

TUTORAT UE 6 2013-2014 – Pharmacologie

Séance n°4 – Semaine du 10/03/2014

Cibles et mécanismes d'action des médicaments **Cros**

Séance préparée par la team UE6 + MAPS

QCM n°1 : Les récepteurs membranaires :

- A. sont la cible de 50% des médicaments.
- B. sont des glycoprotéines.
- C. changent de conformation suite à la liaison d'un ligand agoniste.
- D. peuvent lier un antagoniste neutre.
- E. peuvent être la cible d'anticorps monoclonaux utilisés en thérapeutique.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°2 : Les protéines G de type Gs :

- A. sont trimériques.
- B. se dissocient en 3 sous-unités indépendantes lors de leur activation.
- C. ont une activité GTPase portée par la sous-unité bêta.
- D. sont actives lorsqu'elles sont liées à du GDP.
- E. peuvent inhiber l'adénylate cyclase.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°3 : Les récepteurs muscariniques régulant la contractilité musculaire lisse :

- A. entraînent la contraction des fibres musculaires lisses après liaison de l'acétylcholine.
- B. peuvent induire une inhibition de l'adénylate cyclase après liaison de l'acétylcholine.
- C. sont la cible de médicaments anti-asthmatiques.
- D. peuvent être activés par les médicaments dont le suffixe est -térol.
- E. peuvent être la cible de médicaments dont le suffixe est -olol.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°4 : Les récepteurs à activité guanylate cyclase :

- A. sont des protéines qui agissent sous forme de tétramères.
- B. sont couplés à l'adénylate cyclase.
- C. peuvent induire la production de GMPcyclique (GMPc) à partir de GTP.
- D. peuvent être activés par des entérotoxines bactériennes.
- E. sont la cible de médicaments dont le suffixe est -mab.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°5 : Les récepteurs à activité tyrosine kinase :

- A. peuvent être activés par l'hormone de croissance GH.
- B. peuvent être inhibés par des médicaments anticancéreux.
- C. nécessitent tous une étape de dimérisation pour être activés.
- D. sont désactivés par des tyrosines phosphatases.
- E. sont la cible de médicaments utilisés dans le traitement du nanisme.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°6 : Les récepteurs à activité sérine / thréonine kinase :

- A. comprennent les récepteurs au BMP.
- B. sont la cible de médicaments anti-inflammatoires.
- C. sont actifs sous forme de tétramères.
- D. sont des récepteurs intracellulaires.
- E. peuvent être inhibés par des médicaments dont le suffixe est *-dig*.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°7 : Les récepteurs à activité protéine kinase :

- A. comprennent 7 domaines transmembranaires.
- B. peuvent activer les voies de signalisation par phosphorylation.
- C. nécessitent du GTP pour l'activation des voies de signalisation.
- D. sont phosphorylés de façon irréversible.
- E. sont phosphorylés dans leur domaine extracellulaire.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°8 : Le trastuzumab :

- A. est un anticorps monoclonal anti-récepteurs de l'IGF.
- B. inhibe les récepteurs membranaires couplés à une tyrosine kinase cytosolique.
- C. bloque la cascade de phosphorylation impliquée dans la prolifération cellulaire.
- D. se lie au même récepteur que le cétuximab.
- E. est un médicament anticancéreux.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°9 : Les benzodiazépines :

- A. sont des antagonistes du récepteur au GABA.
- B. sont des agonistes du récepteur au glutamate.
- C. favorisent l'entrée d'ions Cl⁻ dans la fente post-synaptique.
- D. diminuent l'anxiété.
- E. augmentent le potentiel post-synaptique inhibiteur.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°10 : Les guanylates cyclases cytosoliques :

- A. sont directement activées par l'acétylcholine.
- B. sont activées par le monoxyde d'azote (NO).
- C. lorsqu'elles sont stimulées, convertissent le GMP cyclique en GTP.
- D. conduisent, une fois activées, à la contraction des cellules musculaires lisses vasculaires.
- E. sont la cible des dérivés nitrés.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°11 : Les récepteurs nucléaires :

- A. sont des facteurs de transcription.
- B. doivent être sous forme dimérique pour se lier à la partie promotrice des gènes.
- C. sont la cible de ligands hydrophiles.
- D. sont toujours localisés dans le noyau.
- E. sont la cible de nombreux médicaments de substitution.
- F. toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°12 : La HMG-CoA réductase :

- A. assure la dernière étape de la synthèse du cholestérol.
- B. est impliquée dans la synthèse de l'angiotensine 2.
- C. est impliquée dans la physiopathologie de l'hypertension artérielle.
- D. est la cible de médicaments hypocholestérolémiants.
- E. est inhibée par des médicaments dont le suffixe est *-sartan*.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°13 : La transpeptidase :

- A. est une enzyme nécessaire à la constitution de la paroi bactérienne.
- B. permet la synthèse du peptidoglycane.
- C. est inhibée par des antiviraux.
- D. est inhibée par le triméthoprim.
- E. est inhibée par les céphalosporines.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°14 : Les inhibiteurs de la dihydrofolate réductase :

- A. inhibent la formation du tétrahydrofolate.
- B. inhibent la synthèse de muréine.
- C. présentent uniquement des activités antibactériennes.
- D. sont caractérisés par le suffixe *-tinib*.
- E. peuvent être commercialisés sous la forme d'une association.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°15 : Les canaux K_{ATP} :

- A. assurent le passage des ions dans le sens contraire du gradient de concentration.
- B. sont activés par la liaison d'un médiateur extracellulaire.
- C. peuvent être la cible d'un médicament dont le suffixe est *-caine*.
- D. peuvent être fermés par les sulfamides hypoglycémifiants.
- E. peuvent être la cible de médicaments anti-hypertenseurs.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°16 : Les transporteurs du tubule rénal :

