



Pharmacodynamie



Sommaire :

I- Introduction

II- Fonctionnement

III- Agoniste/Antagoniste

IV- Propriétés des médicaments

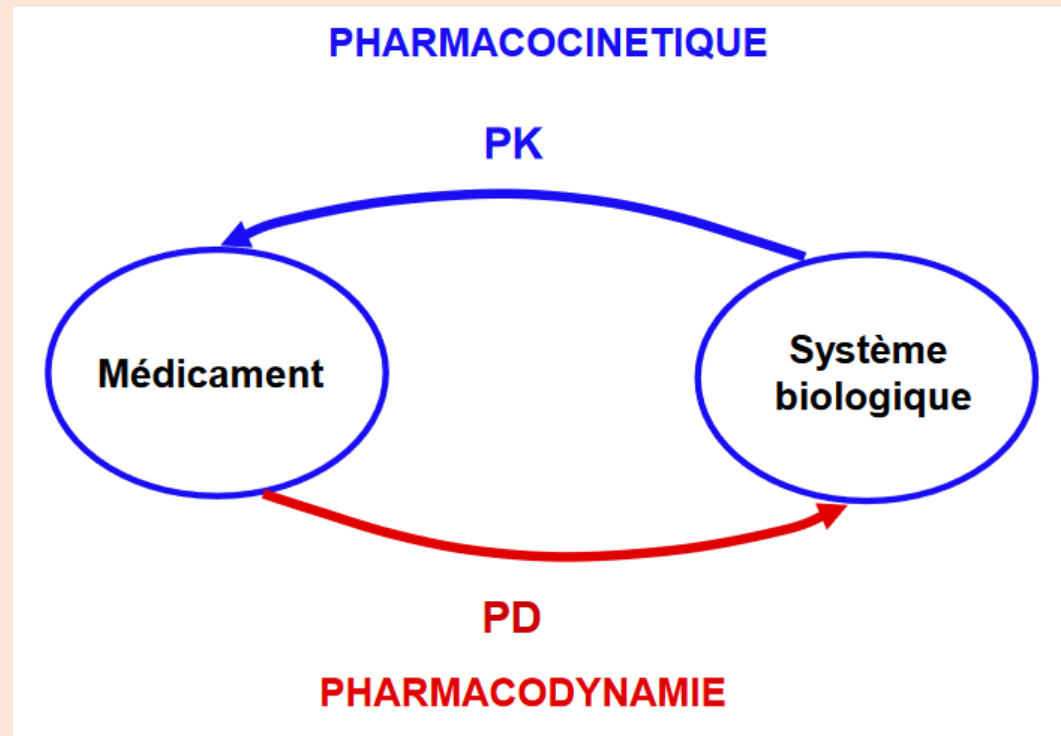
Hihi ca va être
trop bien



Rappel

Pharmacocinétique effet de l'organisme sur le médicament (ADME)

