

UE6 – Initiation à la Connaissance du Médicament

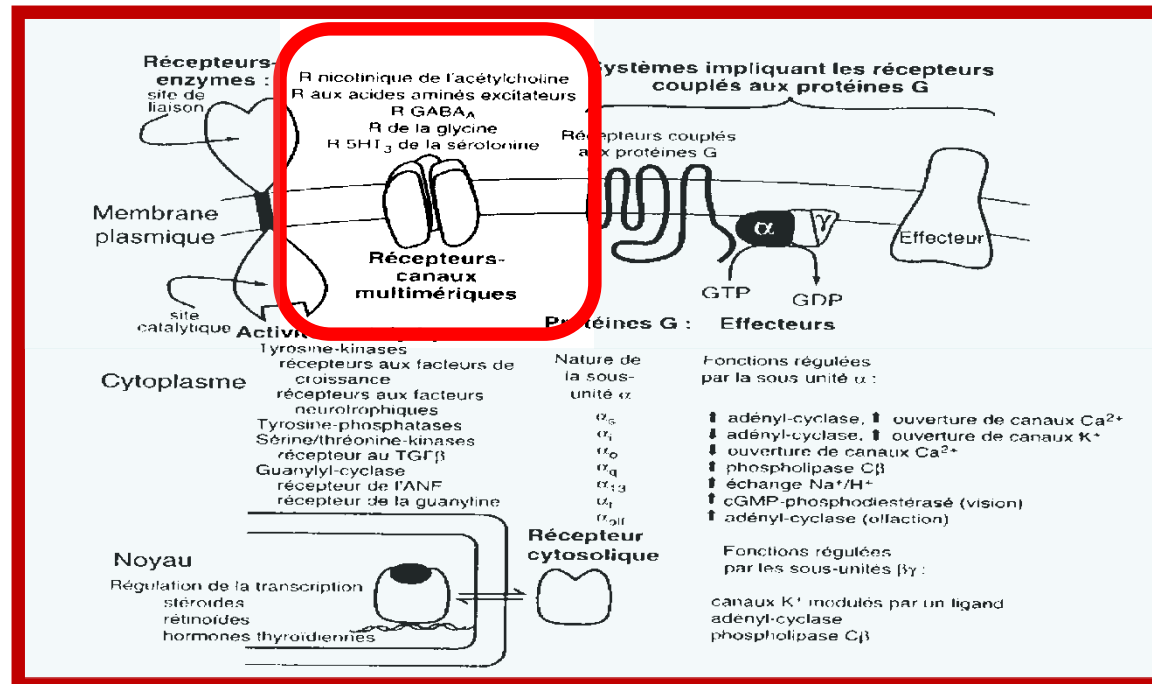
Chapitre 5 : **Les récepteurs canaux**

Professeur Christophe RIBUOT

La diversité des cibles

Récepteurs canaux :

famille des protéines qui sont responsables des équilibres ioniques transmembranaires.

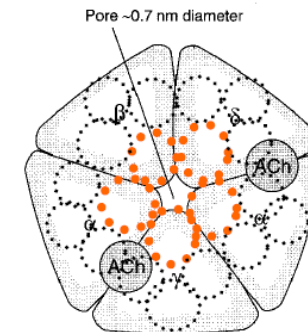
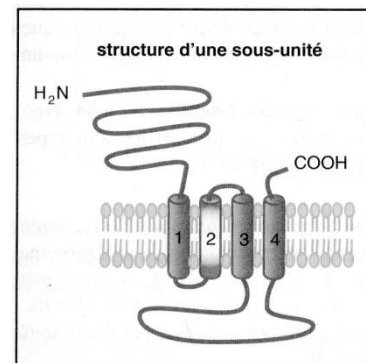
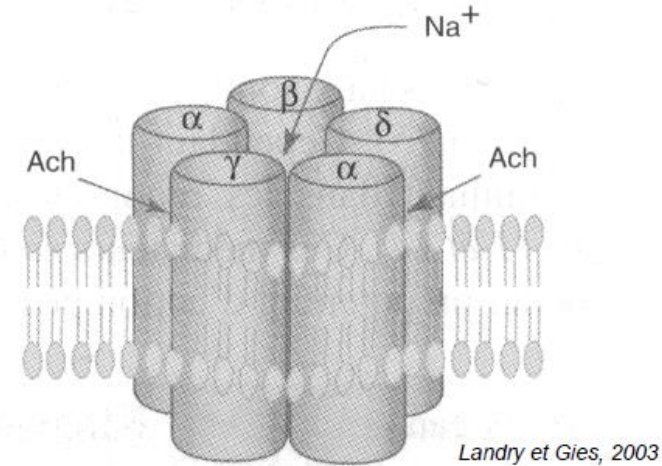


