

1- Définition de la pharmacologie :

La pharmacologie est définie comme « la Science qui traite la source des propriétés physiques et chimiques, des effets biochimiques et physiologiques, des mécanismes d'action et des usages thérapeutiques des médicaments ». Pour ce faire, la pharmacologie intègre des concepts et données issus de la physiologie, physio-pathologie, biochimie, génétique et biologie moléculaire.

La pharmacologie comprend principalement :

La pharmacogalénique, c'est la science qui s'occupe de la préparation, de la présentation et de la conservation des produits pharmaceutiques

La pharmacodynamie, qui étudie les effets des médicaments sur l'organisme qu'ils soient bénéfiques ou indésirables.

La pharmacocinétique, qui étudie le sort des médicaments dans l'organisme, c'est-à-dire leur absorption, distribution, transformation et élimination.

2- Définition du médicament :

Médicament : en latin. Medicamentum : Drogue. Le Code de la Santé Publique français définit le médicament humain comme « toute substance ou composition présentée comme possédant des propriétés curatives 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, corriger ou modifier leurs fonctions organiques ».

3- Composition du médicament :

3-1- Le Principe actif (PA)

Le principe actif est la molécule mère (ou la base) du médicament destiné à l'action pharmacologique souhaitée. C'est la partie du médicament qui lui confère ses propriétés curatives ou préventives.

3-2- Adjuvant

Adjuvant (Ajouter) ou Auxiliaire (Accompagner) : C'est la molécule qui ajoute son action au principe actif pour contribuer à un meilleur effet pharmacologique, cette molécule doit être précisée en parallèle avec le PA.

Exemple : Anesthésique local + Vasoconstricteur.

3-3- Excipient ou véhicule

Un excipient est une substance (en quantité suffisante) sans action pharmacologique dans le but de donner à la molécule une forme galénique (médicamenteuse) appropriée et doit fournir avec elle un mélange parfaitement homogène.

En plus de son rôle galénique, l'excipient idéal doit être chimiquement stable, non réactif vis à vis de la substance active et des autres excipients, inerte vis à vis du corps humain ou animal et enfin être bien caractérisé pour être accepté par l'industrie et les instances de régulations.

L'excipient doit toujours être compatible avec le PA, et Il ne donne pas des effets notoires (évidents), ex: réactions allergiques ou intolérance pour les personnes intolérants au lactose Il doit libérer rapidement le principe actif si on veut une action rapide ou lentement si on recherche une action retardée

L'excipient est toujours exprimé dans la composition du médicament par le QSP : quantité suffisante pour (former et véhiculer) une unité du principe actif (ml ou mg ou UI). Cependant, il reste un élément secondaire et facultatif à la composition du médicament.

Les excipients sont classés selon leur fonction en :

- *Intermèdes (Intermédiaire)* : Éléments chimiques qui facilitent l'homogénéité de médicament complexe, lorsque deux ou trois molécules de la composition sont chimiquement dissociables, c'est le cas des crèmes et des pommades par exemple
- *Correctifs (édulcorants)* : Éléments qui sont rajoutés dans le but de corriger : le goût, l'odeur permettant de rendre une préparation destinée à la voie orale agréable et/ou de masquer le mauvais goût d'un principe actif.
- *Colorants* : Substances colorées servant de témoin d'homogénéité d'un mélange de poudres.

- *Agrégants* : Excipients qui assurent la cohésion d'un mélange de poudres et permettent la réalisation de comprimés.
- *Conservateurs* : Substances destinées à empêcher la dégradation chimique ou l'altération microbiologique d'un médicament.

Notion de Placebo

C'est une appellation donnée à toute préparation dépourvue de PA (principe actif). Le placebo ne contient que l'excipient et possède la même forme que le médicament.

Le placebo est utilisé surtout pour son action psychologique, on parle « d'effet placebo ». Il ne possède aucun effet pharmacologique réel. Lors des essais cliniques, pour le développement du futur médicament, le placebo est utilisé comme « Témoin », pour vérifier que l'excipient n'a pas d'influence sur les résultats de l'expérimentation.

