

LES RÉCEPTEURS CANAUX

CORRECTION

QCM 1. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: AD

- A. Ils ont une structure pentamérique.
- B. Leurs ligands sont dans la majorité des cas des ions. **Non ! Ils permettent le passage d'ions mais les ligands sont des hormones, des neurotransmetteurs,...**
- C. Leurs sous unités s'assemblent pour former un pore laissant passer le ligand. **Les ions ! Bien maîtriser cette notion de différence entre ions et ligands**
- D. Ils sont dits chimio-dépendants.
- E. Ils fonctionnent en présence d'énergie uniquement (généralement sous forme d'ATP). **Jamais, uniquement grâce au gradient de concentration**

QCM 2. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: AC

- A. Ils peuvent être sous forme d'homopentamères.
- B. Ils possèdent des « cys-loop » extra cellulaires, ponts de cystéine servant la plupart du temps à capter les ions afin qu'ils puissent transiter. **Ligands**
- C. Le récepteur à la glycine est un récepteur canal anionique.
- D. Le récepteur ~~GABA B~~ est un récepteur canal anionique car il permet le passage d'un ion chlore en intra cellulaire. **GABA A**
- E. Les récepteurs à l'acétylcholine sont dits cationiques ~~car l'acétylcholine est une molécule chargée positivement quand elle est ionisée.~~ **Car le canal laisse passer les ions Na+**

QCM 3. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: AC

- A. La mise en présence d'un modulateur allostérique négatif dans un milieu contenant le récepteur et le ligand endogène entraînera une diminution de la puissance et de l'activité du ligand.
- B. La mise en présence d'un modulateur allostérique positif dans un milieu contenant un récepteur entraînera ~~une action similaire à celle suite à la mise en présence d'un agoniste partiel.~~ **Pas d'action des NAM en absence de ligand endogène.**
- C. Les antiépileptiques et les benzodiazépines agissent sur le même récepteur.
- D. L'alcool et les benzodiazépines agissent sur le même récepteur.

- E. L'entrée de Cl⁻ entraîne une ~~dépolarisation~~ de la cellule. **hyperpolarisation**

QCM 4. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: D

- A. Le flumazénil est l'antidote utilisé en cas d'intoxication aux ~~barbituriques~~. **BZD**
- B. Les modulateurs allostériques positifs du récepteur au GABA A vont avoir tendance, en présence de GABA, à ~~limiter la polarisation~~ de la cellule. **Au contraire ils hyperpolarisent**
- C. Les PAM du récepteur GABA A vont augmenter le flux ~~de GABA~~ à l'intérieur de la cellule. **De chlore**
- D. Le récepteur 5HT₃ possède deux sites de fixation à la sérotonine.
- E. L'alcool est un ~~NAM~~ du récepteur GABA A. **PAM**

QCM 5. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: ABCE

- A. Les agonistes du récepteur M₂ à l'acétylcholine sont bradycardisants
- B. Les canaux ioniques peuvent dépendre d'un récepteur, c'est le cas de certains canaux potassiques au niveau du coeur.
- C. On retrouve beaucoup de récepteur 5HT₃ dans le système nerveux central.
- D. Il existe au total ~~5~~ récepteurs à la sérotonine différents dont ~~1~~ récepteur canal, les autres sont des RCPG. **Il en existe 6**
- E. Le récepteur 5HT₃ est un récepteur cationique.

QCM 6. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: BCD

- A. Les curares sont des ~~anesthésiques~~ agissant au niveau de la plaque motrice et plus précisément au niveau du récepteur nicotinique à l'acétylcholine. **Pas des anesthésiques !! Ils sont utilisés pour faciliter l'intubation mais ils n'endorment pas**
- B. Que ce soit le récepteur nicotinique à l'acétylcholine ou le récepteur 5HT₃ à la sérotonine, les deux induisent l'entrée de sodium dans la cellule et la rendent donc plus excitable.
- C. L'entrée de sodium dans les cellules cardiaques induit une dépolarisation.
- D. Le récepteur muscarinique est un récepteur à l'acétylcholine situé au niveau du neurone post synaptique du système parasympathique.
- E. Le muscimol est un ~~médicament~~ agoniste du récepteur GABA A, il a donc un effet inhibiteur du SNC. **Pas un médicament**

