

# Pharmacodynamie



# Sommaire :

I- Introduction

II- Fonctionnement

III- Agoniste/Antagoniste

IV- Propriétés des médicaments

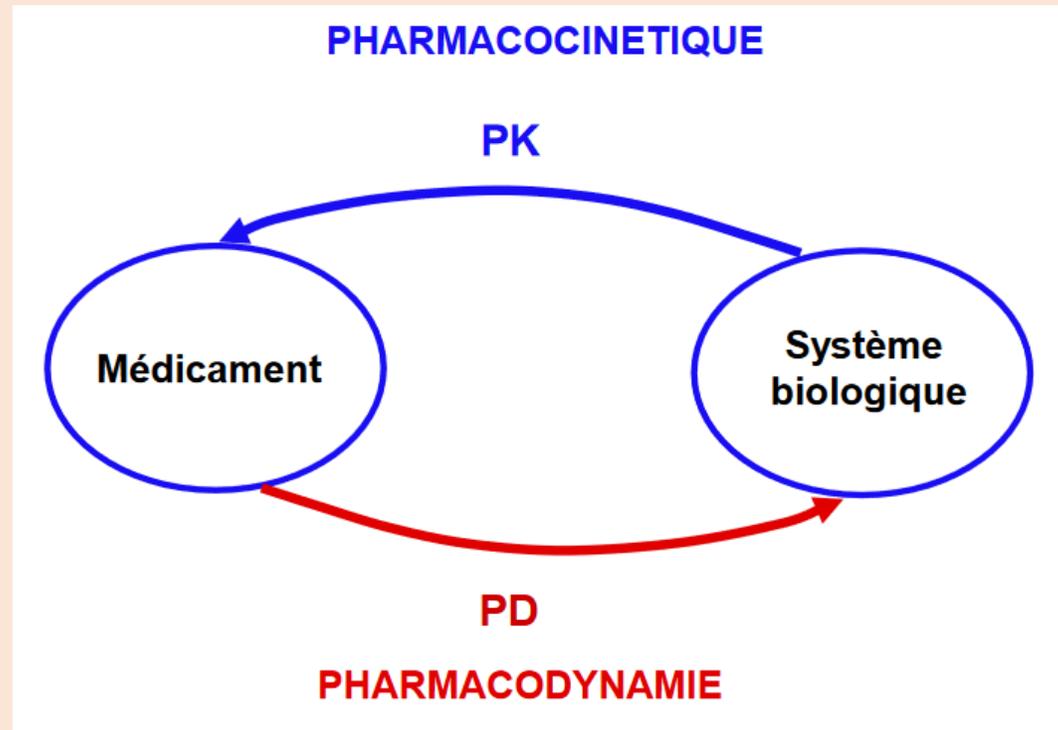
Hihi ca va être  
trop bien



## Rappel

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