4- Origine des médicaments :

Les médicaments peuvent être d'origines diverses :

4-1- Naturelle :

Les drogues appartiennent aux trois règnes : végétale, animale et minérale :

4-1-1- Médicament d'origine végétale :

L'utilisation des plantes en thérapeutique (phytothérapie) est très ancienne et connaît actuellement un regain d'intérêt. Il est possible d'utiliser les plantes entières (tisanes) ou les produits d'extraction qu'elles fournissent (huiles essentielles). Beaucoup de principes actifs utilisés en thérapeutique sont extraits des plantes : alcaloïdes (quinine, Morphine), hétérosides (Digitaline).

4-1-2- Médicament d'origine animale :

Sang et plasmas humains, Sérums thérapeutiques humains ou animaux, principes actifs obtenus par extraction (hormones et enzymes essentiellement): Insuline (hormone antidiabétique extraite du pancréas), Héparine: médicament anticoagulant extrait des poumons.

4-1-3- Médicament d'origine minérale :

Utilisé comme principes actifs ou excipients : eau, argiles, bicarbonate de Ca⁺, iode,

argent, chlorure de Na⁺

4-1-4- Synthétique ou artificielle :

De très nombreux médicaments sont obtenus par synthèse, ils ont le même effet de la molécule naturelle lors de la fixation sur des récepteurs spécifiques, exp: Sulfamides, Chloramphénicol.

4-1-5- Semi artificielle ou semi synthétique

Une substance naturelle inactive peut être modifiée au laboratoire et transformée en médicament dont l'assemblage et la modification seront assurés par des moyens chimiques. Par exemple la série de pénicillines hémisynthétiques qui ont été obtenues à partir de l'acide amino-6-pénicillinique, lui-même retiré des cultures du pénicillium

5- Les différentes catégories des médicaments

On distingue :

- **Les médicaments princeps ou originales** : sont préparés par l'industrie pharmaceutique. Elles doivent obtenir une autorisation de mise en marché (AMM).
- **Les médicaments génériques** : Après 20 ans de commercialisation, un médicament tombe dans le domaine public, c'est-à-dire que tout laboratoire peut le fabriquer et le commercialiser, le générique est une copie conforme du princeps à un prix inférieur.
- **Les médicaments magistraux**, sont très rares et réalisés par le pharmacien à partir d'une formule rédigée par un médecin pour un seul malade ;
- **Les médicaments officinaux**, sont préparés par le pharmacien à partir d'une formule inscrite sur un formulaire officielle, la pharmacopée française.

6- Les grandes utilisations des médicaments

Les médicaments peuvent être classés en quatre grands groupes selon leurs effets :

Les médicaments symptomatiques, les plus nombreux, guérissent les symptômes et non la maladie



Les médicaments curatifs, malheureusement peu nombreux, guérissent le malade en s'attaquant la cause de la maladie exp: les antibiotiques



les médicaments préventifs, protègent le sujet sain d'une maladie (vaccin) ou modifient temporairement un processus physiologiques (contraceptifs oraux)



Les médicaments substitutifs, remplacent un constituant physiologique de l'organisme qui fait défaut (vitamines, insuline)

7- Dénomination

Tout médicament est présenté sous une appellation spéciale. Il a un nom chimique, une dénomination commune internationale et un nom de spécialité.

7-1- Dénomination scientifique

Elle correspond à la nomenclature chimique (nom chimique) du composé. Elle est élaborée en tenant compte des règles de nomenclature très strictes édictées par l'IUPAC (International Union of Pure and Applied Chemistry). Elle présente l'avantage d'être univoque, mais à l'inconvénient d'être compliquée, longue à écrire et à lire et difficile à retenir.

Exemple : Acide Acétyl Salicylique

Sodium 3,3- diméthyle 7- oxo 6 – phényl acétamido 4 - thia-azabicyclo 3,2 heptane
2 carbocyclate

7-2- Dénomination Commune Internationale (DCI)

Elle correspond au nom attribué à la molécule mère, nom simple, pratique à l'emploi et utilisable partout dans le monde, il est proposé par l'OMS (Organisation Mondiale de la Santé).

Exemple : L'ASPIRINE est la DCI de l'Acide Acétyl Salicylique.

La PENICILLINE est la DCI de Sodium 3,3- diméthyle 7- oxo 6 – phényl acétamido 4
- thia-azabicyclo 3,2 heptane 2 carbocyclate

La DCI est de ce fait souvent préférée. Plus condensée, elle s'inspire de la structure chimique de la molécule.