Pharmacodynamie effet du médicament sur l'organisme

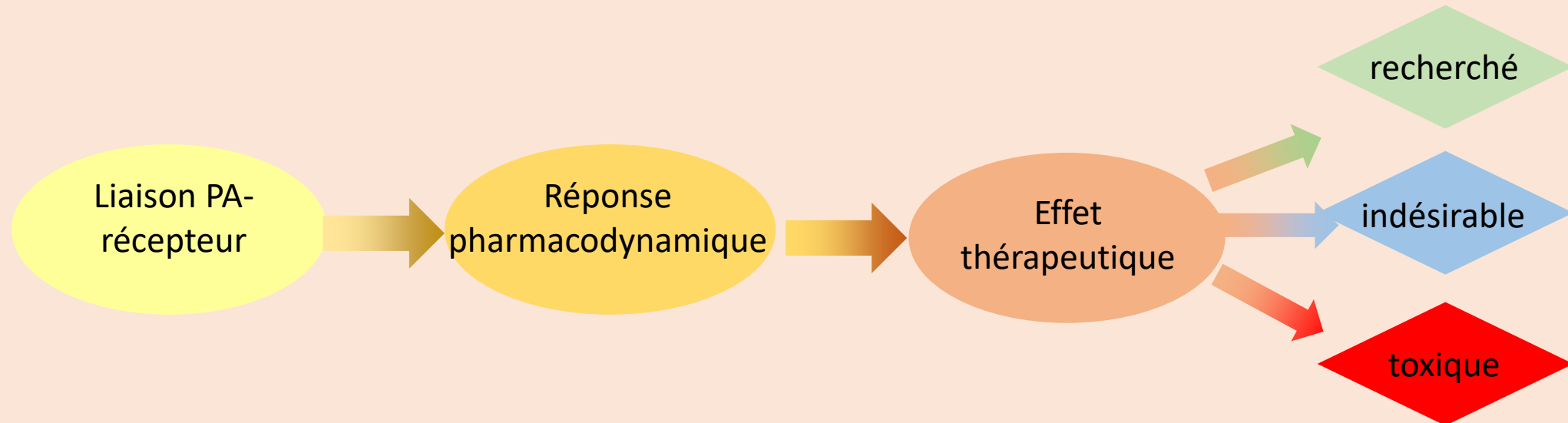


I- introduction

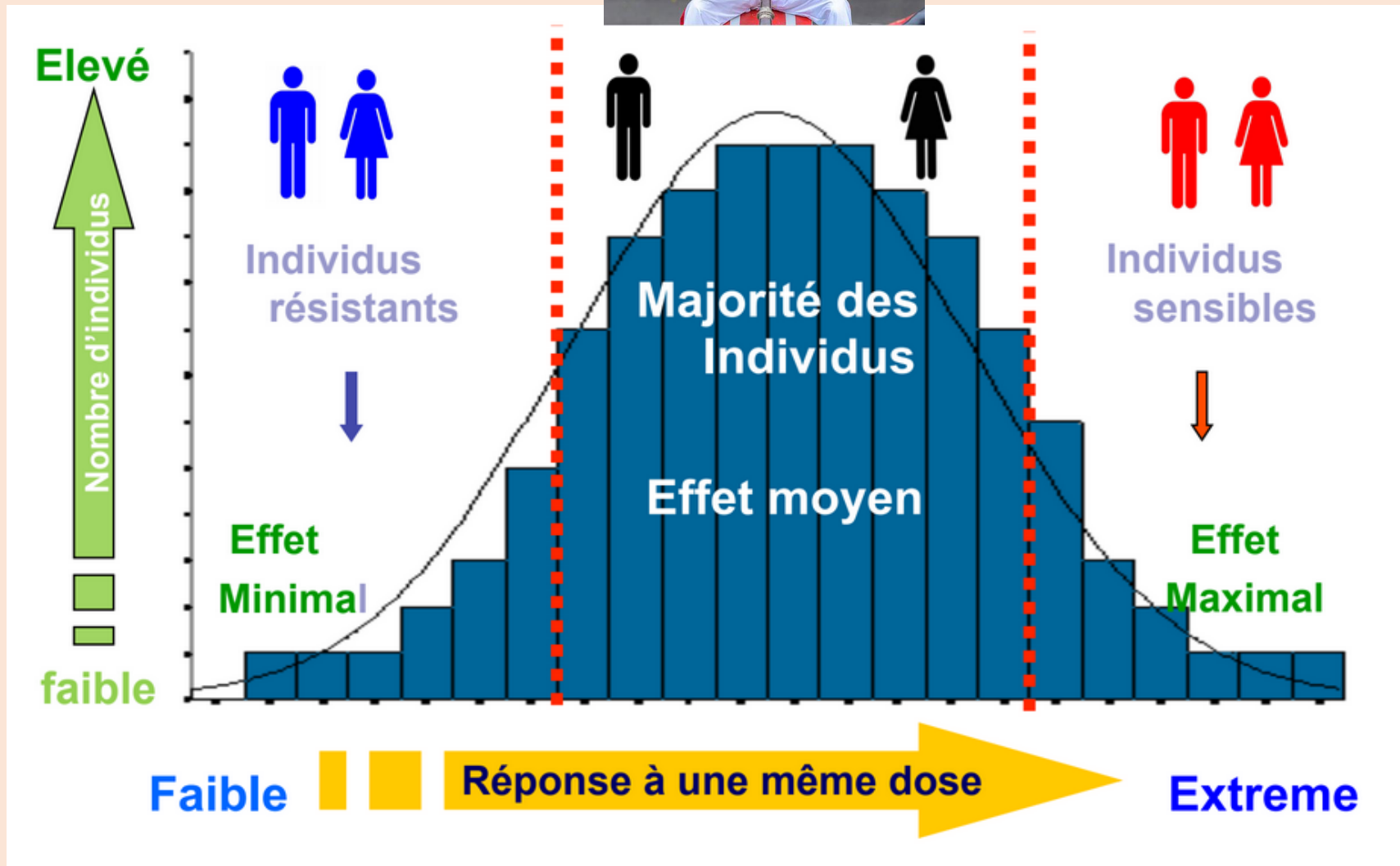
Pharmacodynamie = étude des PA et de leurs mécanismes d'action sur l'organisme

