



**DM Tutorat UE6 2011/2012 N°1  
"CONNAISSANCE"**

**Pharmacocinétique et pharmacodynamie**

ITEM	TRUE	FALSE
1/ La pharmacodynamie définit la relation dose-concentration		
2/ On définit différentes étapes entre l'administration du principe actif et l'obtention de l'effet thérapeutique : dans l'ordre, étape pharmacocinétique, pharmacodynamique, pharmacologique et enfin effet thérapeutique		
3/ La pharmacocinétique est l'étude des concentrations du médicament dans l'organisme au cours du temps et les effets qui en découlent		
4/ Le médicament est un xénobiotique		
5/ Le devenir du médicament comprend 4 étapes : absorption, distribution, métabolisme et élimination		
6/ Ces 4 étapes (ADME) peuvent être modifiées par l'environnement		
7/ La génétique n'influe aucunement la pharmacocinétique d'un médicament		
8/ La distribution mesure le passage du médicament dans le sang		
9/ L'élimination d'un médicament peut être rénale et/ou hépatique		
10/ Le métabolisme a pour but de rendre le médicament plus hydrosoluble		
11/ Les principaux sites du métabolisme sont l'intestin, le foie et le rein		
12/ Chaque étape du métabolisme ne débute pas tant que la précédente n'est pas achevée		
13/ L'absorption concerne toutes les voies d'administration, à l'exception de la voie intraveineuse		
14/ Les 4 étapes ont systématiquement lieu pour tous les médicaments administrés par voie orale		
15/ Les étapes A, D et M nécessitent le franchissement de barrières physiologiques		
16/ Le transfert passif permet des échanges libres unidirectionnels		
17/ Le transfert passif est non saturable et non soumis à compétition		
18/ Le passage transcellulaire est obligatoire pour les « sites protégés »		
19/ Le transfert passif peut se faire par des pores présents notamment dans le glomérule rénal		
20/ La barrière hémato-méningée ne peut être traversée que par les molécules de petite taille et/ou peu liposolubles		

21/ L'intégrité de la BHE est altérée seulement en cas de méningite		
22/ La diffusion passive se fait selon un gradient de concentration		
23/ Elle se fait d'autant mieux que les molécules concernées sont liposolubles, sous forme liée et non ionisées		
24/ Dans l'intestin, l'absorption se fera majoritairement pour les bases faibles		
25/ L'aspirine est un acide faible, son action sera donc moins rapide que la strychnine qui est une base faible		
26/ La diffusion passive est non spécifique, non compétitive et insaturable		
27/ La diffusion passive facilitée est aussi non spécifique, non compétitive, et non saturable		
28/ Le transport actif se fait indépendamment du gradient de concentration		
29/ Le transport actif est énergie-dépendant		
30/ Le transport actif répond à la loi de Fick		
31/ Les transporteurs en position apicale sur la cellule permettent l'entrée du médicament dans la cellule		
32/ Les transporteurs de la famille des SLC sont des transporteurs d'influx		
33/ OAT et OCT font partie de cette famille des SLC		
34/ Les transporteurs de la famille des ABC sont des pompes d'efflux		
35/ Des gènes codant pour ces transporteurs ABC (type MDR <small>ahahahah... ok je sors</small> ) sont impliqués dans la résistance à certains traitements		
36/ Le poids moléculaire du médicament n'a aucune influence sur son absorption		
37/ La vitesse de vidange gastrique et du transit a un effet sur l'absorption		
38/ L'administration extra-vasculaire conduit généralement à une perte en médicament (fraction non absorbée)		
39/ L'administration parentérale est obligatoire pour les médicaments inactivés dans le tube digestif ou non absorbés		
40/ La voie sublinguale ne permet pas d'éviter un EPP important		
41/ La voie rectale permet une absorption rapide		
42/ L'absorption digestive est caractérisée par la biodisponibilité orale		
43/ Après administration <i>per os</i> , le médicament doit franchir la barrière entérocytaire et traverser le foie avant d'arriver dans la circulation sanguine		
44/ Le P-gp et le CYP450 favorisent la résorption digestive des médicaments administrés <i>per os</i>		
45/ Le cycle entéro-hépatique retarde l'effet du médicament		
46/ Une biodisponibilité de 0 % signifie que le médicament a été totalement absorbé		
47/ La biodisponibilité considère à la fois la quantité de médicament qui atteint la circulation générale et la vitesse à laquelle elle l'atteint		
48/ La biodisponibilité se détermine par comparaison à la voie orale		
49/ La biodisponibilité peut être une source importante de variabilité interindividuelle quant à l'exposition du médicament		
50/ La distribution est le transfert irréversible du PA de la circulation sanguine vers les organes et les tissus		
51/ La redistribution tissulaire se fait des tissus les moins vascularisés vers les tissus les plus vascularisés		