QCM 7. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: AD

- A. Les agonistes du récepteur $5HT_3$ à la sérotonine auront tendance à causer nausées et vomissements.
- B. Le récepteur nicotinique a pour ligand endogène la ~~nicotine~~. **l'acétylcholine**
- C. La varénicline est un ~~antagoniste~~ partiel du récepteur à l'acétylcholine permettant le sevrage progressif. **Agoniste**
- D. Les anesthésiques locaux agissent sur des canaux sodiques en les bloquant.
- E. Les antiarythmiques agissent sur des canaux ~~calciques~~. **sodiques et potassiques**

QCM 8. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: CE

- A. Les stéroïdes sont à la fois des ~~PAM~~ du récepteur $5HT_3$ et des ~~NAM~~ du récepteur GABA A. **L'inverse**
- B. Les sétrons sont utilisés ~~couramment~~ comme anti vomitifs et anti nauséeux dans le cas ~~par exemple de gastroentérite ou de mal des transports~~. **Très onéreux donc pour nausées et vomissements suite à chimiothérapie ou anesthésie**
- C. L'alcool potentialise l'effet du GABA sur son récepteur.
- D. Les benzodiazépines sont des ~~agonistes~~ du récepteurs au GABA dont l'effet est antagonisé par le flumazénil. **PAM**
- E. L'augmentation du rapport ATP/ADP dans la cellule pancréatique est le résultat de la glycolyse.

QCM 9. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: B

- A. Le seul paramètre du ligand modifié en présence d'un NAM est sa puissance. **Son activité aussi**
- B. Pour traiter le diabète de type 1, on peut donner des médicaments bloqueurs des canaux KATP..
- C. Un ~~antagoniste~~ du récepteur au GABA aura tendance à inhiber le SNC et un surdosage risque d'entraîner le coma. **Agoniste**
- D. La fixation du GABA sur son récepteur ~~GABA B~~ entraîne l'entrée d'un ion chlore et l'hyperpolarisation de la cellule. **GABA A**
- E. L'activation du récepteur $5HT_3$ à la sérotonine ~~par un ion sodium~~ entraîne une dépolarisation. **Par la sérotonine !**

QCM 10. A propos des VOC il est exact que:

Réponses: ABDE

- A. Ce sont des hétéro-oligomères dont la sous-unité alpha 1 détermine le pore.
- B. Ils existent sous 3 états: activé, inactivé et dans un état de repos insensible aux médicaments.
- C. Les dihydropyridines bloquent les canaux Ca^{2+} cardiaques + :ils réduisent donc la fréquence cardiaque. **canaux Ca^{2+} vasculaires : ils réduisent donc la vasoconstriction.**
- D. Les bloqueurs des canaux potassiques peuvent être utilisés dans le traitement de l'épilepsie.

- E. Les ouvreurs des canaux potassiques peuvent être utilisés dans le traitement de la tachycardie

QCM 11. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: BD

- A. Les récepteurs canaux permettent le passage ~~de macromolécules~~ du compartiment le plus concentré vers le moins concentré. **le passage d'ions**
- B. Ils sont sous formes d'hétéropentamères : 2 sous-unités alpha, 2 sous-unités bêta et 1 sous-unité gamma.
- C. Le ligand se fixe sur un pont disulfure entre deux ~~cytosines~~. **cystéines**
- D. Le récepteur au GABA-C permet l'entrée d'ions Chlore dans la cellule, ce qui crée une hyperpolarisation.
- E. Les récepteurs nicotiniques sont des récepteurs ~~anioniques~~. **cationiques**

QCM 12. A propos des récepteurs canaux il est exact que:

Réponses: ABDE

- A. Les modulateurs allostériques positifs augmentent l'activité intrinsèque du ligand endogène.
- B. Les modulateurs allostériques positifs augmentent la puissance du ligand endogène.
- C. Les modulateurs allostériques agissent ~~sur le même site de fixation~~ que le ligand endogène.
- D. Le flumazénil est un supprimeur du sommeil.
- E. Il agit sur le même site que les Benzodiazépines.

ANNALES SUR CE CHAPITRE

Rangueil 2011. Concernant les récepteurs membranaires, quelle(s) est (sont) la (les) proposition(s) exacte(s)?:

Réponses: ACDE

- A. Les récepteurs à 7 domaines transmembranaires sont le plus souvent couplés aux protéines G.
- B. Le récepteur de l'insuline est un récepteur à activité ~~guanylyl-cyclase~~. **Tyrosine kinase**
- C. Le récepteur 5HT₃ est un récepteur ionotrope.
- D. Le GABA est un ligand orthostatique du récepteur GABA-A.
- E. Les BZD sont des ligands allostériques du récepteur GABA-A.