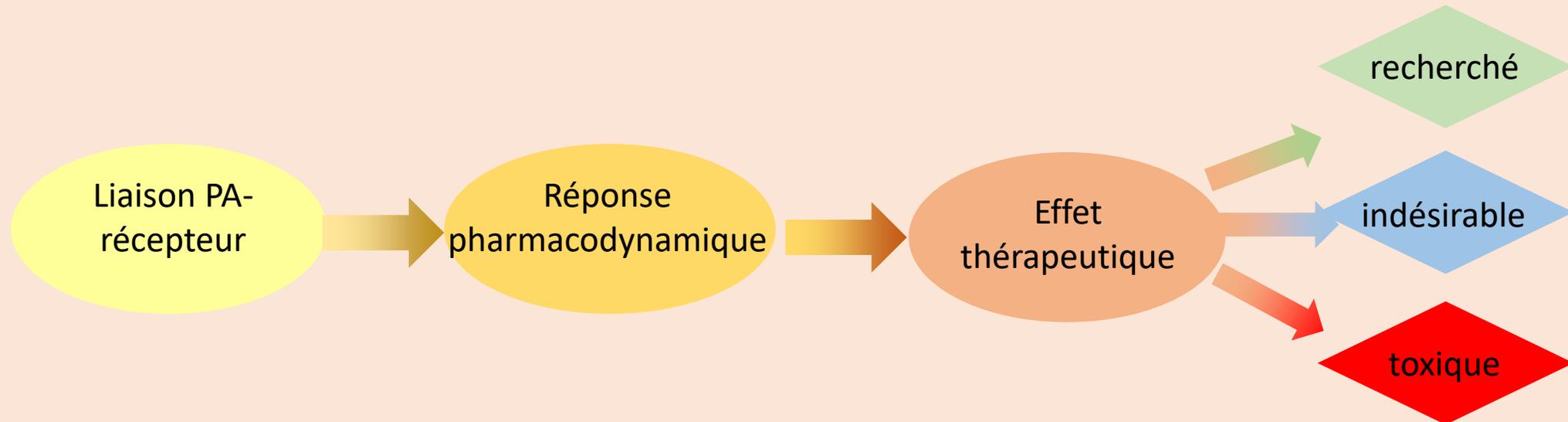
**Pharmacodynamie** effet du médicament sur l'organisme



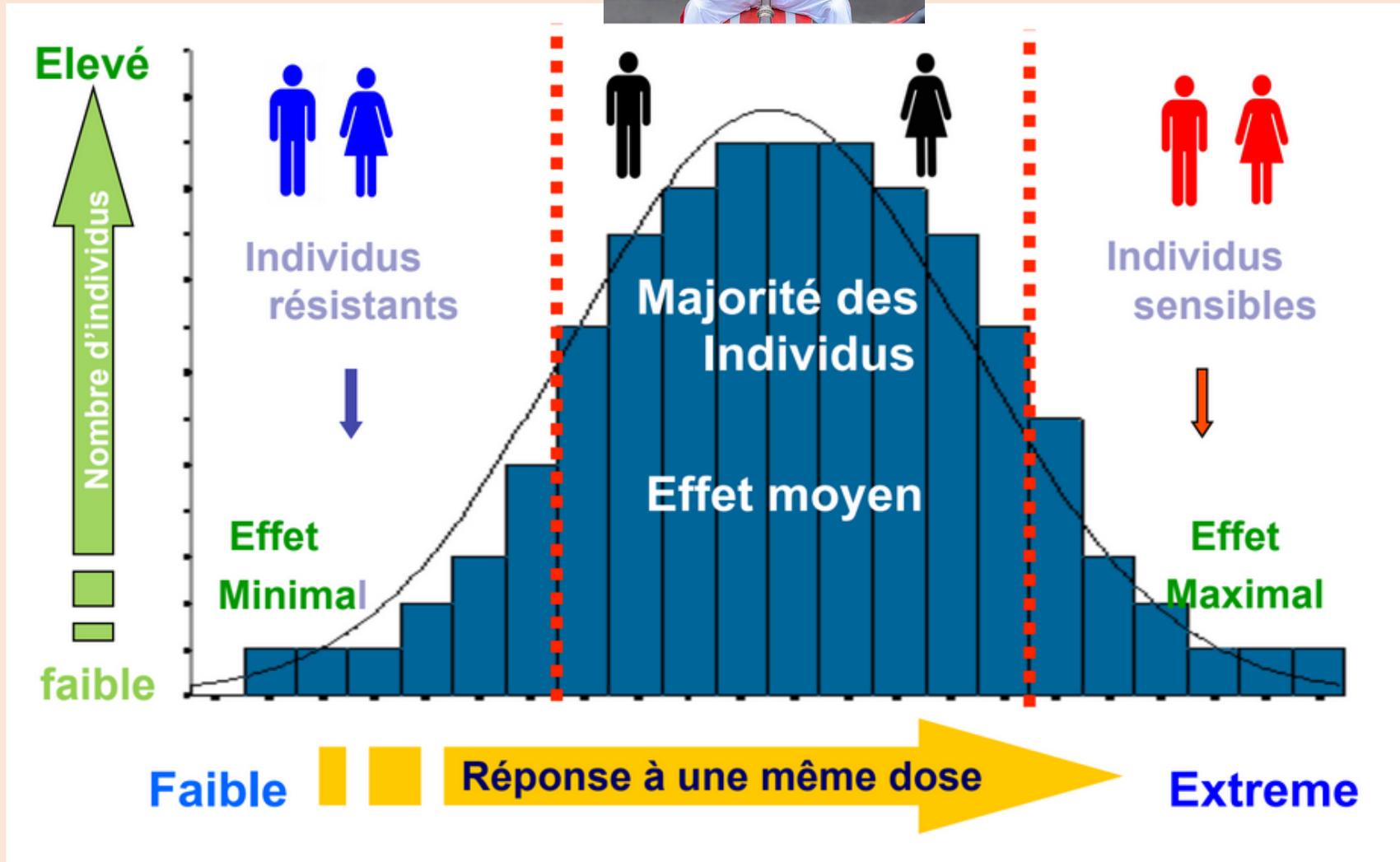
**Pharmacodynamie** = étude des PA et de leurs mécanismes d'action sur l'organisme