Dépendant :

- ✓ Du PA
- ✓ Des Récepteur
- ✓ Des Enzymes
- ✓ De la Structure cellulaire



Variabilité pharmacodynamique



II- Fonctionnement

Le médicament va s'adapter au récepteur selon le modèle clé-serrure



2 actions possible :



stimulation



dépression



Différents types de récepteurs

Membranaires
(intracellulaire)

Nucléaire

Transmembranaire

Amplification



Effecteur



Réponse
biologique

Se fixe sur
l'ADN



Modification
de la synthèse
des protéines

Canal ionique

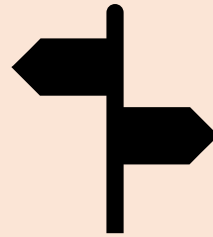
Enzyme

Protéine G

Différents types de liaison

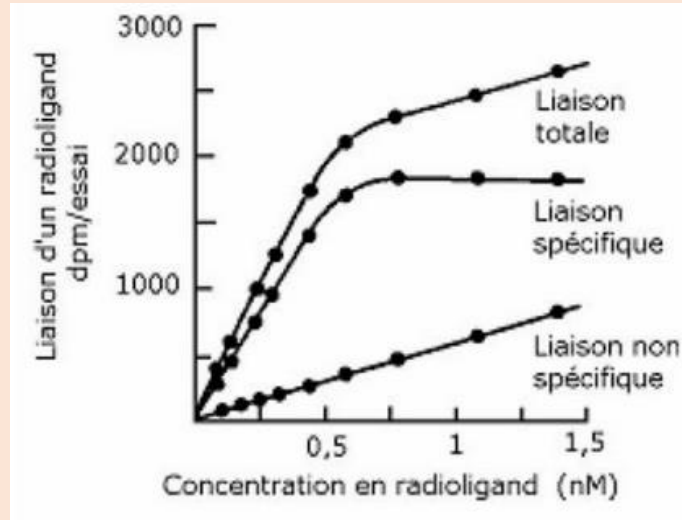
Spécifique :

Forte affinité
Saturable
Induit l'effet biologique



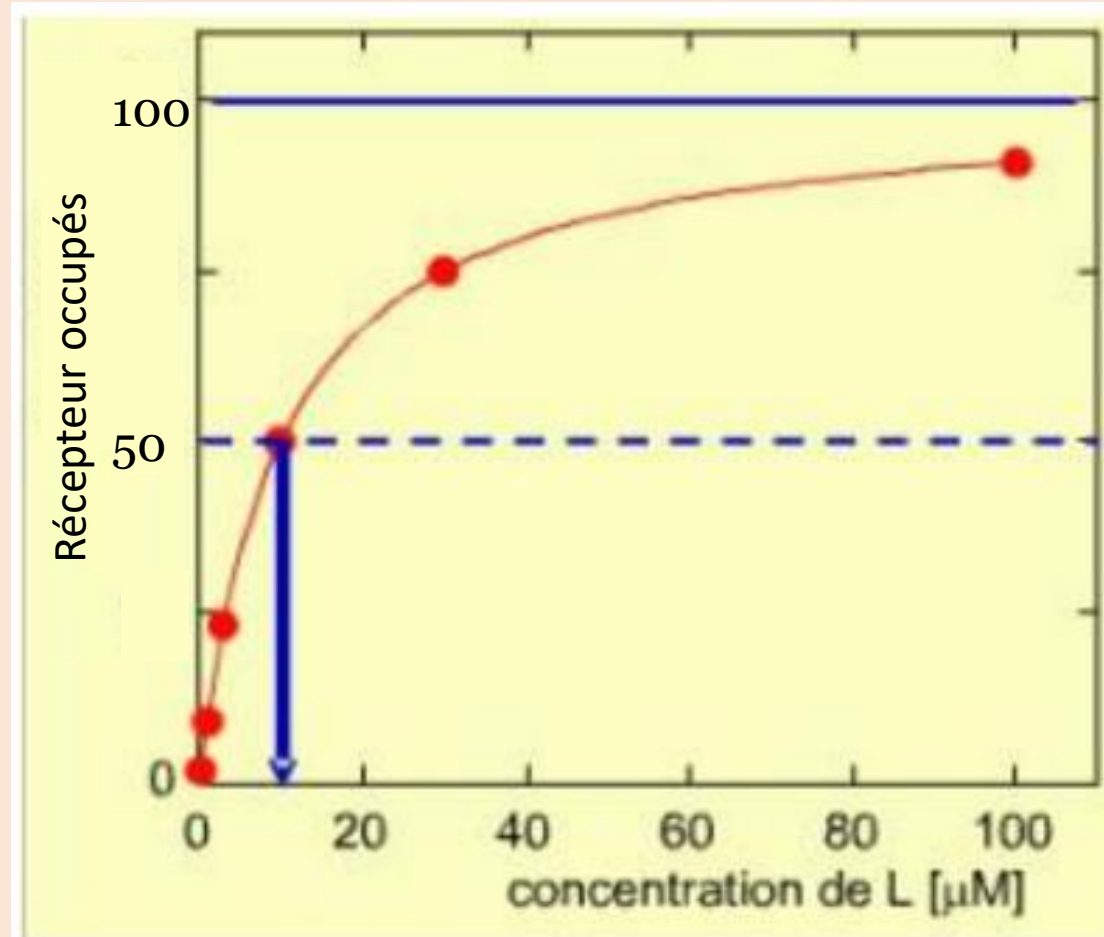
Non spécifique:

