

# PHARMACODYNAMIQUE



**Fonctionnement simple** : clé-serrure. On peut avoir des actions **agoniste** (stimulation ou potentialisation) ou **antagoniste** (suppression). Par exemple pour un patient souffrant d'hypotension on lui prescrit un agoniste pour stimuler la tension. A l'inverse pour une hypertension c'est un antagoniste pour faire baisser la pression.

On étudie les interactions ne tenant compte des différents types de récepteurs et des caractéristiques de la liaison. **Et on le fait à travers des courbes dose-réponse, agoniste/antagoniste, sélectivité, variabilité de la réponse et notion de la marge thérapeutique.**

Les différents types de récepteurs : protéines dans la membrane cellulaire ou à l'intérieur de la cellule.

- ♥ Récepteur nucléaire : à l'intérieur de la cellule et fixation sur l'ADN après liaison pour modifier la synthèse de protéine
- ♥ Récepteur transmembranaire :
  - Canal ionique
  - Couplé aux protéines G : seconds messagers
  - Couplé à une enzyme

Liaison entre le médicament et le récepteur qui est réversible peut-être :

- ♥ Spécifique : forte affinité, induit effet et saturable
- ♥ Non spécifique : faible affinité, pas d'effet, non saturable

Les facteurs de variabilité peuvent être une **diminution du nombre de récepteur** (down régulation), **augmentation du nombre de pompe d'efflux** (up régulation), **modification dues à une désensibilisation** (génétique ou acquise).

Sur les courbes dose-réponse on a une dose seuil, une dose efficace 50 (50% de l'effet) et une dose maximale qui si elle est dépassée entraîne des effets toxiques. Plus la pente est faible plus le mdc est maniable.

Un mdc agoniste est un mdc qui provoque un effet qui sera le même que le médiateur naturel lors de sa liaison. Il peut-être pur/entier en donnant l'effet maximum ou partiel. Si l'affinité augmente, la puissance augmente ;

Un mdc antagoniste est une substance qui se lie à un récepteur spécifique sans provoquer d'effet mais qui bloque l'action du médiateur endogène (empêche sa liaison au récepteur). Il peut être compétitif (même site que l'endogène → réversible) ou non (diminution affinité et effet → irréversible).

Sélectivité : mdc → action → effet → utilité, elle n'est pas absolue souvent. Il est sélectif si l'affinité est 100 fois supérieure à l'affinité pour les autres récepteurs.

Rapport efficacité/toxicité : due à des facteurs pk, PD, idiosyncratiques ou allergiques. Mais aussi à une variabilité intra-individuelle : état physiologique, pathologique, interaction médicamenteuse, sensibilité réceptorielle et les effets du mdc.

Tolérance : diminution de l'effet par habitude, on doit augmenter les doses.

Dépendance : syndrome de sevrage lors de l'arrêt du traitement.

Enooooorme dédié à mes co-tuts, mes potes qui m'ont supporté à finir cette fiche dans la voiture, et votre tutrice de biophy emilie ma sauveuse <3