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



Amplification



Effecteur



Réponse  
biologique

Se fixe sur  
l'ADN



Modification  
de la synthèse  
des protéines

Canal ionique

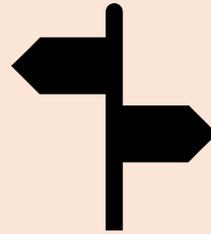
Enzyme

Protéine G

## Différents types de liaison

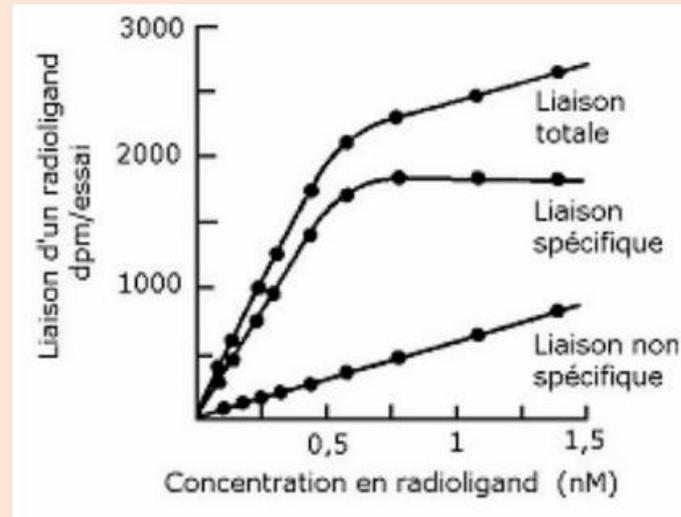
Spécifique :

