

## 1. Informations

### Cours

<b>Sigle</b>	SBP2010
<b>Titre</b>	Pharmacologie fonctionnelle et expérimentale I
<b>Nombre de crédits</b>	4 crédits
<b>Trimestre/Année</b>	Hiver 2023
<b>Date limite d'annulation</b>	24 janvier 2023
<b>Date limite d'abandon</b>	17 mars 2023

### Responsable / Coordonnateur du cours

<b>Nom</b>	Sylvie Marleau	<b>Titre</b>	Professeure titulaire
<b>Bureau</b>	Pavillon Jean Coutu, local 3202		
<b>Téléphone</b>			
<b>Courriel</b>	Sylvie.marleau@umontreal.ca		
<b>Disponibilités</b>	Sur rendez-vous		

## 2. Description du cours

Le cours SBP 2010 est le premier d'une série de 2 cours de pharmacologie fonctionnelle et expérimentale donnés au deuxième et troisième trimestre du programme BSBP. L'approche pédagogique de ces cours est axée sur les cibles pharmacologiques plutôt que sur les pathologies. Les principes de base de la pharmacologie tels l'affinité et la sélectivité des ligands, les courbes concentration-effet, de même que l'étude structurale et fonctionnelle d'une famille importante de récepteurs, les récepteurs heptahélicoïdaux, y seront abordés. La pharmacologie des systèmes histaminergique, cholinergique, adrénergique et peptidergique y sera traitée du point de vue de l'interaction moléculaire avec la cible et des réponses intégrées au niveau de l'organisme. Des exercices de simulation d'études pharmacologiques permettront d'étudier les paramètres régissant les interactions ligand- récepteur par les approches fonctionnelles et de liaison, de même que la modulation du système cardiovasculaire comme exemple de pharmacologie intégrative.

## 3. Objectifs généraux

Ce cours vise à donner à l'étudiant les connaissances nécessaires à la compréhension des interactions ligand - récepteur, et comment ces interactions se manifestent au niveau moléculaire pour la famille importante de récepteurs que sont les récepteurs heptahélicoïdaux. Ce cours donnera à l'étudiant des connaissances fonctionnelles de la pharmacologie du système nerveux autonome et du système cardiovasculaire, y compris un aperçu des principales méthodes de mesure d'efficacité préclinique et clinique et une perspective historique pour le développement des principales classes de médicaments.

## 4. Objectifs spécifiques

À la fin du cours, l'étudiant sera capable de :

- D'expliquer les différentes approches fonctionnelles utilisées dans la caractérisation des récepteurs ;
- D'expliquer les caractéristiques d'un ligand agoniste, agoniste inverse et d'un médicament antagoniste ;
- D'interpréter les paramètres des courbes concentration - effet et de définir les propriétés (agoniste partiel, entier, inverse ou antagoniste) des ligands et des médicaments ;
- D'interpréter les valeurs de puissance et d'affinité des ligands ;
- De déterminer la sélectivité d'un médicament par rapport à un autre ;
- D'expliquer l'utilité des approches de liaison et biologie moléculaire dans la caractérisation et la classification des récepteurs ;
- De décrire les effets pharmacologiques pour chaque classe de médicaments vue dans le cours et d'en expliquer les mécanismes d'actions ;
- De proposer, pour de nouvelles molécules actives sur les cibles thérapeutiques vues dans le cours, leurs utilisations cliniques possibles et de prévoir leurs effets secondaires potentiels ;
- D'interpréter les résultats de tests cardiovasculaires afin de décrire les effets pharmacologiques des médicaments ;
- De décrire, pour les classe de médicaments vues dans le cours, les principaux biomarqueurs d'efficacité et effets secondaires dans les modèles précliniques et en clinique ;
- De situer dans leur contexte historique le développement des principales classes de médicament visant les cibles thérapeutiques vues dans le cours.