Les récepteurs canaux

- Les récepteurs **membranaires** des médiateurs :
 - *médicaments : agonistes / antagonistes*
- Récepteurs à activité de canaux ioniques,
- Exemples : récepteurs nicotiques, récepteurs GABA-A ...

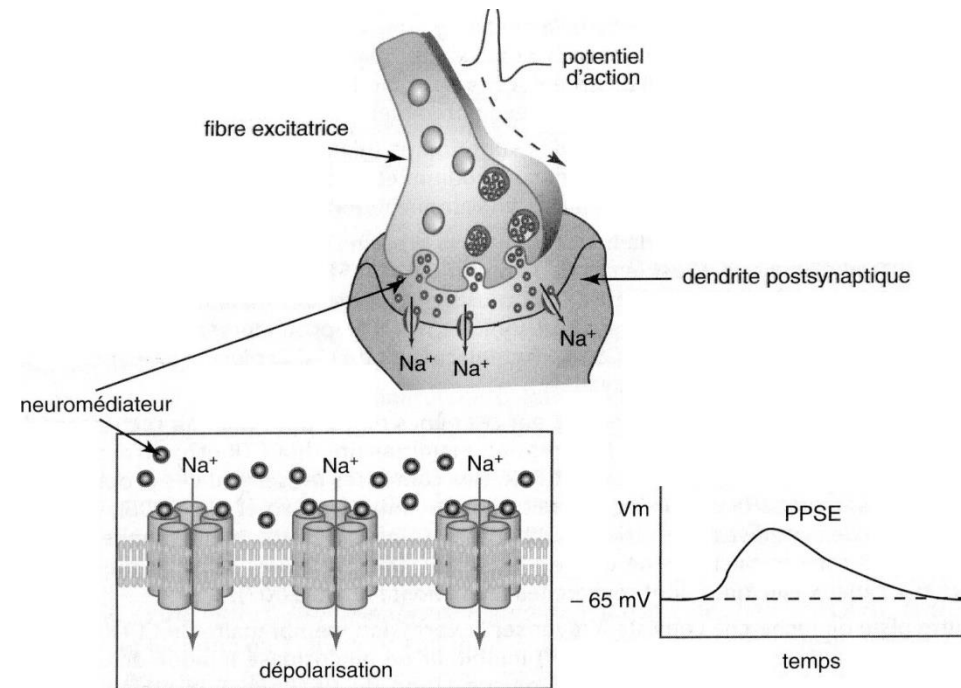
Les récepteurs nicotiniques

- nAChR
- Perméabilité : **Na⁺, Ca²⁺, K⁺ et Mg²⁺,**
- Transmission excitatrice rapide (ms),
- Structure pentamérique,
- 2 Types de localisation :
 - nAChR neuronaux,
 - nAChR musculaires.



