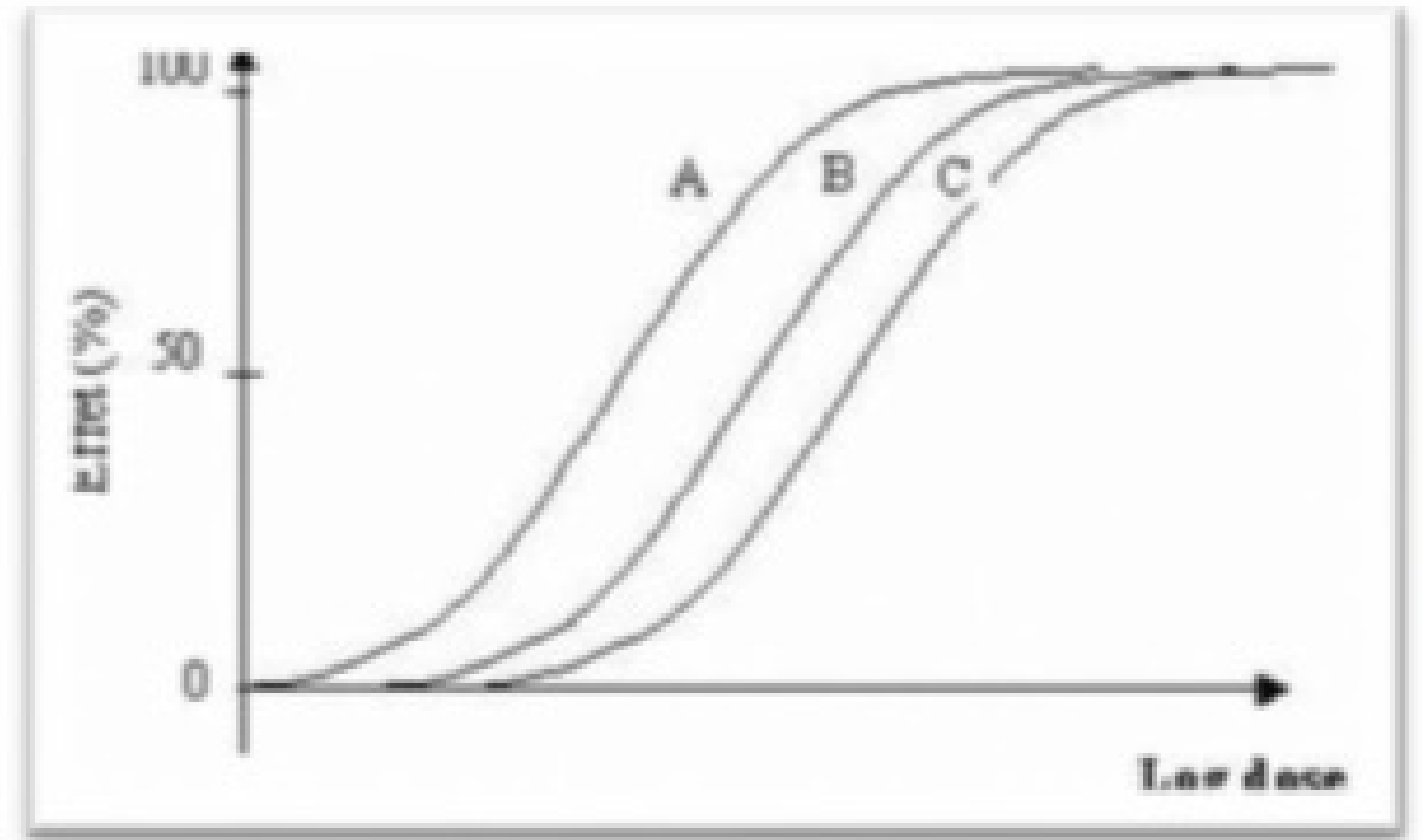
- ✓ **Agoniste entier ou pur** : produit l'effet maximal
- ✓ **Agoniste partiel** : son effet est inférieur à l'effet maximal



La **puissance (=affinité)** d'un agoniste :

✓ Plus la **concentration** pour obtenir l'effet pharmacologique est **faible**, plus le **ligand a d'affinité = puissance pour le récepteur**

✓ Si **l'affinité augmente**, la **puissance augmente**



B) NOTION D'ANTAGONISTE

Un antagoniste est une substance qui se lie à un récepteur spécifique sans provoquer d'effet mais qui bloque l'action du médiateur endogène +++

Antagoniste compétitif :

✓ Compétition entre l'agoniste et l'antagoniste pour la liaison sur le même site

Il en existe Deux types :