## 5. Méthodes pédagogiques

Ce cours combine plusieurs méthodes pédagogiques :

- Cours magistraux en présentiel ou via Zoom
- Exercices pratiques
- Logiciel de simulation d'études pharmacologiques «Simulations of pharmacological experiments on the guinea pig ileum »
- <http://www.coacs.com/coacs-software/published-titles.html>

## 6. Calendrier des activités d'apprentissage (cours magistraux et évaluation)

Date	De	À	Sujet	Local	Responsable
05/01/2023	13:00	13:30	Présentation du plan de cours	STUDIUM	Sylvie Marleau
05/01/2023	13:30	15:30	Les approches fonctionnelles - Partie 1	S1-111 - JC	David Huynh
09/01/2023	08:30	11:30	Les approches fonctionnelles - Partie 2	S1-111 - JC	David Huynh
11/01/2023	13:00	16:00	Les approches de liaison et de biologie moléculaire - Partie 1	S1-111 - JC	David Huynh
17/01/2023	08:30	10:30	Les approches de liaison et de biologie moléculaire - Partie 2	S1-111 - JC	David Huynh
19/01/2023	08:30	10:30	Travaux pratiques sur les approches fonctionnelles et guides auto-apprentissages	S1-111 - JC	David Huynh, Jade Gauvin
19/01/2023	13:00	15:00	Travaux pratiques sur les approches fonctionnelles et guides auto-apprentissages	S1-111 - JC	David Huynh, Jade Gauvin
25/01/2023	13:00	15:00	Voies des nucléotides cycliques (AMPC et GMPc)	S1-111 - JC	John Stagg
26/01/2023	08:30	10:30	Transmission purinergique	S1-111 - JC	John Stagg
31/01/2023	08:30	10:30	Récepteurs heptahélicoïdaux	S1-111 - JC	Denis deBlois
01/02/2023	13:00	15:00	Métabolites de l'acide arachidonique	S1-111 - JC	Denis deBlois
06/02/2023	08:30	10:30	Métabolites de l'acide arachidonique	S1-111 - JC	Denis deBlois
07/02/2023	13:00	15:00	Endothélium vasculaire	S1-111 - JC	David Rhainds
14/02/2023	08:30	11:30	Transmission peptidergique	S1-111 - JC	Denis deBlois
15/02/2023	08:30	10:30	Hémostase	S1-111 - JC	Imane Boukhatem
21/02/2023	13:00	16:00	Cibles thérapeutiques du traitement de l'obésité	S1-111 - JC	David Rhainds
22/02/2023	13:00	16:00	Transporteurs membranaires	S1-111 - JC	David Rhainds
07/03/2023	08:30	10:30	Transmission peptidergique	S1-111 - JC	Sylvie Marleaus
<b>13/03/2023</b>	<b>09:00</b>	<b>12:00</b>	<b>Examen intra</b>	<b>Examsoft S1-151 - JC</b>	<b>Sylvie Marleau</b>
14/03/2023	08:30	10:30	Évaluation des propriétés cardiovasculaires	S1-111 - JC	Sylvie Marleau, Jade Gauvin, Marie-Lynn Al-Hawat
16/03/2023	08:30	10:30	Transmission adrénérergique	S1-111 - JC	Sylvie Marleau
21/03/2023	13:00	15:00	Transmission adrénérergique	S1-111 - JC	Sylvie Marleau
22/03/2023	13:00	15:00	Transmission adrénérergique	S1-111 - JC	Sylvie Marleau
28/03/2023	08:30	10:30	Transmission cholinérergique	S1-111 - JC	Sylvie Marleau
30/03/2023	13:00	15:00	Transmission cholinérergique	S1-111 - JC	Sylvie Marleau
03/04/2023	08:30	11:30	Évaluation des propriétés cardiovasculaires	S1-111 - JC	Sylvie Marleau, Jade Gauvin, Marie-Lynn Al-Hawat
05/04/2023	13:00	15:00	Cibles thérapeutiques du traitement des dyslipidémies	S1-111 - JC	David Rhainds
11/04/2023	08:30	11:30	Système histaminérergique	S1-111 - JC	Denis deBlois
13/04/2023	13:00	15:00	Évaluation des propriétés cardiovasculaires	S1-111 - JC	Sylvie Marleau, Jade Gauvin, Marie-Lynn Al-Hawat
<b>17/04/2023</b>	<b>09:00</b>	<b>12:00</b>	<b>Examen final</b>	<b>Examsoft Z-110 - CMN</b>	<b>Sylvie Marleau</b>

Légende des pavillons : JC : Pavillon Jean-Coutu, CMN : Claire-McNicoll

## 7. Contenu des cours

### Affinité et activité des ligands

David Huynh

- Loi d'action de masse
- Théorie de l'occupation des récepteurs
- États conformationnels du récepteur
- Mesure de l'affinité et de l'activité
  - Approche par liaison spécifique
  - Approche fonctionnelle
  - Approche par biologie moléculaire