Faible affinité
Non saturable
Sans effet biologique
Possible toxicité



Constante de dissociation K_d

Concentration en ligand nécessaire pour avoir 50% des récepteurs occupés



Caractérise l'**affinité** du ligand pour le récepteur

Plus K_d est faible
Plus l'affinité est forte

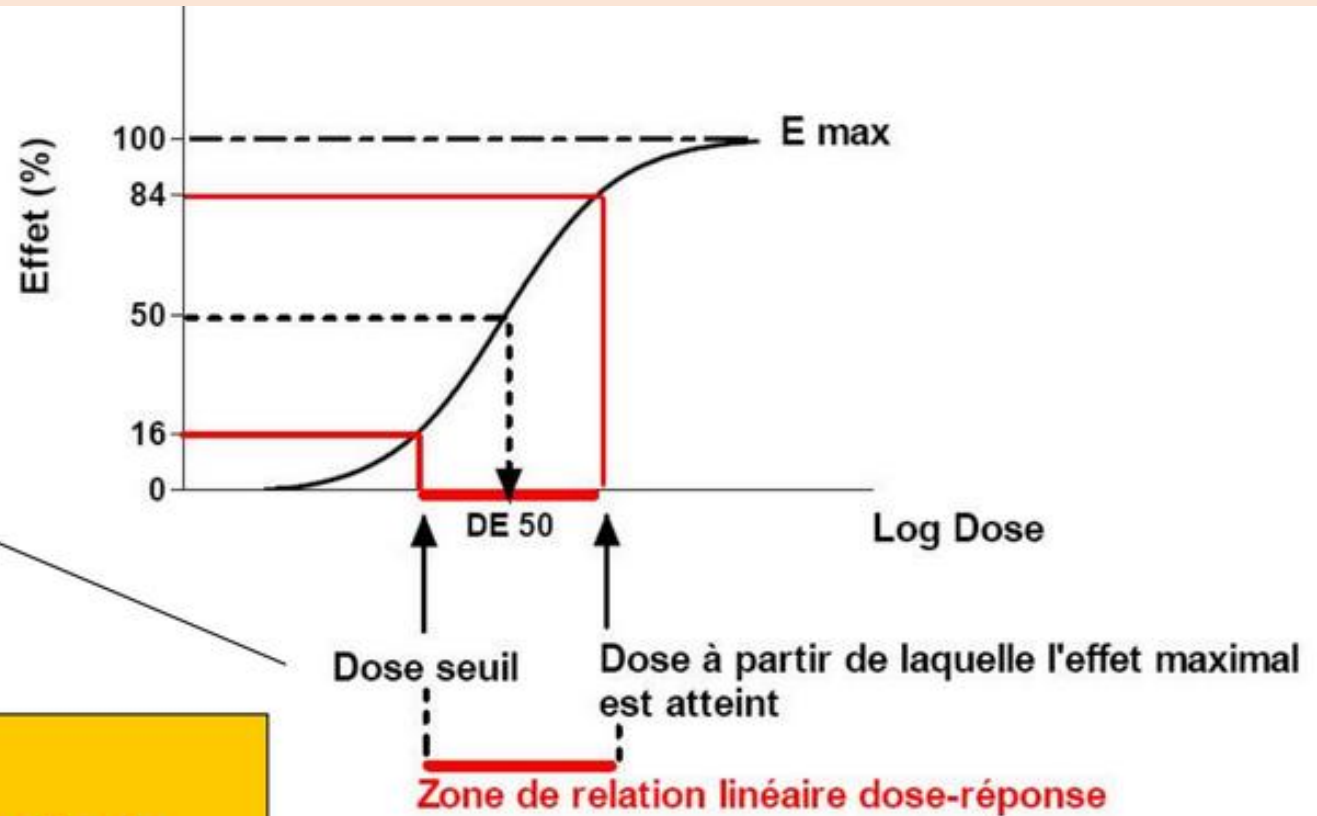


Courbe dose-réponse

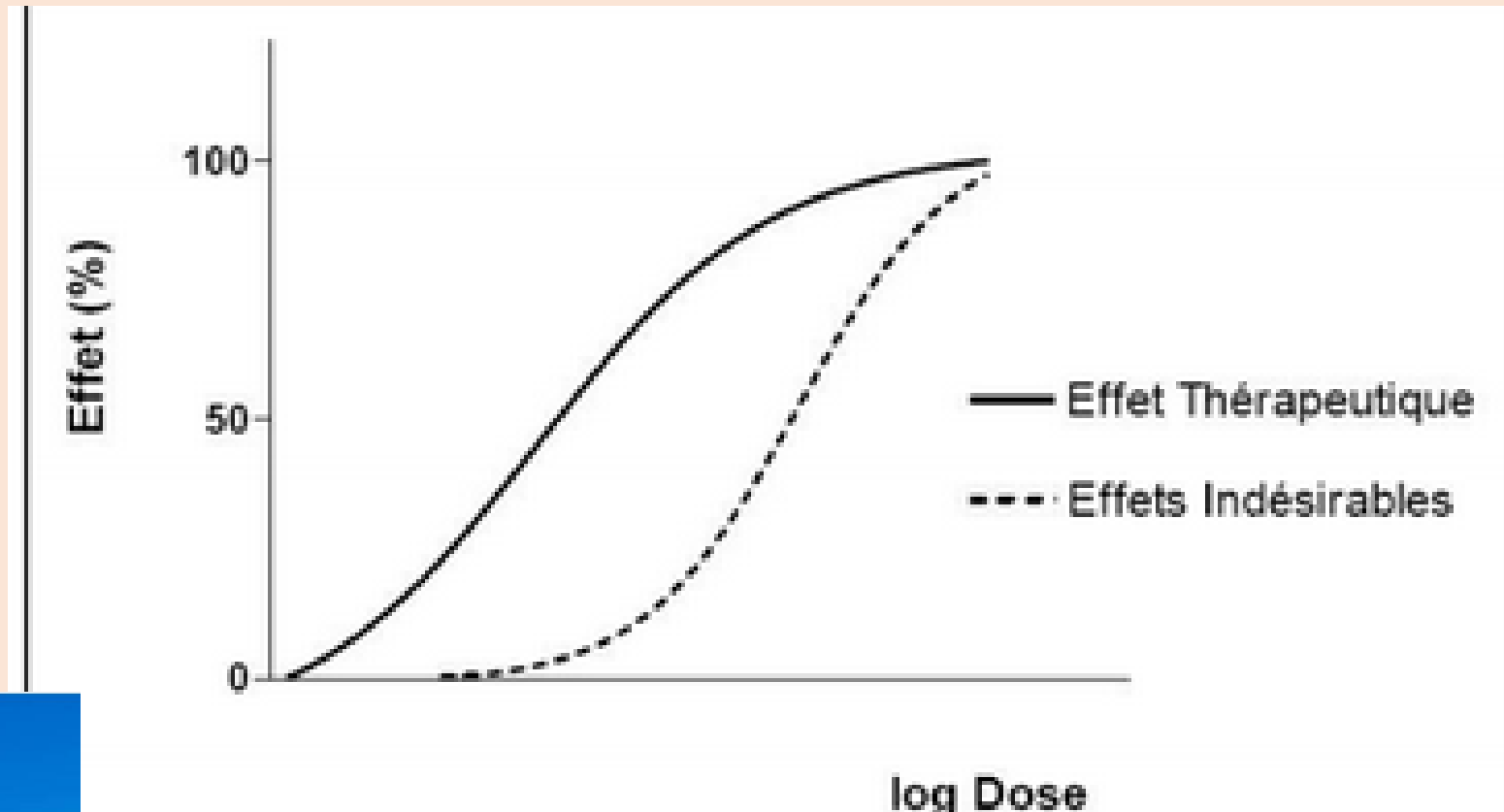
Dose seuil : dose à partir de laquelle un effet apparaît

