UE 8

CIBLES ET MÉCANISMES D'ACTION

Annales

Pr. Sarrado

Tutorat Santé Lorraine
Année 2026-2027

2025 - 2026

Concernant le traitement par insuline, quelle(s) est(sont) la(les) proposition(s) exacte(s)?

A. L'insuline inhibe une enzyme du métabolisme glucidique qui stimule la synthèse de glycogène.

B. L'insuline active un récepteur nucléaire.

C. L'insuline inhibe les adénylate-cyclases et la production d'AMPc.

D. L'insuline active un récepteur à activité tyrosine kinase.

E. L'insuline favorise la sortie du glucose de la cellule.

Parmi les propositions suivantes concernant les mécanismes d'action des médicaments, quelle(s) est(sont) la(les) proposition(s) exacte(s) ?

A. Les médicaments corticoïdes comme la prednisone sont des médicaments antagonistes du récepteur nucléaire aux glucocorticoïdes GR.

B. Les médicaments corticoïdes permettent la modulation de la transcription de gènes impliqués dans la production de cytokines.

C. Les anti-inflammatoires non stéroïdiens (AINS) ciblent les récepteurs de l'acide arachidonique.

D. Les anti-inflammatoires non stéroïdiens (AINS) peuvent induire des effets indésirables rénaux par manque de sélectivité pour sa cible.

E. Les anti-inflammatoires non stéroïdiens (AINS) peuvent inhiber l'agrégation plaquettaire.

Parmi les propositions suivantes concernant la pharmacologie, indiquez quelle(s) est(sont) la(les) proposition(s) exacte(s)?

A. La pharmacodynamie étudie les effets thérapeutiques et les effets indésirables des médicaments.

B. L'effet thérapeutique de tous les médicaments est lié à l'action sur une cible déterminée.

C. La pharmacocinétique étudie les effets indésirables sur l'organisme.

D. Une augmentation de la dose peut entraîner l'apparition d'effets secondaires indésirables voire toxiques.

E. Une cible pharmacologique est une macromolécule de l'organisme, généralement de nature lipidique.

Parmi les propositions suivantes, quelle(s) est(sont) la(les) proposition(s) exacte(s)?

A. Un ligand est défini par sa capacité à activer un récepteur.

B. Les médiateurs endogènes activent tous une cible biologique.

C. Les médicaments sont tous des antagonistes ou des inhibiteurs de cibles pharmacologiques.

D. Le manque de sélectivité du médicament pour l'organe cible peut être à l'origine d'effets indésirables.

E. La reconnaissance mutuelle entre le médicament et sa cible détermine l'activité du médicament.

F. La sélectivité d'un médicament pour une cible biologique augmente lorsque l'on augmente sa concentration.

QROC : Que signifie le A de l'acronyme ADME classiquement utilisé pour présenter les différentes étapes du devenir d'un principe actif dans l'organisme ? (Tapez le mot correspondant à votre réponse)

2024 - 2025

Parmi les propositions suivantes concernant la pharmacologie, indiquez quelle(s) est(sont) la(les) proposition(s) exacte(s)?

A. La pharmacodynamie étudie l'action de l'organisme sur le médicament.

B. L'effet thérapeutique de tous les médicaments est lié à l'action sur une cible déterminée.

C. Une augmentation de la dose peut entraîner l'apparition d'effets secondaires indésirables voire toxiques.

D. Une cible pharmacologique est une macromolécule de l'organisme, généralement de nature protéique.

2023 - 2024

Parmi les propositions suivantes, quelle(s) est(sont) la(les) proposition(s) exacte(s) ?

A. Un ligand est défini par sa capacité à se lier à un récepteur et à l'activer

B. Le manque de sélectivité du médicament pour le récepteur cible peut être à l'origine d'effets indésirables

C. Le manque de sélectivité du médicament pour l'organe cible peut être à l'origine d'effets indésirables

D. La reconnaissance mutuelle entre le médicament et sa cible détermine l'activité du médicament

Parmi les propositions suivantes concernant les cibles des médicaments, quelle(s) est(sont) la(les) proposition(s) exactes :

A. La majorité des médicaments agissant sur une enzyme sont des activateurs

B. Une enzyme endogène peut être la cible d'un médicament

C. La majorité des médicaments actuels ciblent des canaux et des pompes ioniques

D. Les médicaments ciblant les récepteurs sont tous des agonistes.

E. Les récepteurs cibles des médicaments sont tous des récepteurs membranaires

Parmi les propositions suivantes concernant les mécanismes d'action des médicaments, quelle(s) est(sont) la(les) proposition(s) exacte(s) ?