### Récepteurs heptahélicoïdaux

Denis deBlois

- Classification
- Mécanismes d'activation
- Voies de signalisation, systèmes effecteurs
- Mécanismes de désensibilisation et recyclage

### Transmission cholinergique

Sylvie Marleau

- Synthèse et élimination de l'ACh
- Pharmacologie des agonistes muscariniques
- Pharmacologie des inhibiteurs des acétylcholinestérases
- Pharmacologie des antagonistes muscariniques
- Pharmacologie de la nicotine
- Pharmacologie des curarisants

### Transmission adrénergique

Sylvie Marleau

- Synthèse et élimination des catécholamines
- Pharmacologie des agonistes adrénergiques
- Pharmacologie des antagonistes adrénergiques
- Pharmacologie des inhibiteurs de la recapture
- Pharmacologie des IMAO

### Évaluation des propriétés cardiovasculaires

Sylvie Marleau

- Évaluation des propriétés cardiovasculaires chez l'homme et l'animal
  - Évaluation des effets dilatateurs et presseurs
  - Évaluation des effets inotropes et chronotropes
- Exercices pratiques
  - Interprétation de données
  - Application de statistiques
  - Rédaction d'un rapport sous la forme d'un abrégé de congrès

### Endothélium vasculaire

David Rhainds

- Rôle physiopathologique de l'endothélium vasculaire
- Pharmacologie du NO et des nitrates
- GC soluble

### Voie des nucléotides cycliques (AMP et GMP cycliques) et transmission purinergique

John Stagg

- Récepteurs à activité GC membranaire
- Pharmacologie des peptides natriurétiques
- Inhibiteurs des phosphodiesterases
- Pharmacologie des xanthines (caféine, théophylline)
- Pharmacologie de la milrinone et congénères
- Pharmacologie du Viagra et congénères
- ATP, ADP, adénosine, récepteurs et voies de signalisation

## Transporteurs membranaires

Simon Thibault

- Gradients ioniques transmembranaires
- Na-K-ATPase, Ca-ATPase
- Échangeurs Na-Ca, Na-H cardiaques
- Pharmacologie de la digitale

## Métabolites de l'acide arachidonique

Denis deBlois

- Cycloxygénases et prostanoïdes
- Pharmacologie des anti-inflammatoires non stéroïdiens
- Lipoxygénase et leucotriènes (LT)
- Pharmacologie des antagonistes et inhibiteurs de la voie des LT
- Autres lipides bioactifs

## Système histaminergique

Denis deBlois

- Biosynthèse et métabolisme de l'histamine
- Pharmacologie des anti-H1
- Pharmacologie des anti-H2
- Potentiel des récepteurs H3 et H4 comme cibles futures

## Hémostase

Georges Jourdi

- Anticoagulants, antithrombotiques, fibrinolytiques

## Transmission peptidergique I

Denis deBlois

- Systèmes rénine-angiotensine (SRA) et kallikréine-kinine
- Pharmacologie des inhibiteurs du SRA
- Pharmacologie des antagonistes de l'aldostérone

## Transmission peptidergique II

Sylvie marleau

- Rôle physiopathologique de certains peptides vasoactifs
  - Vasopressine
  - Ocytocine
  - Endothéline

## Cibles thérapeutiques du traitement des dyslipidémies

David Rhainds

- Inhibiteurs de la HMG-CoA réductase (statines)
- Agents séquestreurs de la bile
- Inhibiteurs de l'absorption du cholestérol et de la CETP
- Niacine
- Effets pléiotropiques des statines
- Traitement du syndrome métabolique

## Cibles thérapeutiques du traitement de l'obésité

David Rhainds

- Peptides régulateurs de l'appétit et du bilan énergétique
- Système des endocannabinoïdes
- Anorexigènes