Zone des doses efficaces :

- augmentation proportionnelle de l'effet pharmacologique avec la dose
- pente de la courbe → maniabilité du médicament



Courbe dose-réponse



III- Agoniste/Antagoniste

Agoniste

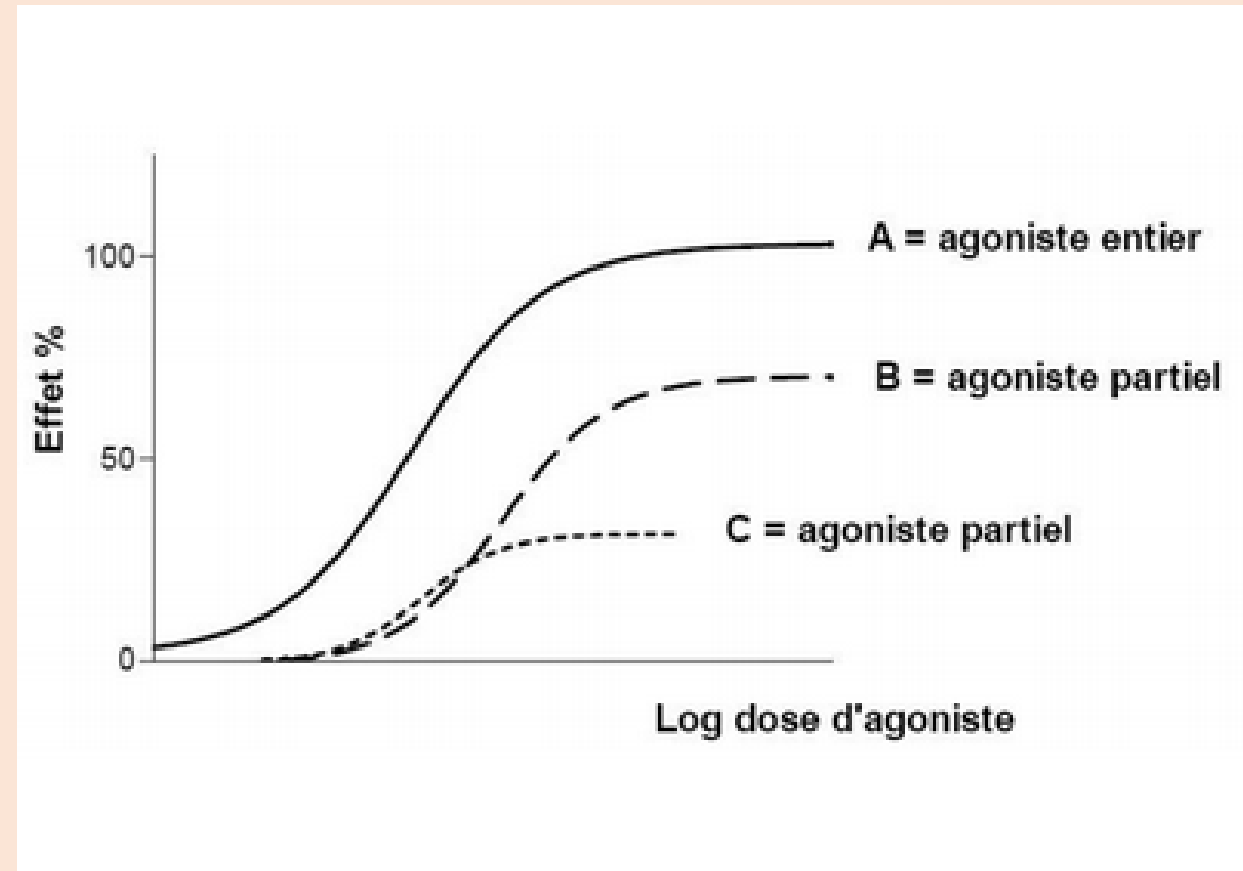
Provoque un effet **comparable** au médiateur naturel