- A. favorisent le passage des ions dans le sens contraire du gradient de concentration.
- B. permettent la réabsorption des ions.
- C. sont de type NCC dans les tubules contournés distaux.
- D. sont la cible des thiazidiques au niveau de l'anse de Henlé.
- E. sont la cible de médicaments utilisés dans le traitement de l'HTA.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°17 : Les ISRS (Inhibiteurs Sélectifs de la Recapture de la Sérotonine) :

- A. ferment des canaux ioniques.
- B. sont des médicaments antidépresseurs.
- C. agissent au niveau pré-synaptique dans le système nerveux central.
- D. inhibent la recapture de l'insuline.
- E. inhibent la recapture de la sérotonine.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

TUTORAT UE 6 2013-2014 – Pharmacologie

Séance n°4 – Semaine du 10/03/2014

Pathologie et pharmacologie des récepteurs nucléaires Pujol

Séance préparée par la team UE 6 + MAPS
!!V!V!! QCMs non visionnés par le Pr Pujol pour le moment !!V!V!!

QCM n°1 : L'activation des récepteurs nucléaires :

- A. est déclenchée par la liaison récepteur-ligand.
- B. va de pair avec une augmentation de leur affinité pour la protéine Hsp.
- C. inclut la modification de leur structure, étape nécessaire à l'activation ultérieure de la transcription.
- D. implique qu'ils soient dimérisés.
- E. permettra au final leur fixation, toujours directe, sur l'ADN.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°2 : Les récepteurs nucléaires :

- A. présentent un domaine de liaison à l'ADN et un domaine de liaison au ligand dont les séquences d'acides aminés respectives sont distinctes l'une de l'autre.
- B. ont un domaine de liaison au ligand très variable d'un type de récepteurs à l'autre.
- C. orphelins sont toujours à l'état activé car ils n'ont pas de ligand.
- D. peuvent, une fois activés et fixés spécifiquement sur l'ADN, interagir avec des intermédiaires protéiques régulateurs de la transcription.
- E. liés à un cofacteur qui induit une désacétylation des histones, conduiront à une activation de la transcription.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°3 : Concernant les mécanismes d'intervention hormonale dans les cancers hormono-dépendants :

- A. Supprimer la production de testostérone d'origine gonadique est un traitement possible du cancer de la prostate.
- B. Stopper la sécrétion pulsatile de LHRH au niveau de l'axe hypothalamo-hypophysaire via un antagoniste est un traitement possible du cancer du sein.
- C. Supprimer la production d'hormone sexuelle d'origine gonadique par blocage surrénalien via les glucocorticoïdes est un traitement possible du cancer de la prostate.
- D. Utiliser des anti-aromatases afin d'inhiber la conversion des précurseurs surrénaliens en oestrogènes est un traitement possible du cancer du sein.
- E. Utiliser des inhibiteurs compétitifs pour qu'ils se fixent à la place des hormones au niveau des récepteurs nucléaires des cellules tumorales est un traitement possible des cancers hormono-dépendants.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°4 : Concernant le traitement hormonal du cancer de la prostate :

- A. Le kétoconazole est un anti-gonadotrope qui permet d'inhiber la sécrétion de LH.
- B. Il consiste à réduire la production de testostérone, inhiber sa transformation en dihydrotestostérone, ou inhiber ses effets au niveau des récepteurs.
- C. Inhiber la 5- α réductase permet de conserver intact l'effet de la testostérone sur la force musculaire et la libido.
- D. Le finastéride inhibe la synthèse de testostérone.
- E. On peut utiliser de puissants antagonistes au niveau des récepteurs aux androgènes tels que la cyprotérone (Androcur®).
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°5 : Les techniques d'hormonothérapie compétitive chez la femme :

- A. bloquent la production d'oestrogènes au niveau de l'ovaire.
- B. utilisent des modulateurs sélectifs des récepteurs des estrogènes.
- C. utilisent des molécules comme le tamoxifène qui auront un effet antagoniste sur tous les tissus exprimant le récepteur aux oestrogènes.
- D. utilisent des molécules ayant toutes la même affinité pour les récepteurs aux oestrogènes.
- E. vont induire une modification conformationnelle du récepteur différente de celle engendrée par la liaison des oestrogènes.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°6 : Les SERM (Modulateurs Sélectifs des Récepteurs aux Estrogènes) :

- A. peuvent moduler l'action des récepteurs aux oestrogènes du fait de leur affinité identique pour ces récepteurs.
- B. peuvent moduler d'autres voies de signalisation.
- C. peuvent interagir avec 2 isoformes des récepteurs aux oestrogènes.
- D. peuvent moduler le recrutement des cofacteurs et l'activité traductionnelle des récepteurs aux estrogènes.
- E. ont des effets oestrogéniques similaires en fonction des tissus.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°7 : Le tamoxifène :

- A. présente un effet agoniste au niveau de l'épithélium mammaire.
- B. est utilisé comme traitement substitutif de la ménopause.
- C. augmente le cholestérol LDL.
- D. est le seul SERM utilisé pour la prévention de l'ostéoporose post-ménopausique.
- E. prévient des phlébites ou autre embolies veineuse
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.

QCM n°8 : Les échappements à l'hormonothérapie :

- A. vont parfois conduire à une efficacité seulement temporaire.
- B. peuvent être liés à une augmentation de la synthèse intra-tumorale d'hormone.
- C. peuvent être liés à une sous-expression des gènes anti-apoptotiques.
- D. peuvent être liés à une activation des gènes pro-apoptotiques.
- E. peuvent être liés à des facteurs de croissance.
- F. Toutes les propositions précédentes sont fausses.