Antagoniste non compétitif

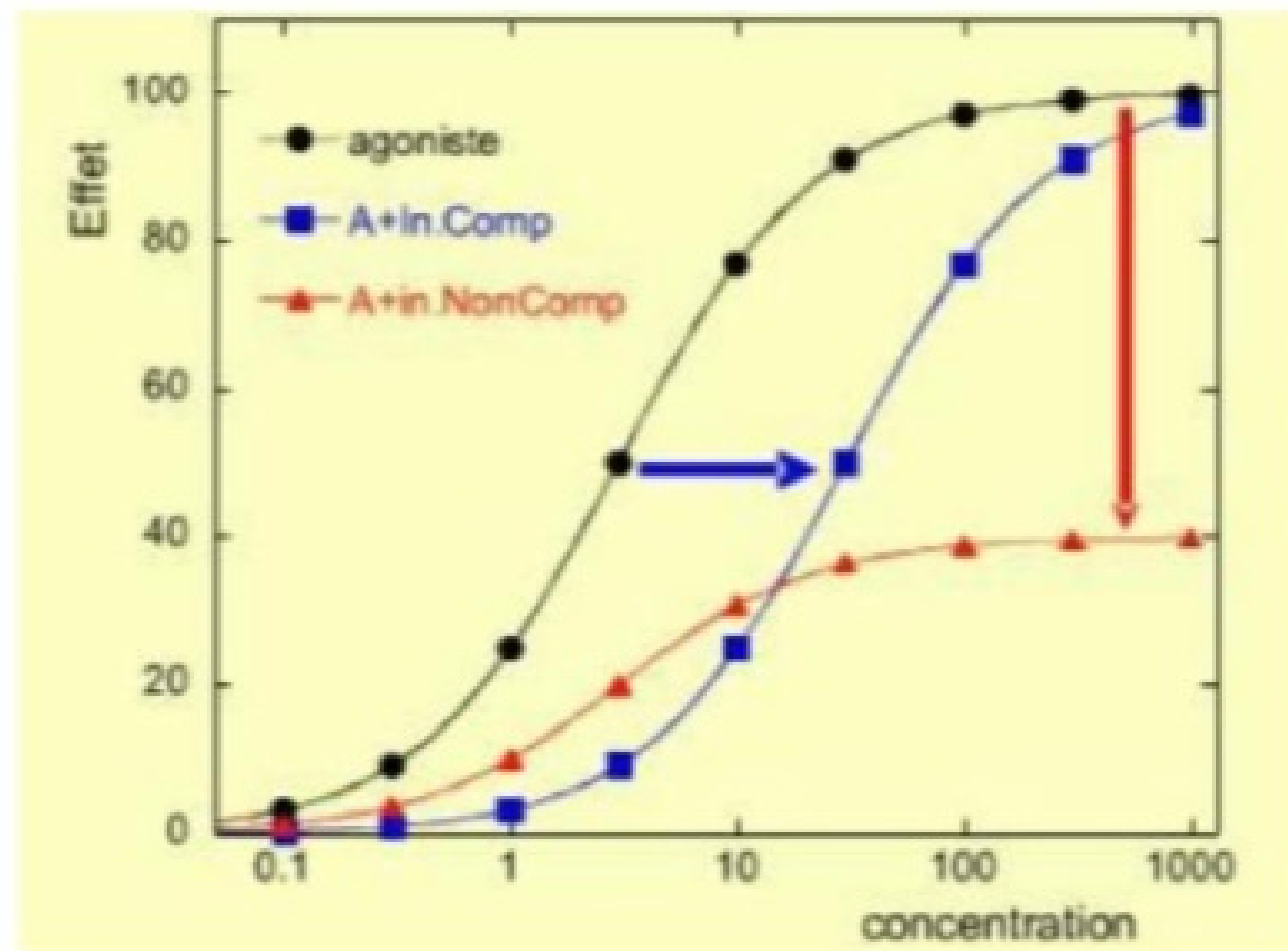
✓ Liaison au récepteur sur un autre site que l'agoniste

✓ Diminution de l'effet maximal :

- Antagonisme **insurmontable**

✓ L'effet maximal peut toujours être obtenu à des concentrations plus élevées → Antagonisme **réversible ou surmontable**





QCM 1

**A propos de la tut rentrée?
quelle est la meilleure matière ?**

- A) La Biostatis...bref**
- B) La biocell (C'est koi ca ?)**
- c) L'histologie (El Famoso Myofibrille)**
- D) La star des stars La PHARMACOLOGIE**
- E) Toutes les propositions sont fausses (attention à ce que vous allez dire)**

QCM 1

**A propos de la tut rentrée?
quelle est la meilleure matière ?**

- A) FAUX**
- B)FAUX**
- c) VRAI...**
- D)FAUX**
- E) FAUX**



**BANDE DE MALADES
VIVE LA PHARMACO !!!!!!!!!!!!!**