A. Les médicaments corticoïdes comme la Prednisone sont des médicaments antagonistes du récepteur nucléaire aux glucocorticoïdes GR

B. Les médicaments corticoïdes permettent la modulation de la transcription de gènes impliqués dans la production de cytokines

C. Les anti-inflammatoires non stéroïdiens (AINS) ciblent les cyclo-oxygenases

D. Les anti-inflammatoires non stéroïdiens (AINS) peuvent induire des effets indésirables hémorragiques par inhibition de la cyclo-oxygenase de type 2 (COX-2)

E. Les anti-inflammatoires non stéroïdiens (AINS) possèdent des effets antalgiques et antipyrétiques

2022 - 2023

Parmi les propositions suivantes, quelle est (quelles sont) celle (celles) qui est (sont) exacte(s) ?

A. Le récepteur Gaba-A est un récepteur permettant le passage des ions sodium.

B. L'activation du récepteur Gaba-A permet une diminution de l'excitabilité neuronale.

C. Le récepteur Gaba-A est la cible de médicaments anti-inflammatoires.

D. Le récepteur Gaba-A est la cible de médicaments anxiolytiques.

E. En présence de benzodiazépines, les effets de l'acide gamma-aminobutyrique (gaba) sont potentialisés.

Parmi les propositions suivantes concernant les mécanismes d'action des médicaments, quelle est (quelles sont) celle (celles) qui est (sont) exacte(s) ?

A. Un médicament anti-inflammatoire peut avoir pour cible les cyclo-oxygénases.

B. Un médicament anti-inflammatoire peut voir pour cible un récepteur nucléaire.

C. Les sulfamides hypoglycémiants sont des activateurs des canaux potassiques ATP dépendants.

D. Les sulfamides hypoglycémiants stimulent le stockage vésiculaire de l'insuline dans les cellules bêta des ilots de Langerhans.

E. Les inhibiteurs de protéases du virus VIH agissent au niveau de la maturation des protéines virales.

2021 - 2022

Parmi les propositions suivantes, quelle est (quelles sont) celle (celles) qui est (sont) exacte(s) ?

A. Les récepteurs à tyrosine kinase sont des récepteurs nucléaires.

B. L'ibuprofène provoque une inhibition irréversible de la cyclo-oxygénase.

C. Le récepteur GABA-A est un récepteur canal perméable aux ions chlorures.

D. L'effecteur final d'un RCPG peut être une enzyme.

E. Les antibiotiques de type pénicilline interagissent avec la paroi bactérienne

---

Concernant les cibles moléculaires des médicaments :

A. Elles sont pour environ 50% représentées par des récepteurs membranaires.

B. 1200 cibles ont été identifiées et caractérisées à ce jour.

C. 15% des médicaments sont des inhibiteurs enzymatiques.

D. L'insuline agit sur la même cible moléculaire que le glibenclamide.

E. Une protéine est toujours une cible moléculaire.

Les médicaments glucocorticoïdes sont :

A. Anti-inflammatoires

B. Antidiabétiques

C. Des inhibiteurs des cyclo-oxygénases

D. Des agonistes de récepteurs cytosoliques ou nucléaires GR-alpha

E. Des antagonistes des canaux potassiques

Concernant les récepteurs à activité canal ionique :

A. Ce sont des récepteurs cytosoliques.

B. Le récepteur de l'insuline en est un exemple.

C. Ils ne sont pas couplés aux protéines G.

D. Le récepteur GABA-A en est un exemple.

E. Ils ont une cinétique de réponse de quelques heures.

2020 - 2021

Les récepteurs à activité tyrosine-kinase :

A. Sont des récepteurs couplés aux protéines G.

B. Sont cytosoliques.

C. Sont des cibles d'anticorps monoclonaux.

D. Sont des cibles d'inhibiteurs enzymatiques.

E. Ont, parmi leurs ligands, l'insuline.

Les récepteurs à activité canal ionique :

A. Sont les cibles de nombreux médiateurs.

B. Comprennent les récepteurs de la nicotine.

C. Comprennent les récepteurs du diazépam.

D. Sont perméables aux anions ou aux cations.

E. Leur cinétique de réponse est de l'ordre de la milliseconde.

L'ibuprofène est :

A. Un anti-inflammatoire non stéroïdien.

B. Un glucocorticoïde anti-inflammatoire.

C. Un inhibiteur des cyclo-oxygénase.

D. Un agoniste des récepteurs nucléaires.

E. Un inhibiteur des canaux potassiques ATPdépendants.

Correction : 2025 - 2026

D est vraie

A. Faux : Le récepteur de l'insuline est un récepteur à tyrosine-kinase. Quand l'insuline se fixe à ce dernier, cela va activer la partie enzymatique tyrosine-kinase et enfin va stimuler la synthèse du glycogène. L'insuline doit donc stimuler une enzyme pour stimuler la synthèse de glycogène.