Forte affinité  
Saturable  
Induit l'effet biologique



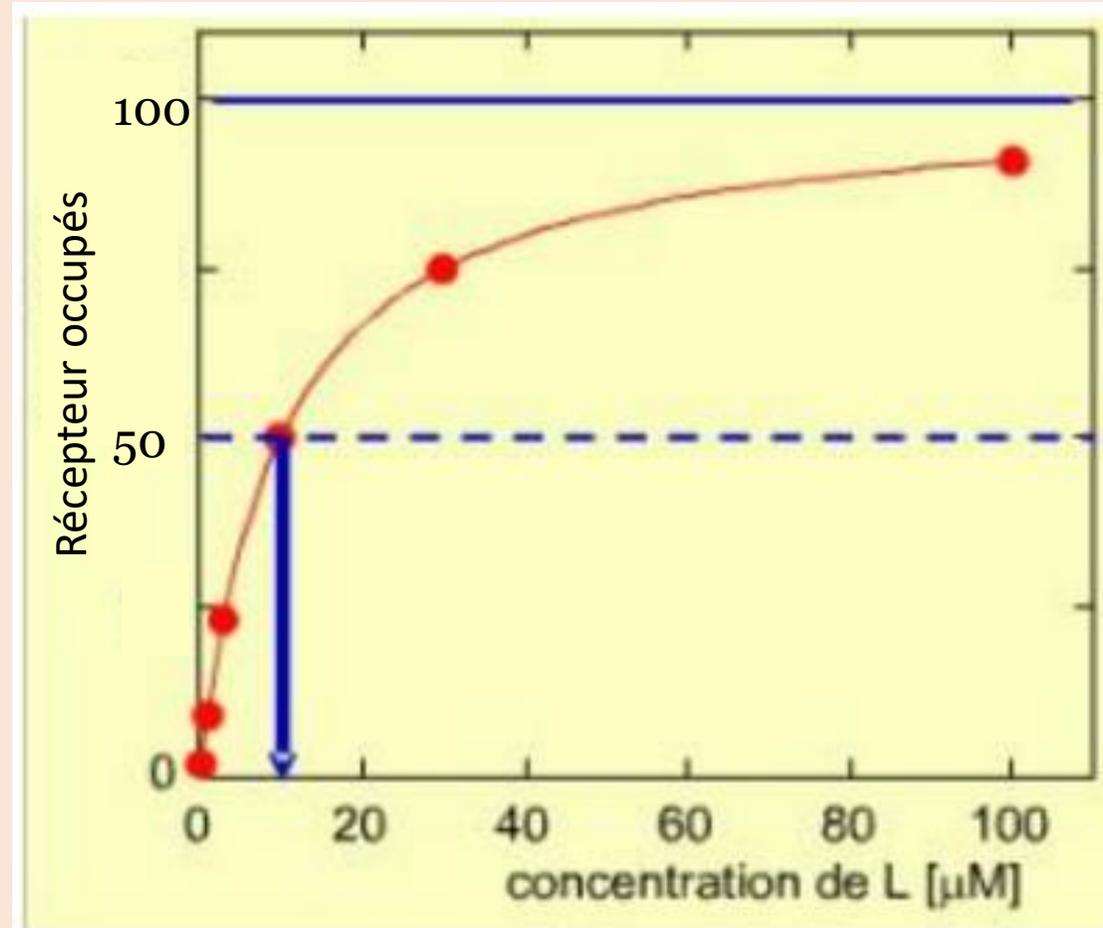
Non spécifique:

