

Ue6

1) initiation à la connaissance du médicament

a) les principes actifs et les cibles

les principes actifs et les cibles

les objectifs de ce chapitre sont d'aborder les cibles actuelles des médicaments

la plupart sont en cours d'utilisation ou en cours d'études

les cibles, pour certaines, sont déjà exploitées d'autres ont un potentiel dans le futur

la **pharmacologie** est la science qui permet de comprendre les mécanismes d'action des médicaments

les effets bénéfiques de ces médicaments (thérapeutiques)

les effets indésirables

la compréhension de tous ces effets est à la base de l'utilisation la plus pertinente possible de ces médicaments mais aussi à la base de la recherche de nouvelles pistes thérapeutiques

nous ferons un bilan des **principes actifs** et des **cibles** potentielles

et nous aborderons ces cibles en rapport avec la signalisation ionique, les récepteurs des médiateurs ou encore en rapport avec certaines transmissions neuronales et hormonales

nous traiterons ces notions de manière intégrée avec comme préoccupation essentielle de mettre en relief le médicament

nous essaierons de voir si à une cible correspondra toujours une indication thérapeutique

Ouvrages de référence :

[pas utile en paces mais dans les années futures =]

- **Pharmacologie**, des cibles vers l'indication thérapeutique Y. Landry, JP Gies, Dunod, 2009 (2^{ème} édition).
- **Dictionnaire pharmaceutique**, pharmacologie et chimie du médicament Y. Landry, Y. Rival, Lavoisier 2007

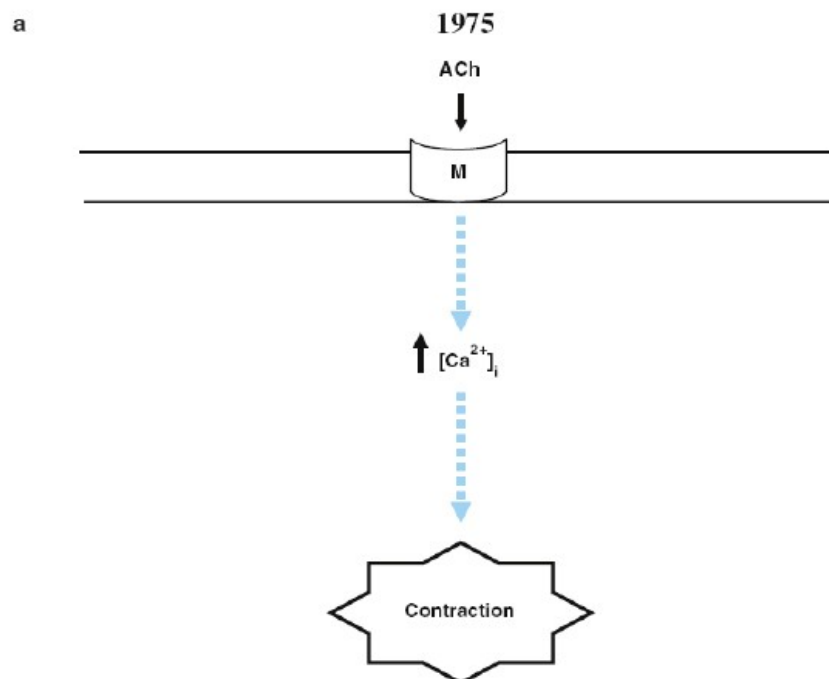
pour illustrer à quel point les **concepts** peuvent être présentés de manière simplifiée,
ou au contraire de manière détaillée,

voici l'exemple de la transmission du signal induit par la fixation de l'acétylcholine (ACh)
sur le récepteur muscarinique (M)

cette figure illustre comment les pharmacologues expliquaient les effets de ce neuromédiateur,
en 1975, sur la cellule musculaire lisse

«l'acétylcholine se fixe sur un récepteur membranaire de type muscarinique
ce qui va entraîner une augmentation de la concentration intracellulaire de calcium
ceci ayant pour effet de déclencher la contraction de cette cellule musculaire lisse»