Rangueil 2013. M est une molécule déterminant la dépolarisation d'une cellule nerveuse en culture. Son effet est totalement réversé par le GABA mais partiellement prévenu par un agoniste sélectif du récepteur GABA-A. Concernant M, quelle(s) est (sont) la (les) proposition(s) exacte(s)?:

Réponses: A

- A. M se lie sur le récepteur GABA-B.
- B. M est un modulateur allostérique positif du récepteur GABA-A. **C'est un antagoniste compétitif donc forcément orthostérique.**

- C. M appartient à la famille des benzodiazépines. **Les BZD sont des ligands allostériques du GABA-A.**
- D. Sous l'effet de M, on s'attend à mesurer un courant entrant d'ions chlorure dans la cellule. **Au contraire, étant donné qu'on a une dépolarisation.**
- E. Le récepteur GABA-A possède 2 sous-unités alpha dont l'une lie le GABA et l'autre active le courant entrant de chlorure. **Chacune des sous unités alpha peut lier le GABA.**

Purpan 2014. Concernant les récepteurs ionotropes, quelle(s) est (sont) la (les) proposition(s) exacte(s)?:

Réponses: BC

- A. Ils possèdent tous un pont disulfure entre deux résidus de cystéines situés à l'intérieur de la cellule. **À l'extérieur car ils servent de liaison au ligand**
- B. Il s'agit d'hétéropentamères.
- C. Le récepteur γ HT₃ de la sérotonine est impliqué dans le vomissement.
- D. L'alcool est un modulateur allostérique positif du récepteur ~~GABA-B~~. **GABA-A**
- E. Les curares sont des ~~anesthésiques généraux~~ dont la cible est le récepteur nicotinique. **Ce sont des médicaments paralysants utilisés pendant les anesthésies mais pas des anesthésiques !! Attention piège récurrent.**

Purpan 2015. Concernant les récepteurs ionotropes, quelle(s) est (sont) la (les) proposition(s) exacte(s)?:

Réponses: ABCD

- A. Les curares interagissent avec un récepteur nicotinique.
- B. Tous les récepteurs ionotropes possèdent un pont cystéine-cystéine extra cellulaire.
- C. L'alcool potentialise les effets du GABA sur le récepteur GABA-A.
- D. La liaison des benzodiazépines sur le récepteur GABA-A peut être antagonisée par le flumazénil.
- E. La pénicilline est modulateur allostérique ~~positif~~ du récepteur GABA-A. **Négatif**

Purpan 2015. Concernant les récepteurs ionotropes, quelle(s) est (sont) la (les) proposition(s) exacte(s)?:

Réponses: A

- A. Ils sont activés par médiateur endogène.
- B. Ils fonctionnent sous forme ~~d'hétérodimères~~. **Hétéropentamères**
- C. La varénicline ~~inhibe~~ l'activité d'un récepteur nicotinique du système nerveux central. **C'est un agoniste.**
- D. Le flumazénil est antagoniste compétitif de la liaison des benzodiazépines sur un site allostérique du récepteur γ HT₃. **GABA-A**
- E. Sur une préparation exprimant un récepteur GABA-A, l'addition d'une benzodiazépine ~~suffit~~ à moduler positivement l'entrée d'ions chlore dans la cellule. **Les modulateurs allostériques ne suffisent jamais ! Ils n'ont d'effets que si ils sont en présence du médiateur endogène !**

Purpan 2011. A propos du récepteur GABA-A, quelle(s) est (sont) la (les) proposition(s) exacte(s) ? :

Réponses: BD

- A. Il est mis en jeu par le ~~voltage transmembranaire~~. **Par la liaison avec un ligand (GABA)**
- B. Il s'agit d'un récepteur ionotrope.
- C. Les benzodiazépines sont des agonistes ~~compétitifs~~. **Allostériques donc non compétitifs**
- D. Le flumazénil est un antagoniste allostérique.
- E. Il entraîne la ~~sortie~~ de chlore de la cellule. **L'entrée**

Ranguel 2018. Concernant les canaux calciques voltage-dépendants et leurs médicaments, quelle(s) est (sont) la (les) proposition(s) exacte(s) ? :

Réponses: AD

- A. Les canaux T se rencontrent sur les cellules du tissu nodal.
- B. La sous-unité α_2 est ~~intracellulaire~~. **Extracellulaire.**
- C. Le vérapamil ~~augmente~~ la pente de dépolarisation spontanée. **Diminue.**
- D. La pacesodipine appartient à la famille des dihydropyridines.
- E. La migraine hémiplegique familiale est liée à diverses mutations du gène $SCN5A$. **Gène $CNACA1A$.**