Les récepteurs nicotiques

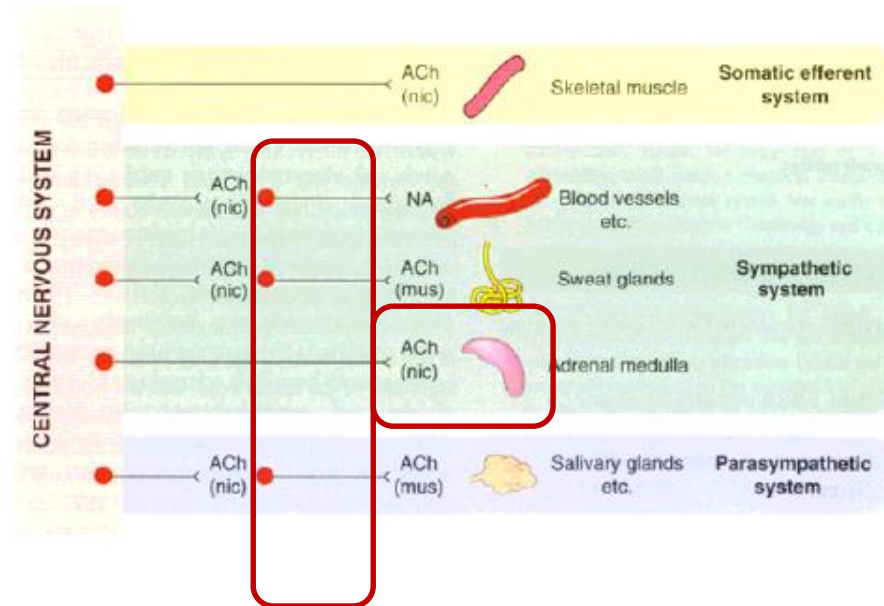
- Potentiel d'action axonal
 - ➔ Libération Ach
 - ➔ Laison nAChR
 - ➔ Potentiel postsynaptique excitateur (PPSE)



Les récepteurs nicotiniques

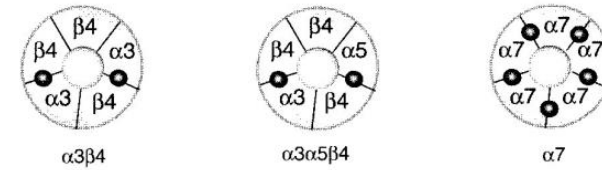
- système nerveux central

- système nerveux périphérique

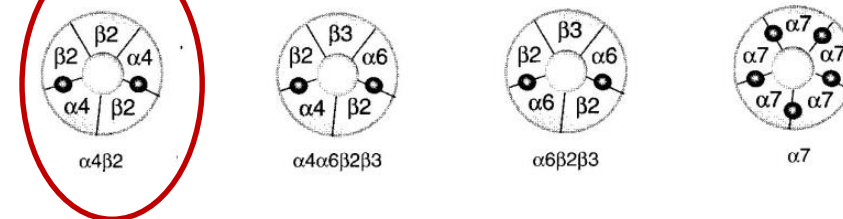


Rang, Dale et Ritter, 2003 (5th Edition)

Récepteurs nicotiniques neuronaux ganglionnaires



Récepteurs nicotiniques neuronaux centraux



nAChR $\alpha 4 \beta 2$

La varénicline

CHAMPIX®
varénicline



- Classe pharmacothérapeutique : principes actifs utilisés dans la dépendance à la nicotine.
- La varénicline se lie avec une affinité et une sélectivité élevées aux récepteurs nicotiniques neuronaux à l'acétylcholine $\alpha 4\beta 2$, sur lesquels elle agit comme agoniste partiel ...

Mentions légales

L'ensemble de ce document relève des législations française et internationale sur le droit d'auteur et la propriété intellectuelle. Tous les droits de reproduction de tout ou partie sont réservés pour les textes ainsi que pour l'ensemble des documents iconographiques, photographiques, vidéos et sonores.

Ce document est interdit à la vente ou à la location. Sa diffusion, duplication, mise à disposition du public (sous quelque forme ou support que ce soit), mise en réseau, partielles ou totales, sont strictement réservées à l'Université Grenoble Alpes (UGA).

L'utilisation de ce document est strictement réservée à l'usage privé des étudiants inscrits en Première Année Commune aux Etudes de Santé (PACES) à l'Université Grenoble Alpes, et non destinée à une utilisation collective, gratuite ou payante.