## 8. Ressources

### Ouvrage de référence

- Landry, Y., Gies, J.-P., Sick, E. & Niederhoffer, N. (2019). *Pharmacologie : des cibles à la thérapeutique : cours et fiches thérapeutiques*. (4e éd.). Malakoff: Dunod. Consulter Sofia (UdeM, bibliothèque de la santé).
- Goodman, L. S., Brunton, L. L., Blumenthal, D. K., Murri, N., & Hilal-Dandan, R. (2018). *Goodman & Gilman's the pharmacological basis of therapeutics*. New York: McGraw-Hill Medical. Cliquez sur le lien suivant pour localiser le document <https://accessmedicine.mhmedical.com/book.aspx?bookid=2189> Accès réservé UdeM.
- Katzung, B. G., Vanderah, T.W. (2021) *Basic & Clinical Pharmacology*, (15th ed.). McGraw-Hill Medical. Cliquez sur le lien suivant pour localiser le document : [accesspharmacy.mhmedical.com/content.aspx?bookid=2988&sectionid=250593594](https://accesspharmacy.mhmedical.com/content.aspx?bookid=2988&sectionid=250593594) Accès réservé UdeM.

## 9. Évaluation

Seuil acceptable de performance (SAP) : 60 %

Objets d'évaluation	Technique (s) d'évaluation *	Ouvrage de référence	Pondération	Date d'évaluation jj/mm/aa	Durée de l'évaluation
Intra	1, 2, 3	Aucun	45 %	13-03-2023	3 heures
Final	1, 2, 3	Aucun	35 %	17-04-2023	3 heures
TP Affinité et activité	18		10 %		
TP Évaluation des propriétés CV	18		10%		

1. QCM (Questions à choix multiple)	10. Examen oral
2. QROC (Questions à réponse ouverte courte)	11. Jeu de rôles
3. QDC (Question à développement court)	12. Journal de bord
4. Observation directe	13. Mises en situation
5. Autoévaluation	14. Présentation express (3 min.)
6. Cartographie des connaissances	15. Présentation faite par l'apprenant
7. Débat/Panel	16. Question à développement
8. ÉCOS	17. Séance d'affichage
9. Évaluation par les pairs	18. Travail écrit

## 10. Particularités de l'évaluation

**Absence non motivée :** La note F\* (échec par absence) est attribuée à l'étudiant qui ne se présente pas à une évaluation, à moins qu'il ne justifie valablement son absence auprès du doyen ou de l'autorité compétente.

**Absence prévisible à une activité d'évaluation :**

L'étudiant doit motiver une absence prévisible à une activité d'évaluation dès qu'il est en mesure de constater qu'il ne pourra être présent; il appartiendra à l'autorité compétente de déterminer si le motif est acceptable.

**Remise en retard de travaux :**

Lorsque l'étudiant omet de remettre un travail dans les délais prescrits, le doyen ou l'autorité compétente peut fixer un nouveau délai et requérir que la correction du travail soit alors faite en tenant compte du retard.

**Évaluation continue des compétences transversales**

Les compétences transversales sont évaluées à plusieurs moments tout au long du programme.

---

## 11. Règlement disciplinaire sur le plagiat ou la fraude

En vertu de l'article 1.1 du règlement disciplinaire sur le plagiat et la fraude concernant les étudiants de premier cycle :

« **Constitue une infraction le fait pour un étudiant de commettre une fraude ou, intentionnellement, par insouciance, négligence ou méconnaissance des règles, tout plagiat** ainsi que : a) toute tentative de commettre ces actes ; b) toute participation à ces actes ; c) toute incitation à commettre ces actes ; d) toute concertation avec une ou plusieurs personnes en vue de commettre ou faciliter ces actes, même s'ils ne sont pas commis ou s'ils le sont par une seule des personnes ayant participé à la concertation. À moins d'indication contraire, **chaque étudiant est responsable pour l'entièreté de toute évaluation, tout travail ou toute activité effectués en groupe** et sera présumé, à défaut de preuve contraire, avoir participé à une infraction en lien avec cette Évaluation. »

L'étudiant doit prendre connaissance de l'ensemble du règlement disciplinaire sur le plagiat ou la fraude disponible ici :

[https://secretariatgeneral.umontreal.ca/public/secretariatgeneral/documents/doc\\_officiels/reglements/enseignement/ens30\\_3-reglement-disciplinaire-plagiat-fraude-etudiants-premier-cycle.pdf](https://secretariatgeneral.umontreal.ca/public/secretariatgeneral/documents/doc_officiels/reglements/enseignement/ens30_3-reglement-disciplinaire-plagiat-fraude-etudiants-premier-cycle.pdf)

**À noter : Tout enregistrement (audio ou vidéo) d'un cours ainsi que sa diffusion sont strictement interdits sans l'approbation écrite du professeur.**

---