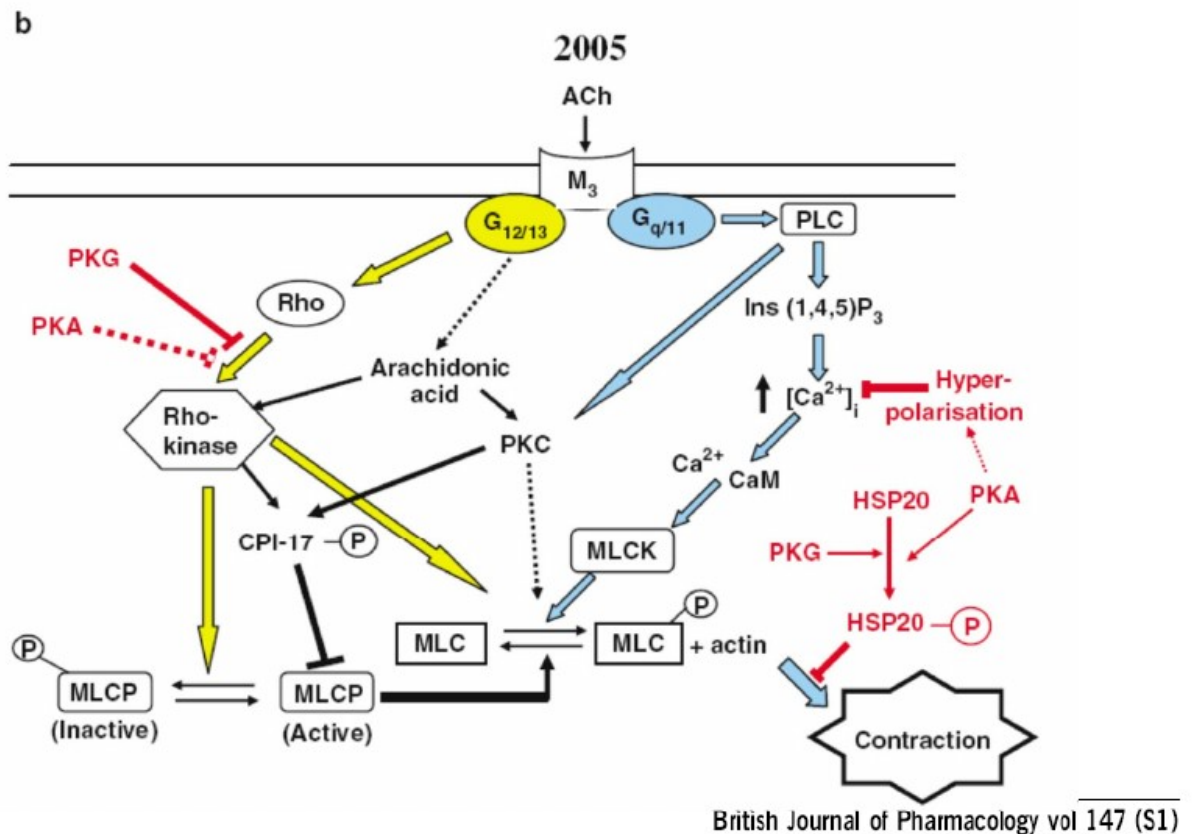
La Pharmacologie en 1975 ...



British Journal of Pharmacology vol 147 (S1)
2006

30 ans plus tard, un certains nombres d'acteurs ont été décrits dans la voie de transduction du signal «acétylcholine donne contraction»

La Pharmacologie en 2005 :



nous allons nous positionner entre ces 2 visions
ni trop simpliste ni trop détaillé

Plan

- 1°) Généralités
- 2°) La diversité des médicaments
- 3°) La diversité des cibles
- 4°) Les récepteurs nucléaires
- 5°) Les récepteurs canaux
- 6°) Les canaux ioniques
- 7°) Les récepteurs couplés aux protéines G
- 8°) Les récepteurs à activité enzymatique