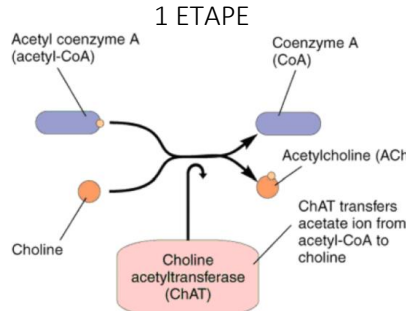


UE 1 : PHARMACOLOGIE – TRANSMISSION CHOLINERGIQUE

METABOLISME

SYNTHESE DE L'ACH	STOCKAGE	LIBERATION	INACTIVATION	MODULATION DE LA SYNAPSE
1 ETAPE  Acetyl coenzyme A (acetyl-CoA) Coenzyme A (CoA) Choline Acetylcholine (ACh) ChAT transfers acetate ion from acetyl-CoA to choline Choline acetyltransferase (ChAT)	Vésiculaire au niveau des terminaisons nerveuses + Co-stockage avec glutamate	Spontanée : rôle trophique Dépendant d'un PA : lib° massive d'ACh dans la fente synaptique : mouvement ions ⇒ migration des vésicules (+) : α-latrotoxine (-) : toxine botulique	Dégradation par acétylcholinestérase : ACh ⇒ choline recapturée + acétate	Lytiques : bloquent ou diminuent la transmission Mimétiques : reproduisent la transmission en stimulant le Rc post-synaptique ou blocage ACh estérase

RECEPTEURS CHOLINERGIQUES ET EFFETS CHOLINERGIQUES

MUSCARINIQUES						NICOTINIQUES	
Récepteur	Protéine G	Effets centraux	Fibres musculaires lisses	Effets sur les sécrétions	Effets cardiovasculaires	- NIVEAU CENTRAL : sécrétion NT, effets complexes et mal connus - NIVEAU GANGLIONNAIRE : - SNPΣ : libération ACh - SNΣ : libération NAd - Médullosurrénale : libération NAd - PLAQUE MOTRICE : contraction muscles striés squelettiques	
M1	q	↑ PA		↑ H ⁺ dans la cavité vésicale	Vasodilatation		
M2	i	↓ PA ↓ Exoçose	Non relaxation		↑ FC (cellules cardionectrices) ↓ FC (cardiomyocytes)		
M3	q	↑ PA	Contraction	↑			
M4	i	↓ PA ↓ Exoçose					
M5	q	↑ PA					

CHOLINOMIMETIQUES

DIRECTS

MUSCARINIQUES

- Acétylcholine – MIOCHOLE → Myosis
- Carbachol – MIOSTAT → Myosis
- Bétanéchol – MYOCHOLINE
→ Stimulation de la motricité GI et vésicale, traitement du reflux du nourrisson
- Pilocarpine – ISOPTOPILOCARPINE
→ Traitement du glaucome

NICOTINIQUES

- Nicotine - NICORETTE
- Varénicline – CHAMPIX

→ Traitement du sevrage tabagique

INDIRECTS

- ↑ synthèse : on ne sait pas faire
- ↑ libération ACh :
Prucalaprïde – RESOLOR → Traitement des atonies du clon en post-op
- Inhibiteurs dégradation :
 - Réversibles :
Ésérine – ANTICHOLIUM
Néostigmine – PROSTIGMINE
 - Réversibles centraux :
Rivastigmine – EXELON
Galantamine - RIMENYL
 - Irréversibles :
Malathion – PRIODERM

CHOLINOLYTIQUES

ANTAGONISTES

MUSCARINIQUES

- Mydriatiques :
 - Tropicamide – MYDRIATICUM
 - Cyclopentolate – SKIACOL
- Effet vésical (M2, M4) :
 - Toltérodine
- Bronchodilatateurs :
 - Ipratropium – ATROVENT
 - Protropium – SPIRIVA (M1, M5)
- Antispasmodiques intestinaux :
 - Trémonium – COLCHIMAX
 - Clidinium – LIBRAX
- Antiparkinsoniens :
 - Trihexyphénidyle – ARTANE
 - Tropatépine – LEPTICUR

NICOTINIQUES

- Ganglioplégiques : Penthonium
- Curarisants :
 - Vécuronium – NORCURON
 - Suxaméthonium (excès) - CELOCURINE

INHIBITEURS DE LA LIBERATION

Toxine botulique