

PHARMACOLOGIE

Article L-511.1 du Code de la Santé Publique =

On entend par **médicament** toute substance ou composition présentée comme présentant des **propriétés curatives** (ex : antibiotiques) ou **préventives** à l'égard des *maladies humaines ou animales*, ainsi que tout produit pouvant être administré à *l'homme ou à l'animal*, en vue d'*établir un diagnostic médical ou de restaurer, modifier* (ex : contraceptif oraux) ou *corriger leur fonction organique*.

Un médicament = Principe(s) Actif(s) + Excipient(s)

Principe actif = substance susceptible de *prévenir* ou de *faire cesser un trouble déterminé de l'organisme*.

Excipient = substance ou mélange de substances inactives par elle-même sur la maladie qui, utilisé dans la formulation, *facilite la préparation et l'emploi du médicament*.

EEN = Excipients à Effet Notoire, ils sont précisés sur toutes les boîtes de médicaments ; certains patients auront des effets gênants à cause de certains excipients (ex : lactose, sodium, huile de sésame...).

On entend par **excipient à effet notable** tout excipient dont la présence peut nécessiter des précautions d'emploi pour certaines catégories particulières de patients.

Mise en *forme galénique* = transformation du principe actif sous une forme adaptée à l'usage thérapeutique (gélules, pommades, suppositoires, ...).

-*Conditionnement primaire* du médicament : rôle de protection, rôle fonctionnel (ex : flacon pour les sirops).

-*Conditionnement secondaire* du médicament : permet la manipulation, le transport du médicament ainsi que son identification et l'information du malade (ex : boîte en carton).

Exemple = efferalgan 500mg sachets

Principe actif : paracétamol.

Excipients : benzoate de sodium, monoglycérides, acétyles, povidone, dioxyde de titane, saccharine, arôme

orange.

Excipient à effet notoire : saccharose.

Forme galénique : poudre.

Conditionnement primaire : sachet.

Conditionnement secondaire : boîte.

Origine du principe actif :

I. Origine végétale = glucosides cardiotoniques.

II. Origine animale = héparine (extrait d'intestin de porc).

III. Origine minérale.

IV. Origine microbiologiques = culture de micro organismes (pénicillines).

V. Origine synthétique, hémi-synthétique.

VI. Origine biotechnologique = thérapie génique, recombinaison génétique (insuline humaine).

Allopathie = curatif, palliatif, préventif, substitutif.

Homéopathie = utilisation de médicaments à très faibles doses.

Exemple : IPECA, en allopathie = vomitif ; en homéopathie = correction des nausées.

A.M.M = *Autorisation de Mise sur le Marché* ; délivrée par l'AFSSAPS pour un médicament, pour une période de 5 ans (renouvelable).

A.S.M.R = *Amélioration du Service Médical Rendu* : avantages et inconvénients en terme d'efficacité et de tolérance, évaluation des progrès apportés par rapport aux thérapeutiques existantes.

Médicament générique = copie autorisé d'un médicament original dont le brevet est tombé dans le domaine public. Il s'agit d'une même molécule, sous la même forme galénique, au même dosage et soumis aux mêmes contrôles.

→ Importance des **Excipients à Effet Notoire**.

Le **VIDAL** = ouvrage professionnel référençant les médicaments.

Classement par DCI, par famille pharmacocinétiques, par ordre alphabétique.

Phase biopharmaceutique = elle va dépendre de la présentation galénique du médicament ; durée variée.

3 étapes : **L.D.A** =

Libération du principe actif ; Dissolution ; Absorption.

Phase pharmacocinétique = sort des médicaments dans l'organisme humain.

4 étapes : **A.D.M.E** =

Absorption ; Distribution ; Métabolisme ; Elimination.

ABSORPTION = **transfert** du **principe actif** depuis son **lieu d'administration** (cutané, digestif, nasal,...) vers la **circulation générale** (le sang).

>Absorption par :

Diffusion passive (de la région la plus concentrée à la région la moins concentrée / *pas d'apport d'énergie / ne peut être saturé*).

Diffusion facilitée (du plus concentré vers le moins concentré / *apport d'énergie / transporteur ~spécificité~ / peut être saturé*).