Efficacité :

- ✓ Dépend de l'effet max

Puissance :

- ✓ Plus la concentration pour obtenir l'effet est faible
- ✓ Plus l'affinité est forte
- ✓ Plus la puissance augmente



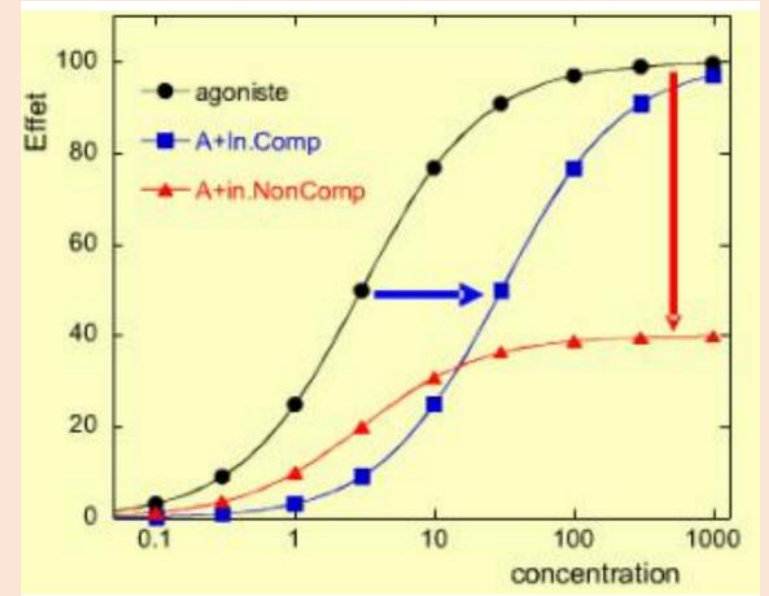
Donc classez dans l'ordre la puissance d' A B C ? L'efficacité ?

III- Agoniste/Antagoniste

Antagoniste

Ne provoque pas d'effet mais **bloque** l'action du médiateur endogène

- ✓ Compétitif : se fixe sur le même récepteur. On peut obtenir la même efficacité → **surmontable**
- ✓ Non compétitif : se fixe sur un récepteur différent. Diminution de l'effet max → **insurmontable**



Agoniste-antagoniste

Double potentialité:

- ❖ Absence du médiateur → **agoniste partiel**
- ❖ Présence du médiateur → **antagoniste**

Sélectivité

- Sélectivité d'un médicament pour un récepteur :
Affinité pour ce récepteur est 100 fois supérieure à l'affinité pour les autres récepteurs
- Sélectivité de l'effet du médicament :
La dose pour obtenir l'effet pharmacologique est 100 fois supérieure à la dose qui entraîne un effet secondaire néfaste