Faible affinité  
Non saturable  
Sans effet biologique  
Possible toxicité



## Constante de dissociation $K_d$

Concentration en ligand nécessaire pour avoir 50% des récepteurs occupés



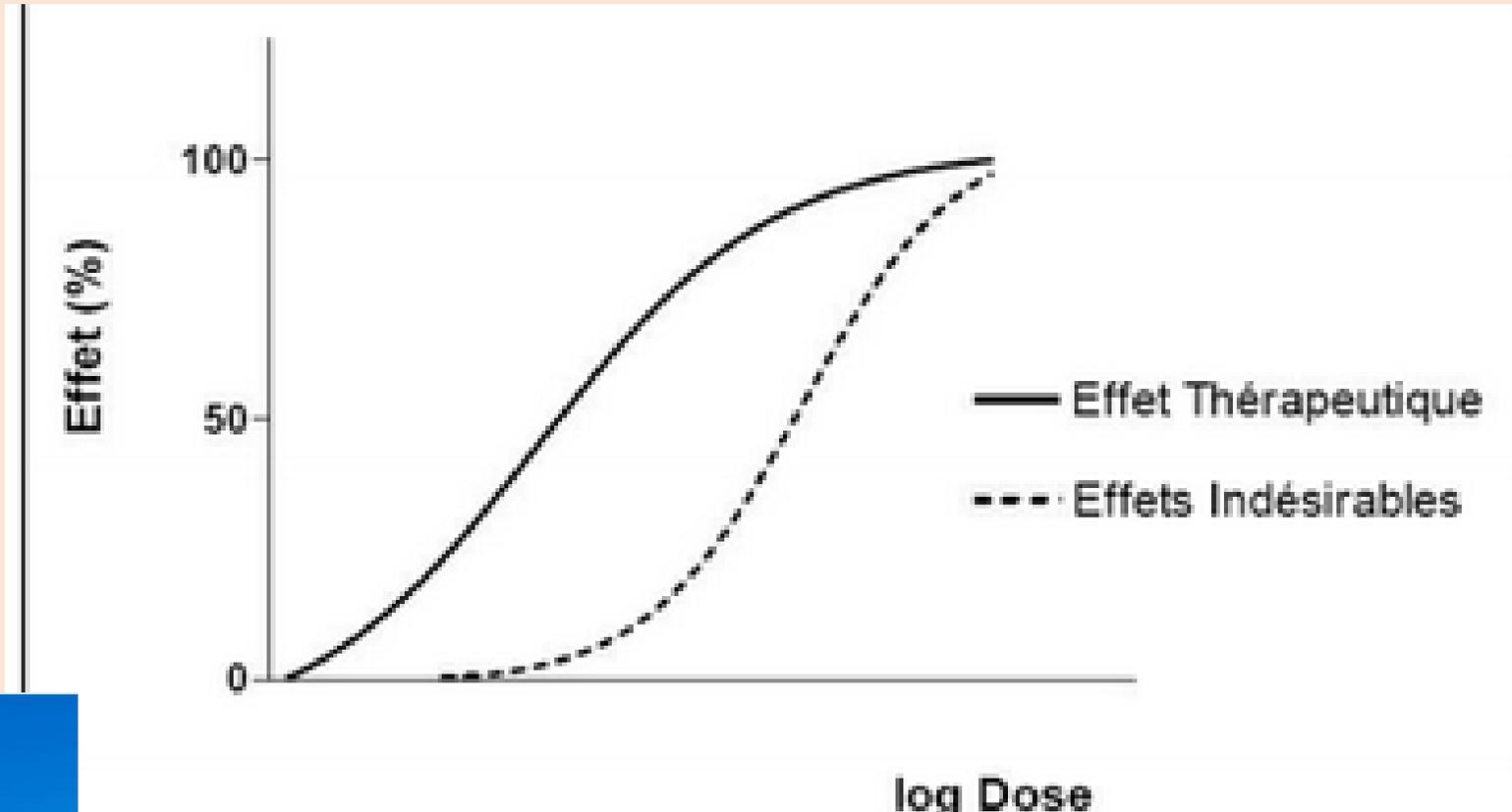
Caractérise l'**affinité** du ligand pour le récepteur