B. Faux : Les récepteurs à tyrosine-kinase sont des récepteurs membranaires.

C. Faux : Les adénylates cyclases sont des messagers secondaires qui sont plutôt liés aux RCPG.

D. Vrai : Son activation va entraîner une cascade de signalisation intracellulaire responsable de la captation du glucose par les cellules cibles.

E. Faux : Au contraire, elle favorise sa captation par les cellules.

B, D et E sont vrais

A. Faux : Ce sont des agonistes du récepteur nucléaire aux glucocorticoïdes.

B. Vrai : Tout à fait, ils stimulent la production de protéine anti-inflammatoire et inhibent la production de cytokine pro-inflammatoire.

C. Faux : Les AINS ciblent des enzymes et non des récepteurs. Ils ciblent, en l'occurrence les COXs.

D. Vrai : En effet, ils peuvent aussi provoquer des ulcères gastriques ou des hémorragies. Ces effets indésirables sont notamment dus à l'inhibition de l'enzyme COX-1.

E. Vrai : Cela va entraîner des risques hémorragiques.

D est vraie

A. Faux : Pas du tout, la pharmacodynamie étudie l'action du médicament sur l'organisme.

B. Faux : Certains médicaments n'ont pas forcément une action sur une cible précise.

C. Faux : La pharmacocinétique étudie l'action de l'organisme sur le médicament.

D. Vrai : Effectivement, plus on augmente la dose, plus on augmente le risque d'avoir des effets néfastes.

E. Faux : Cela peut etre pleins de choses différentes.

D est vraie

A. Faux : Il peut désactiver un récepteur.

B. Faux : Ils le sont en majorité, mais pas tous.

C. Faux : Ils peuvent agonistes ou activateurs également.

D. Vrai : Cela peut être à l'origine d'effets indésirable mais aussi d'effets toxique.

E. Faux : Il s'agit de l'affinité, l'activité est en fonction de la réponse biologique après.

F. Faux : C'est l'inverse la sélectivité diminue.

QROC.

Réponses correctes : Absorption, absorption

Correction : Absorption, Distribution, Métabolisme, Élimination

Correction : 2024 - 2025

C et D sont vrais

A. Faux : Science qui étudie l'action du médicament sur l'organisme.

B. Faux : Il n'existe pas de médicament qui soit spécifique d'une cible biologique.

C. Vrai.

D. Vrai : Le plus souvent.

Correction : 2023 - 2024

Item B et C sont justes

A. Faux : Le ligand est également susceptible de bloquer un récepteur. Un ligand c'est en fait toute molécule se liant à une cible de l'organisme ! La notion de "l'activer" est de trop ici

B. Vrai.

C. Vrai : C'est le cas des dérivés morphiniques qui, s'ils se lient aux récepteurs opioïdes intestinaux, entraînent une constipation.

D. Faux : la reconnaissance détermine l'affinité du ligand pour sa cible, c'est ensuite la réponse biologique qui détermine l'activité du médicament.

Item B est juste

A. Faux : ce sont des inhibiteurs.

B. Vrai : comme par exemple les AINS, ciblant les COX.

C. Faux : 50% des médicaments ciblent les récepteurs.

D. Faux : il y a des antagonistes aussi.

E. Faux : il y a aussi des récepteurs nucléaires comme les glucocorticoïdes.

Item B, C et E sont justes

A. Faux : les corticoïdes sont des agonistes du récepteur GRα endogènes.

B. Vrai : Que ce soit le cortisol ou les corticoïdes de synthèse, en activant le récepteur GRα qui va pouvoir agir sur la transcription de différents gènes au niveau nucléaire, on va diminuer la production des médiateurs de l'inflammation (cytokines) et obtenir un effet anti-inflammatoire

C. Vrai.

D. Faux : c'est par l'inhibition des COX-1 que des effets indésirables (non-systématiques) comme des douleurs gastriques, une altération de la fonction rénale ou des hémorragies. L'inhibition des COX-2 est l'effet recherché des AINS (anti-douleur).

E. Vrai : les AINS possèdent des effets antalgiques, anti-inflammatoires, et antipyrétiques.

Correction : 2022 - 2023

Item B, D et E sont justes

A. Faux : Le récepteur GABA-A a une activité de canal chlorure, il laisse passer les ions Cl-.

B. Vrai : La fixation Gaba sur son récepteur va induire l'ouverture de ce canal. Il va y avoir un passage d'ion CL- du milieu extracellulaire vers le milieu intracellulaire. Le neurone va alors être hyperpolarisé, ce qui va générer un potentiel post synaptique inhibiteur (PPSI de son p'tit nom). L'excitabilité neuronale est diminuée.

