

Université A/Mira de Béjaia
Faculté des sciences de la nature et de la vie
Département de Microbiologie

date : 07-04-2014
horaire : 14h00-16h00

Rattrapage de Pharmacologie Master 1

Première partie :

Mentionnez uniquement les possibilités justes.

1-après l'administration d'un médicament :

- a- uniquement l'organisme agit sur le médicament.
- b- uniquement l'organisme subit l'action du médicament.
- c- on assiste à une action réciproque entre le médicament et l'organisme.
- d- ni le médicament agit sur l'organisme ni celui-ci agit sur le médicament.

2- la courbe dose effet :

- a-expose la relation entre $\text{Log}[\text{dose}]$ et le nombre (%) des récepteurs occupés par le médicament.
- b- la DE_{50} reflète l'affinité du médicament à ses récepteurs.
- c- pour un effet graduelle DE_{50} reflète la dose qui provoque la moitié de l'effet maximal (E_{max}).
- d-pour un effet quantal (tout ou rien), DE_{50} reflète la dose qui provoque l'effet étudié chez la moitié des individus testés.

3-mécanismes d'action des médicaments :

- a-les médicaments doivent toujours se fixer pour agir.
- b-les médicaments agissent souvent par fixation dans l'organisme.
- c-un médicament diurétique osmotique comme le mannitol agit par fixation.
- d-certains médicaments agissent sur des organismes étrangers.

4-l'élimination rénale des médicaments:

- a- le médicament doit être filtré par le glomérule avant d'être réabsorbé.
- b- le probénécide facilite la sécrétion de la pénicilline.
- c- lors d'une intoxication par un médicament on augmente son excrétion.
- d- le néphron assure la filtration, l'excrétion et la réabsorption.

5- le cytochromeP450 est :

- a- un système enzymatique impliqué dans l'élimination des médicaments.
- b- on l'appelle ainsi parce qu'il a un $\text{PM}=450\text{Kd}$.
- c- il est localisé au niveau du noyau cellulaire.
- d-présentent une absorption maximale à 450nm une fois saturé par l' O_2 .

6-durant la phase tissulaire :

- a- le but de la biotransformation est d'augmenter l'efficacité de l'excrétion .
- b- le sang est le lieu essentiel de la biotransformation des médicaments.
- c- la biotransformation nécessite toujours une catalyse enzymatique.
- d-l'oxydation des médicaments, via la CYP450, peut être induite ou inhibée par les médicaments eux-mêmes.

7-l'élimination hépatique :

- a- ne concerne que l'excrétion par la voie biliaire.
- b-les glucuroconjugés subissent le cycle entéro-hépatique .
- c-le cycle entéro-hépatique accélère l'élimination hépatique des médicaments .
- d-les glucuroconjugés qui subissent le cycle entéro-hépatique seront éliminés par les reins.

8-la cinétique plasmatique des médicaments:modèle mono-compartmental(cas d'une administration unique *per os*)

- a-après administration, la concentration plasmatique est immédiatement maximale(C_{max}).
- b-la C_{max} correspond à l'équilibre entre l'absorption et l'élimination.
- c-la décroissance de la concentration plasmatique est une fonction linéaire du temps.
- d-la vitesse d'élimination varie entre la phase α et la phase β .

9- la dose de charge à comme objectif :

- a- obtenir un effet toxique.
- b- obtenir un effet thérapeutique rapide.
- c- obtenir un effet thérapeutique puissant.
- d- obtenir un effet thérapeutique prolongé.

10-le plateau de concentration :

- a-pour l'atteindre, il faut administrer la même dose à des intervalles réguliers égales à 5fois $T_{1/2}$.
- b-on souhaite le placer en-dessus du seuil toxique.
- c-pour certains antibiotiques, on préfère des concentration plasmatiques en pic et vallées au lieu d'un plateau de concentration.
- d-pour des médicaments à $T_{1/2}$ court , il est nécessaire d'administrer une dose de charge, ce qui permet de placer immédiatement le plateau dans la marge thérapeutique.

Deuxième partie

Pharmacocinétique de la théophylline

Après administration de $6 \text{ mg} \cdot \text{kg}^{-1}$ de théophylline, par voie intraveineuse, à un sujet de 60 Kg on observe un $T_{1/2}$ de 8 h et une concentration maximale calculée à l'origine C_0 de $20 \text{ mg} \cdot \text{L}^{-1}$.

En considérant un modèle mono-compartmental calculer :

- 1-Le volume de distribution de la théophylline chez ce sujet.
- 2-La clairance totale de la théophylline.

Troisième partie :

Une dose de 200 mg d'un médicament (M) a été administrée par voie intraveineuse (IV) rapide à un patient de 70 kg. Les concentrations plasmatiques de ce principe actif ont évolué suivant un modèle mono-compartmental avec une demi-vie de 18 heures. Un volume de distribution de 0,571 L/kg a été déterminé.

-Ecrire l'équation de la courbe $[M]_p=f(t)$ obtenue chez ce patient;

-Déterminer la clairance plasmatique totale.

- A quelle concentration sanguine peut-on s'attendre chez le même sujet, 18h après lui avoir administré 1g de ce médicament par voie IV. Si à ce moment on lui administre à nouveau 1g du même médicament par voie IV, qu'elle sera la concentration maximale sanguine atteinte ?

Bonne chance