



TUTORAT UE 6 2015-2016 – Initiation à la connaissance du médicament Séance n°4 – Semaine du 07/03/2016

Pharmacodynamie M.Petit

Séance préparée par la team UE6+ MAPS

QCM n°1 : Généralités sur les récepteurs.

- A. Un récepteur peut être une structure protéique macromoléculaire.
- B. Un médicament interagit de façon spécifique et irréversible avec un récepteur.
- C. Il y a une réponse active si la structure chimique du ligand est reconnue par le site récepteur.
- D. Une réponse active induit forcément une excitation.
- E. Le taux de reconnaissance d'un médicament par un récepteur définit l'activité intrinsèque.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°2 : L'action d'un médicament sur un récepteur :

- A. Est indépendante de l'affinité pour ce récepteur.
- B. Peut être saturable.
- C. Se fait en trois temps : reconnaissance, transmission, amplification.
- D. Déclenche une réponse biologique spécifique soit inhibitrice soit excitatrice.
- E. Déclenche une réponse biologique toujours active.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°3 : Concernant la pharmacodynamie. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. Elle étudie les relations entre quantité de principe actif et la grandeur de l'effet engendré.
- B. Elle étudie seulement les effets sur une population et pas sur les individus.
- C. L'effet graduel ou loi normale de probabilité se base sur un modèle statistique.
- D. L'effet quantal ou loi d'action de masse se base sur un modèle physico-chimique.
- E. Les deux modélisations sont des outils d'étude de la pharmacodynamie.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°4 : Concernant l'effet graduel. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. On considère que l'agoniste se lie de manière réversible sur le récepteur.
- B. L'effet sera directement proportionnel au taux d'occupation des récepteurs.
- C. A l'équilibre réactionnel les constantes de vitesse K_1 et K_{-1} sont égales.
- D. Le K_d correspond à la constante de dissociation ou concentration en ligand nécessaire à l'occupation de tous les récepteurs.
- E. L'affinité d'un ligand pour son récepteur est proportionnelle au K_d .
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°5 : Concernant la relation concentration/effet. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. La liaison du ligand sur son récepteur entraîne toujours un effet direct.
- B. L'effet dépend de l'activité intrinsèque ε du principe actif.
- C. Si K_d augmente, la concentration de ligand nécessaire pour occuper la moitié des récepteurs augmente également.
- D. L'effet graduel évolue de manière binaire.
- E. L'étude de l'effet quantal permet de déterminer la CE_{50} .
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°6 : Concernant la relation concentration/effet. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. CE_{50} et K_d varient dans le même sens.
- B. CE_{50} est la concentration d'agoniste qui produit 50% de l'effet maximal.
- C. $1/CE_{50}$ représente l'efficacité d'un agoniste.
- D. L'activité intrinsèque varie de 0 à 10.
- E. La puissance de l'agoniste est inversement proportionnelle à l'efficacité.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°7 : Concernant l'effet quantal de la relation concentration/effet. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. La variable évolue en mode binaire selon une loi d'action de masse.
- B. La DE_{50} correspond à la dose provoquant 50% de l'effet maximal.
- C. La distribution de la fréquence de réponse en fonction du logarithme de la dose est représentée par une courbe de Gauss.
- D. Un individu hyporéactif à un traitement se situe à gauche de la courbe de Gauss.
- E. Un individu hyperréactif à un traitement va présenter la réponse à faible dose.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°8 : Concernant la pharmacodynamie. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. La puissance évolue dans le sens inverse des concentrations.
- B. Un antagoniste, ayant une activité intrinsèque nulle, n'est à l'origine d'aucun effet.
- C. L'affinité dépend des liaisons mises en jeu entre le ligand endogène et le récepteur.
- D. Le pA_2 représente le logarithme décimal de la puissance.
- E. Une plus grande puissance est gage d'une meilleure tolérance clinique.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°9 : Concernant les paramètres quantitatifs en pharmacodynamie. Choisir la ou les proposition(s) exactes.