Transport actif (de la région la moins concentré vers la région la plus concentré / *apport d'énergie / transporteur ~spécificité~ / peut être saturé*).

L'*absorption* du médicament se fait essentiellement dans l'**estomac**.

La *vitesse d'absorption* détermine le *temps d'apparition du pic plasmatique*.

DISTRIBUTION = **répartition** des médicaments **dans l'organisme**, grâce à la *circulation sanguine*.

Fixation protéique sur l'albumine (forme liée et forme libre). La fixation sera différente suivant les médicaments.

0 à 99 % de substances fixées.

Constante d'affinité = coefficient exprimant l'affinité entre le médicament fixé et la protéine plasmatique.

Distribution tissulaire :

>*fixation* protéique de la molécule.

>*liaison* aux protéines tissulaires.

>*irrigation* des organes.

Foie, reins, coeur, poumons, cerveau = *vascularisation riche ; bonne action des médicaments*.

Peau, muscles squelettiques = *moins vascularisés ; difficulté d'action des médicaments*.

Un médicament est d'autant mieux distribué qu'il présente :

- une *faible liaison* aux protéines plasmatiques (la forme libre sera disponible pour les protéines tissulaires).
- Une *forte affinité* pour les protéines tissulaires.
- Une *liposolubilité importante*.

METABOLISME = **transformation des médicaments**, dans l'organisme, en **métabolites** plus hydrosolubles que le composé initial, par des processus enzymatiques (sur tout dans le foie).

ELIMINATION = par les reins, le foie, les poumons, les intestins.

Notion de **demi-vie** : temps au bout duquel la moitié de la quantité administrée a été éliminée.

Facteurs capables de modifier l'élimination : facteurs physiopathologiques (insuffisance rénale, modification de la fixation protéique) / facteurs exogènes (modification du pH urinaire).

Cinétique plasmatique des médicaments : *évolution des concentrations plasmatiques d'un principe actif ou intensité de l'effet en fonction du temps.*

La biodisponibilité = quantité de médicament « mis à disposition » dans le plasma ; concentration maximum (pic plasmatique), temps nécessaire pour obtenir cette concentration maximum.

Phase pharmacodynamique = effet propre de chaque médicament sur tel système, tel organe, tel tissu du corps humain.

Voie d'administration des médicaments :

★ **VOIE GENERALE (SYSTEMIQUE) =**

>la voie orale (formes liquides ; formes solides).

>la voie parentérale (ou transcutanée) = voie intradermique, voie sous-cutanée, voie intramusculaire, voie intraveineuse,...

>la voie perlinguale (solutions, comprimés, granules, globules).

>la voie rectale (suppositoires, capsules rectales, pommades rectales,...).

★ **VOIES LOCALES =**

>la voie oculaire (collyres, pommades ophtalmiques,...).

>la voie auriculaire (solutions auriculaire).

>la voie vaginale (ovules, comprimés vaginaux, mousses gynécologiques).

★ **VOIE GENERALE OU LOCALE =**

>la voie cutanée (crèmes, pommades, lotions,...).

- >la voie pulmonaire (administration de gaz, de liquides volatiles, d'aérosols).
- >la voie nasale (pommades nasales, poudres à inhaler...).

Mécanisme d'action des médicaments :

action *substitutive* (correction d'une carence) ; *mécanique* ; *effets sur une substance naturelle* (= neurotransmetteurs : adrénaline, acétylcholine, dopamine) ; *interférence avec des processus cellulaires*.

Couplage du principe actif sur les récepteurs. Les neurotransmetteurs (adrénaline pour le SN sympathique ; acétylcholine pour le SN parasympathique) vont pouvoir se fixer sur les récepteurs spécifiques. (l'adrénaline se fixe sur les récepteurs alpha et bêta).

AFFINITE pour un type de récepteur : tropisme d'une molécule pour un récepteur ou un tissu.

SELECTIVITE pour un type de récepteur : fixation préférentielle sur le récepteur pour laquelle l'affinité est la plus grande.

AGONISTE : le médicament se fixe aux récepteurs physiologique des neurotransmetteurs ou des hormones et déclenche les mêmes réactions.

ANTAGONISTE : le médicament va occuper les récepteurs et empêche les neuromédiateurs ou les hormones de se fixer et d'agir.