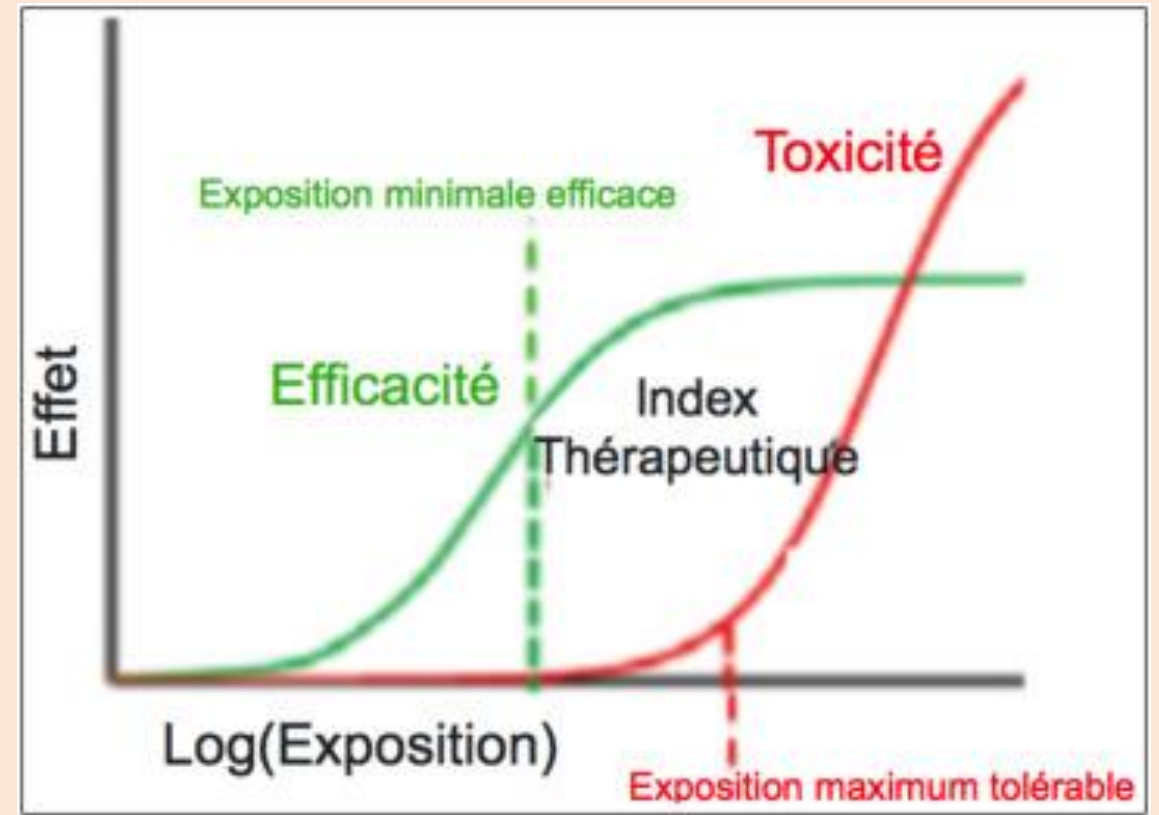
La spécificité absolue est très rare



Index thérapeutique

Gamme de concentration pour laquelle le médicament aura un maximum d'efficacité et un minimum de toxicité

- ✓ En dessous de l'index : inefficacité thérapeutique
- ✓ Au-dessus de l'index : EI graves



Variabilité

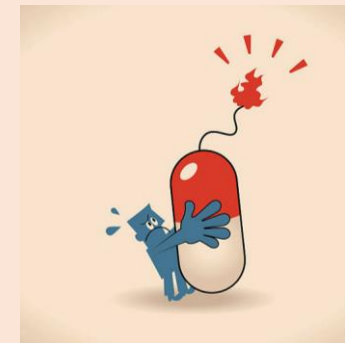
Tous les sujets ne répondent pas pareil dû à une variabilité **inter-individuelle** et **intra-individuelle**

- PK
- PD
- Réponses inhabituelles

- État physio
- État patho
- Tolérance
- ...

Tolérance

Diminution de l'effet pharmacologique lors de l'administration répétée, peut entraîner la dépendance



QCM

- A. Le récepteur membranaire agit au niveau de l'ADN.
- B. Une liaison spécifique est non saturable.
- C. K_d est atteinte quand 50% des ligands sont fixés.
- D. Une liaison non spécifique peut entraîner une toxicité.
- E. Les réponses A,B,C,D sont fausses.

QCM

A. Le récepteur membranaire agit au niveau de l'ADN.
(nucléaire)

B. Une liaison spécifique est non saturable.

C. K_d est atteinte quand 50% des ligands sont fixés.
(récepteurs occupés)

D. Une liaison non spécifique peut entraîner une toxicité.

E. Les réponses A, B, C, D sont fausses.



QCM

- A. La dose seuil est la dose à partir de laquelle un effet apparaît.
- B. Plus on augmente la dose, moins il y a d'EI.
- C. La puissance dépend de l'effet max.
- D. Un antagoniste non compétitif est surmontable.
- E. Les réponses A,B,C,D sont fausses.

QCM

A. La dose seuil est la dose à partir de laquelle un effet apparaît.

B. Plus on augmente la dose, moins il y a d'EI.

C. La puissance dépend de l'effet max. (l'efficacité)

D. Un antagoniste non compétitif est surmontable.
(insurmontable)

E. Les réponses A, B, C, D sont fausses.



FINI

Bravo à vous et bonne chance !!