52/ La liaison aux protéines plasmatiques ne concerne pas tous les médicaments		
53/ La forme liée correspond à la forme hydrosoluble		
54/ La liaison aux protéines plasmatiques est réversible		
55/ Cette liaison est rapide, plus ou moins spécifique		
56/ Elle est toujours saturable et soumise à compétition		
57/ Les médicaments ayant une fixation de type 1 sont des bases faibles		
58/ Ils se fixent à l'albumine		
59/ Leur affinité pour l'albumine est forte		
60/ Les fixations de type 2 sont caractérisées par leur risque de saturation et de compétition		
61/ Pour les fixations de type 1, le risque de déplacement est existant		
62/ La forme liée du médicament est non diffusible et non éliminable		
63/ Elle possède néanmoins un effet pharmacologique		
64/ Le médicament libre est biotransformable		
65/ La fixation du médicament aux protéines plasmatiques conduit à une diffusion tissulaire retardée et plus lente, sauf si l'affinité tissulaire est supérieure		
66/ La distribution est difficile dans le SNC ou les testicules		
67/ Le volume de distribution est le volume dans lequel devrait être dissout le médicament pour être partout à la même concentration que dans le plasma		
68/ $V_d = V_{\text{plasma}} - V_{\text{extraplasma}}$		
69/ Le $V_d$ peut être obtenu graphiquement grâce à la formule $V_d = \text{dose} / C_0$ pour un modèle bi-compartimental		
70/ Le compartiment plasmatique a un volume d'environ 4-5L chez un homme de 70kg		
71/ Le volume apparent de distribution est une réalité physiologique		
72/ L'excrétion permet d'éliminer le produit après qu'il ait été modifié (métabolisme...)		
73/ Le métabolisme se fait +++ au niveau du foie, mais a aussi lieu dans les poumons, les reins, l'intestin...		
74/ Le métabolisme n'est pas une étape systématique pour tous les médicaments		
75/ Lorsqu'un médicament subit les 2 types de biotransformation, la phase de conjugaison précède toujours celle de fonctionnalisation		
76/ Le métabolisme permet de transformer des molécules apolaires liposolubles en métabolites polaires hydrosolubles		
77/ Les CYP450 interviennent dans les réactions de phase 2		
78/ La glucuronidation est une réaction de phase 2		
79/ Le CYP3A est le CYP450 le plus impliqué dans le métabolisme des médicaments		
80/ Un inducteur de cytochrome P conduira à une augmentation de l'exposition au médicament et une diminution de l'exposition au(x) métabolite(s)		
81/ L'inhibition du métabolisme d'un médicament conduit à un ralentissement de l'élimination du médicament		
82/ Dans cette situation-là, il y a donc un risque accru de survenue d'effets indésirables		
83/ A l'inverse, l'induction du métabolisme d'un médicament peut éventuellement conduire à une disparition de l'effet thérapeutique recherché		
84/ Les métabolites d'un même médicament ont tous le même profil pharmacocinétique		