Plus  $K_d$  est faible  
Plus l'affinité est forte





## Courbe dose-réponse



# Agoniste

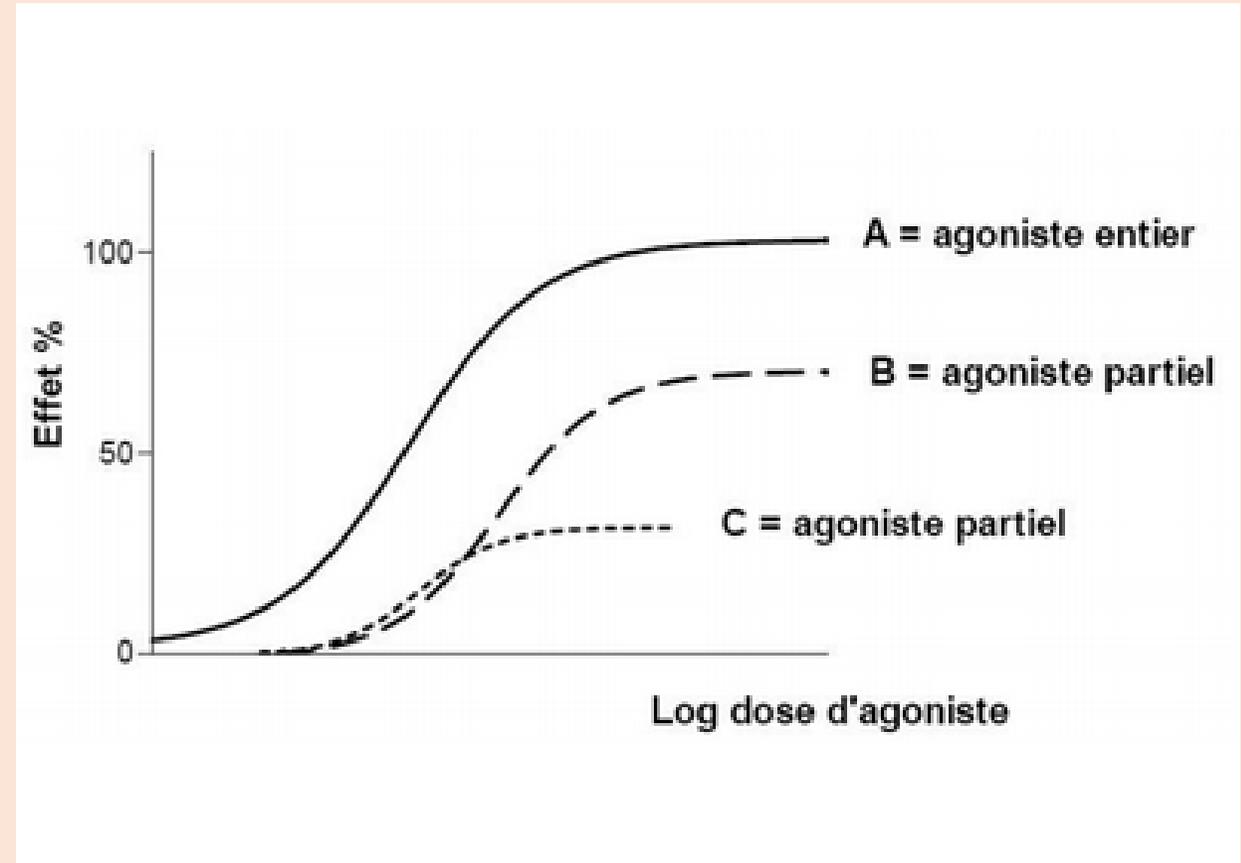
Provoque un effet **comparable** au médiateur naturel

## 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

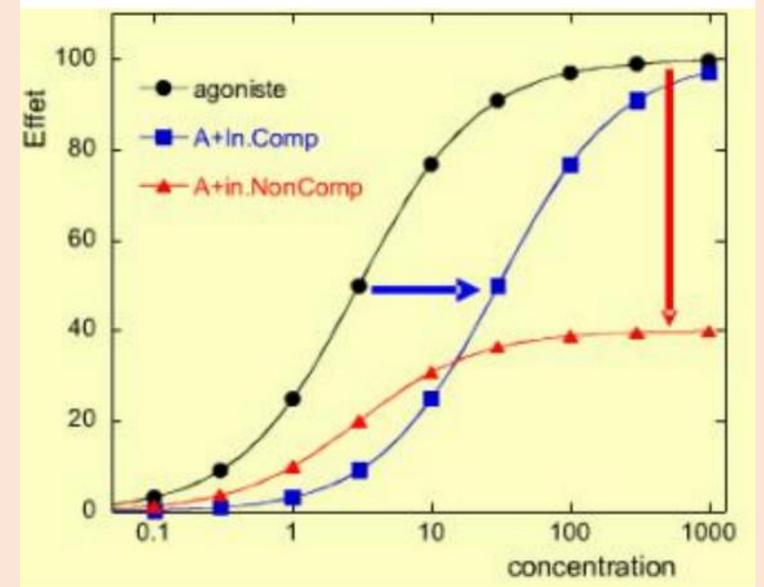


Donc classez dans l'ordre la puissance d' A B C ? L'efficacité ?