- A. L'efficacité est directement liée à l'activité intrinsèque de l'agoniste.
- B. La puissance est l'inverse de l'efficacité.
- C. Une meilleure puissance permet une meilleure tolérance clinique.
- D. Le pD_2 est le logarithme décimal de la puissance.
- E. Plus un agoniste est puissant, plus il est efficace.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°10 : Concernant la puissance d'un agoniste. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. La puissance est l'inverse de la concentration molaire produisant 50% de l'effet maximal.
- B. Le CE_{50} est le logarithme décimal négatif du pD_2 .
- C. Si un agoniste A1 a un $pD_2 = 9$ et un agoniste A2 avec un $pD_2 = 12$ alors A2 est 30 fois plus puissant que A1.
- D. Si un agoniste A1 avec un $CE_{50} = 10^{-12}$ mM et A2 avec un $pD_2 = 11$ alors A1 est 10 fois plus puissant que A2.
- E. La puissance seule permet d'affirmer un avantage thérapeutique.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°11 : Concernant les paramètres pharmacodynamiques. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. Un antagoniste pur a une activité intrinsèque non nulle.
- B. Un agoniste partiel a une activité intrinsèque comprise entre 0 et 1.
- C. La réponse de la liaison d'un récepteur à un antagoniste est active.
- D. Un agoniste partiel peut se comporter comme un antagoniste.
- E. L'antagoniste compétitif se lie sur un site différent de celui de l'agoniste.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°12 : Concernant les paramètres pharmacodynamiques. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. L'interaction entre l'antagoniste et le récepteur entraîne directement une diminution de l'action biologique.
- B. Selon les conditions, un antagoniste peut se comporter comme un agoniste partiel.
- C. Un antagoniste pur a une activité intrinsèque comprise entre 0 et 1.
- D. La CI_{50} correspond à la concentration de l'antagoniste qui inhibe 50% de l'effet de l'agoniste de référence.
- E. L'effet fonctionnel fait directement suite à la réponse biologique.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°13 : Concernant les analgésiques morphiniques. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. Ils se fixent sur les récepteurs opioïdes μ .
- B. Si la buprénorphine était prescrite en même temps que la morphine elle diminuerait son effet analgésique.
- C. Buprénorphine et morphine peuvent être associées dans certains cas.
- D. La prise de naloxone chez un sujet sous morphine depuis un certain temps entraîne des signes de sevrage.
- E. La morphine peut entraîner des risques de dépression respiratoire.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°14 : Concernant l'antagonisme compétitif. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. La courbe concentration/effet est déplacée vers la droite par l'antagoniste.
- B. Le pA_2 est le logarithme négatif de la concentration molaire de l'antagoniste qui oblige à doubler la concentration de l'agoniste pour obtenir le même effet.
- C. L'effet pourra dans certains cas être maximal même en présence d'un antagoniste.
- D. L'antagoniste se fixe sur un site distinct du site liant l'agoniste.
- E. Un antagoniste compétitif pur a une activité intrinsèque non nulle.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°15 : Un antagoniste allostérique :

- A. Se lie sur le même site que l'agoniste.
- B. Est aussi appelé antagoniste compétitif.
- C. Empêche la liaison de l'agoniste.
- D. Permet à l'agoniste d'atteindre son effet maximum.
- E. Peut être délogé du site de fixation par l'augmentation de la concentration de l'agoniste.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°16 : Concernant la sélectivité. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. Elle correspond au rapport d'affinité d'une molécule pour deux cibles moléculaires.
- B. Les cibles peuvent être des isoformes d'une enzyme.
- C. C'est une notion relative.
- D. L'affinité et la sélectivité varient dans le même sens.
- E. Au numérateur on place la cible pour laquelle le Kd est le plus grand.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°17 : Concernant la marge thérapeutique. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. Elle est représentée par la courbe concentration-effet de l'agoniste.
- B. Elle est aussi appelée sélectivité d'effet.
- C. Elle permet d'optimiser le rapport bénéfice/risque.
- D. Une marge thérapeutique large nécessite obligatoirement un suivi thérapeutique pharmacologique.
- E. L'administration d'un médicament dans l'intervalle de la marge thérapeutique n'entraîne jamais d'effet secondaire.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°18 : Concernant la marge thérapeutique. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. Elle étudie la relation de l'effet utile et de l'effet toxique en fonction de la dose administrée.
- B. Une marge thérapeutique étroite correspond à un effet bénéfique élevé pour un effet toxique nul.
- C. Elle est sous-tendue par le rapport de ses affinités pour la cible responsable de l'effet bénéfique et pour la cible responsable de l'effet toxique.
- D. L'administration d'une dose inférieure aux doses comprises dans la marge thérapeutique risque d'entraîner des effets toxiques.
- E. La marge thérapeutique n'a aucun intérêt en pratique clinique.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°19 : Lors de l'administration prolongée d'un agoniste β_2 adrénergique chez un sujet asthmatique. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. Il y a blocage soutenu par un agoniste.
- B. On observe une hypersensibilisation.
- C. Il y a augmentation du nombre de récepteurs.
- D. Dans certains cas, une tolérance à l'action bronchodilatatrice peut être observée.
- E. La tolérance se traduit par une stimulation excessive des récepteurs à l'arrêt du médicament.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°20 : A propos de la régulation des récepteurs. Choisir la ou les proposition(s) exacte(s).

- A. Elle induit une modulation dans le temps de l'effet du médicament.
- B. La tolérance peut se produire lorsqu'un mécanisme de downregulation est mis en jeu.
- C. L'hypersensibilisation entraîne un découplage fonctionnel entre récepteur et système effecteur.
- D. L'hypersensibilisation provoque une augmentation du nombre de récepteurs.
- E. Il peut être dangereux d'arrêter subitement un traitement de longue durée par antagoniste.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.