85/ Les métabolites sont toujours moins actifs que le médicament de départ		
86/ Certains facteurs génétiques peuvent modifier le métabolisme		
87/ L'âge est un facteur de variation du métabolisme		
88/ L'élimination se fait principalement par voie urinaire et par excrétion biliaire		
89/ La clairance désigne le volume de sang totalement épuré d'une substance par unité de temps		
90/ Plus la clairance est élevée, plus les capacités d'élimination de l'organisme pour le médicament concerné sont faibles		
91/ Pour un médicament administré par voie orale, la clairance est donnée par la formule suivante : $Cl = \text{dose}/ASC$ (aire sous la courbe)		
92/ $Cl_{\text{hépatique}} = Cl_{\text{métabolisme}} - Cl_{\text{excrétion biliaire}}$		
93/ Le coefficient d'extraction $E = (\text{concentration entrée} - \text{concentration sortie})/\text{concentration entrée}$		
94/ Lorsque $E > 0,7$ , la clairance hépatique dépend de la fraction libre et de la clairance intrinsèque		
95/ $Cl_{\text{rénale}} = Cl_{\text{filtration}} + Cl_{\text{sécrétion}} - Cl_{\text{réabsorption}}$		
96/ La filtration glomérulaire se fait pour les médicaments non liés et ceux dont le PM est inférieur à 65 kDa		
97/ La clairance de filtration maximale a une valeur de 120 mL/min		
98/ La réabsorption tubulaire a systématiquement lieu		
99/ La réabsorption tubulaire se fait par diffusion active		
100/ La sécrétion tubulaire se fait par l'intermédiaire transporteurs actifs		
101/ Elle est donc saturable et soumise à compétition		
102/ Il y a des risques d'interactions médicamenteuses lors de la sécrétion tubulaire		
103/ $Cl_{\text{totale}} = Cl_{\text{rénale}} + Cl_{\text{hépatique}} - Cl_{\text{autres}}$		
104/ L'excrétion biliaire se fait surtout pour les métabolites conjugués et les grosses molécules		
105/ Le temps de demi-vie d'élimination est le temps nécessaire pour que les concentrations plasmatiques soient divisées par 2 après obtention de l'équilibre de distribution		
106/ Au bout de $5 t_{1/2}$ , 97 % du médicament a été éliminé		
107/ La demi-vie est directement proportionnelle à la clairance et au volume de distribution		
108/ L'étude de la pharmacodynamie permet de déterminer l'intervalle thérapeutique		
109/ L'étude des interactions médicamenteuses ne fait pas partie de la pharmacodynamie		
110/ Les médicaments peuvent avoir une fonction de substitution, en apportant des substances qui manquent à l'organisme		
111/ Ces substances qui ne sont pas en quantité suffisantes le sont toujours pas défaut de synthèse		
112/ Les anti-acides agissent par interaction physico-chimique		
113/ Lors de la fixation du ligand sur le site accepteur, il y a effet		
114/ Une liaison médicament-récepteur spécifique est une liaison saturable		

115/ Une liaison médicament-récepteur non spécifique donne un effet biologique		
116/ La constante de dissociation $K_D$ représente la concentration en ligand pour obtenir 50 % de l'occupation des récepteurs		
117/ Plus $K_D$ est faible, plus l'affinité ligand-récepteur est faible		
118/ La constante de demi-effet $K_{1/2}$ est la concentration qui produit 50 % de l'effet maximal		
119/ La courbe dose-réponse mesure l'effet pharmacologique pour des doses décroissantes de ligand		
120/ L'effet pharmacodynamique est proportionnel au nombre de récepteurs occupés		
121/ $E_{max}$ permet d'apprécier l'efficacité du médicament		
122/ La $CE_{50}$ représente l'activité de la molécule		
123/ La $CE_{50}$ dépend de l'affinité de la molécule pour sa cible		
124/ L'antagoniste agit même s'il n'y a pas d'agoniste		
125/ Un agoniste partiel a la même efficacité qu'un agoniste entier		
126/ L'affinité et la puissance du médicament sont proportionnels		
127/ Plus la puissance est faible, plus la $CE_{50}$ est faible		
128/ Un antagoniste est forcément compétitif		
129/ Quand on se trouve en présence d'un antagoniste compétitif, il faut augmenter la dose de ligand pour obtenir le même effet qu'en l'absence de l'antagoniste		
130/ L'item précédent traduit la notion d'antagonisme réversible ou surmontable		
131/ L'antagonisme insurmontable n'existe pas		
132/ Il est possible pour une molécule d'être à la fois un agoniste et un antagoniste		
133/ Si un médicament a une affinité pour un récepteur 100 fois supérieure à son affinité pour les autres récepteurs, on parle de sélectivité du médicament pour ce récepteur		
134/ La tolérance croisée concerne des médicaments de classes pharmacologiques différentes		
135/ La tolérance est la diminution de l'effet pharmacologique d'une dose de médicament lors de l'administration répétée		
136/ La dépendance physique entraîne un état compulsif		
137/ Plus la marge thérapeutique d'un médicament est étroite, moins on a de risque de toxicité		