## 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

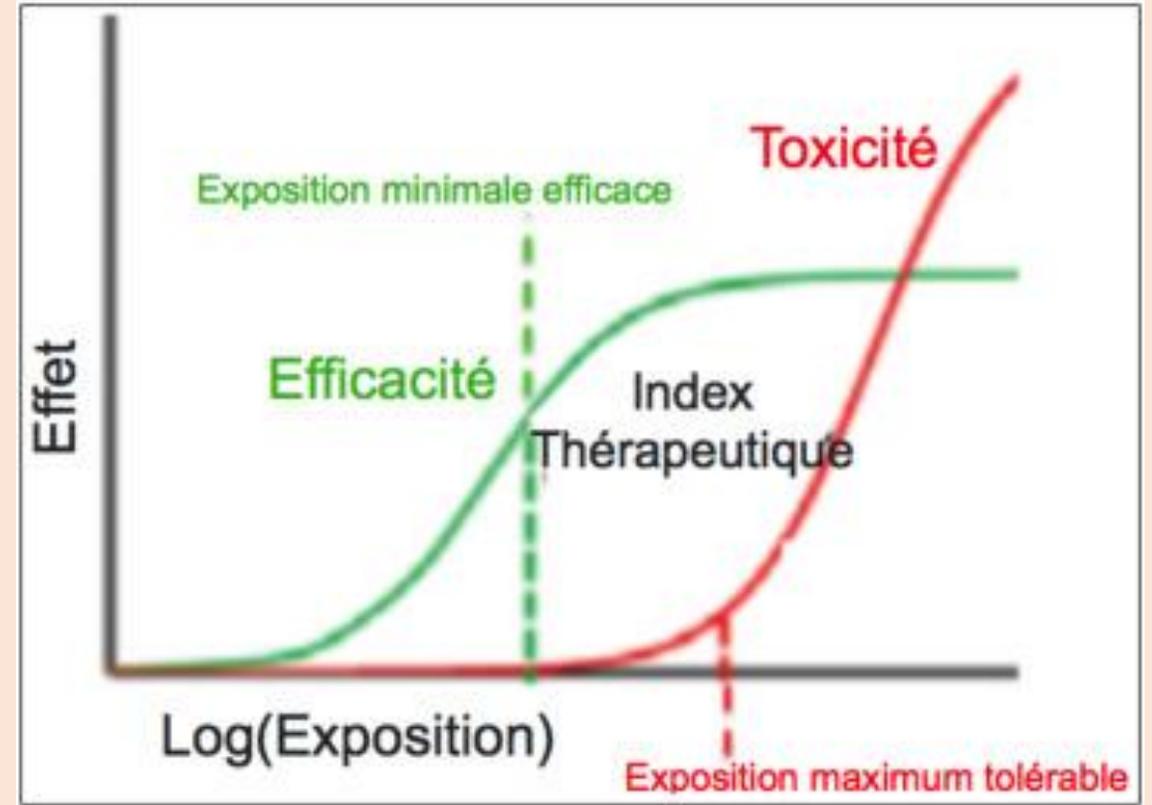
La spécificité absolue est très rare



## 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

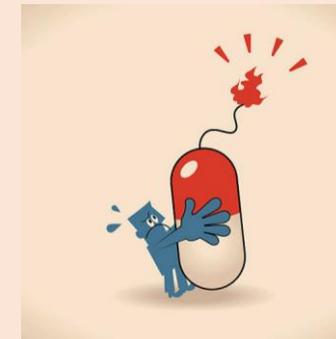
Tous les sujets ne répondent pas pareil dû à une variabilité **inter-individuelle** et **intra-individuelle**

- 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 !!