C. Faux : Le récepteur Gaba-A est la cible de médicament anxiolytique.

D. Vrai.

E. Vrai : Les benzodiazépines viennent se fixer sur un site différent de celui du Gaba. Il vont favoriser l'ouverture du canal et le passage des ions chlorure, potentialisant la diminution de l'excitabilité neuronale.

Item A, B et E sont justes

A. Vrai : C'est le cas des AINS du type ibuprofène par exemple.

B. Vrai : C'est le cas des AIS comme les glucocorticoïdes.

C. Faux : Ce sont des inhibiteurs des canaux potassiques. En effet, ils vont bloquer ces canaux, ce qui va créer une accumulation de potassium dans la cellule, qui entraînera sa dépolarisation, et par le même biais la libération d'insuline.

D. Faux : Leur but est d'au contraire libérer l'insuline pour faire baisser la glycémie.

E. Vrai : Les virions deviennent donc immatures et inoffensifs.

Correction : 2021 - 2022

item C, D et E sont justes

A. Faux : Ce sont des récepteurs à activité enzymatique donc membranaires.

B. Vrai : C'est un AINS, mais il inhibe les COX de façon réversible contrairement à l'aspirine.

C. Vrai : Utilisé en cas l'anxiété, l'entrée des ions chlorure diminue l'excitabilité.

D. Vrai : Dans les cascades de transduction intracellulaire, l'effecteur final peut être une enzyme.

E. Vrai : C'est un peu fourbe, la pénicilline agit au niveau de la transpeptidase, enzyme qui synthétise la paroi. En l'inhibant, elle empêche la formation de la paroi. On peut tout de même considérer qu'elle interagit avec la paroi (même si c'est via ses constituants).

Aucune des propositions n'est juste

A. Faux : On compte 40% de récepteurs membranaires parmi les cibles.

B. Faux : Attention, il y a à l'heure actuelle 1200 médicaments connus pour 330 cibles identifiées.

C. Faux : 25% des médicaments sont des inhibiteurs enzymatiques.

D. Faux : L'insuline agit sur des récepteurs à activité enzymatique (rapport ATP et ADP) alors que le glibenclamide est un sulfonylurée qui inhibe les canaux kATP(transport ionique).

E. Faux : Attention au mot TOUJOURS.

Item A et D sont justes

A. Vrai.

B. Faux : Les glucocorticoïdes sont anti-inflammatoires.

C. Faux : Ce sont les AINS qui sont inhibiteurs des COX.

D. Vrai.

E. Faux : Ce sont des agonistes de récepteurs nucléaires GR-alpha.

Item C et D sont justes

A. Faux, ce sont des récepteurs membranaires et non cytosoliques.

B. Faux, le récepteur de l'insuline est un récepteur à activité enzymatique.

C. Vrai.

D. Vrai, le GABA-A est un récepteur à activité canal chlorure.

E. Faux, ils ont une cinétique de réponse de l'ordre de la milliseconde.

Correction : 2020 - 2021

Item C, D et E sont justes

A. Faux : Les RCPG sont un autre type de récepteurs.

B. Faux : Ils sont trans-membranaires.

C. Vrai.

D. Vrai : Des inhibiteurs des kinases peuvent être utilisés dans certains traitements (cancer +++) afin de bloquer la voie de signalisation des RTK.

E. Vrai : Les RTK sont à la base de la voie de signalisation de l'insuline.

Item A, B, C, D et E sont justes

A. Vrai.

B. Vrai : La nicotine entraîne l'ouverture de canaux ioniques qui induit une entrée de sodium favorisant la dépolarisation.

C. Vrai : Les diazépam interagissent avec des canaux à ions Chlorure qui amplifient de la transmission de Gaba.

D. Vrai : Par exemple, la nicotine ouvre des canaux Na+ et le diazépam des canaux CL-.

E. Vrai.

Item A et C sont justes

A. Vrai : L'ibuprofène et l'Advil sont des AINS à connaître.

B. Faux : L'ibuprofène est un AINS contrairement à la prednisone et au cortancyl qui sont des glucocorticoïdes de synthèse qui miment l'effet du cortisol.

C. Vrai : Leurs effets thérapeutiques résultent de l'inhibition des COX-2 car l'AINS s'oppose aux symptômes engendrés par les prostaglandines proinflammatoires.

D. Faux : Les récepteurs nucléaires sont des récepteurs aux glucocorticoïdes.

E. Faux : L'ibuprofène est un inhibiteur d'enzymes : les cyclooxygénases.