Elle est construite à partir de segments clés qui sont soit des préfixes soit des suffixes permettent de situer une substance chimique dans une classe pharmacologique. Les principaux segments clés figurent dans le tableau suivant :

Tableau 1: Principaux segments pour la DCI et leurs significations

| Syllabe | Signification Pharmacologique | Exemple de DCI |
|----------------|---|---------------------------|
| Andr ou Stan | Stéroïdes androgènes | Androstanolone Stanozolol |
| Arol | Anticoagulant dérivés de la coumarine | Acénocoumarol |
| Caïne | Anesthésiques locaux | Lidocaïne |
| Cef | Antibiotiques possédant un noyau acide céphalosporanique | Céfaloridine |
| Cilline | Antibiotiques possédant un noyau dérivé de l'acide amino-6 pénicillanique | Cloxacilline |
| Cycline | Antibiotiques dérivés des Tetracyclines | Doxycycline |
| Est | Estrogènes | Benzestrol |
| Gest | Stéroïdes progestatifs | Norgestrel |
| Ium | Ammoniums quaternaires | Benzalkonium |
| Sulfa | Sulfamides antibactériens | Sulfadiazine |

7-3- Dénomination spéciale

Elle est choisie et enregistrée par le fabricant pour commercialiser son médicament, c'est le nom marque ou le Nom déposé (ND).

Exemple:

ASPEGIQUE®, ASPIRINE 500®, CATALGINE® : Ce sont des noms déposés de l'ASPIRINE.

AMOXIL, CLAMOXYL, EXTENCILLINE, ORACILLINE : ce sont des exemples des ND de la PENICILLINE

La dénomination spéciale est suivie de : ND. ou d'un astérisque : « * » ou : « ® » Registered (c'est un nom commercial protégé, officiellement enregistré : aucun autre fabricant n'a le droit de le copier à moins de changer une lettre ou plusieurs lettres).

Elle est protégée par la loi sur les marques de fabrique. Aucune règle ne préside à son choix. Les noms de spécialités sont en général plus faciles à mémoriser. Dans ce domaine, l'imagination est reine et la création d'un nom de marque se réfère aux seuls impératifs commerciaux.

De nombreux noms déposés peuvent correspondre au même principe actif médicamenteux lorsque l'exploitation de celui-ci n'est plus sous brevet et tombe dans le domaine public. Cette dénomination spéciale est établie :

- Soit en imaginant un nom de fantaisie pouvant rappeler l'action thérapeutique, l'origine du principe actif, le nom du laboratoire
- Soit en associant à la dénomination scientifique ou commune le nom du laboratoire fabricant.

Exemples : Collyre à l'atropine CHIBRET, Aspirine UPSA Exemple de dénominations pour un même médicament (Principe Actif):

Dénomination scientifique : (Diméthyl amino-3 propyl)-10 phénothiazinyl-3)-1 éthanone-1

Dénomination commune : Acépromazine

Dénomination spéciale : CALMIVET®, VETRANQUIL®

Remarque

La dénomination spéciale comprend deux appellations:

Princeps : c'est le nom commercial du médicament donné par le laboratoire qui l'a conçu et fabriqué (Princeps : de primus (« premier ») et capio (« prendre »), étymologiquement : celui qui est le premier à prendre l'initiative.

Générique : c'est le nom commercial donné aux différentes copies d'un médicament original fabriquées dans d'autres laboratoires que le laboratoire d'origine, après la période d'exclusivité (expiration du brevet du premier laboratoire).

Exemple: DCI: Loratadine / Princeps: Clarityne / Générique: Akarid

8- Classification pharmaceutique

On peut définir des classes de médicaments de différentes manières. La classification des médicaments tient compte des classes thérapeutiques des principales fonctions pharmacologiques (regroupées en classes pharmacologiques) et des structures chimiques du principe actif, désignées par leur DCI.

Les médicaments se classent en effet selon deux types de propriétés (qui sont étroitement liées): les propriétés thérapeutiques et les propriétés pharmacologiques; on parlera donc de classes thérapeutiques et de classes pharmacologiques. Il en sera ainsi dans ce cours.

8-1- Classes thérapeutiques

C'est une classification conçue selon la pathologie traitée. Les classes thérapeutiques sont présentées dans le Vidal ou le Dictionnaire thérapeutique (en Médecine humaine) et le DMV ou le DMVM (en médecine vétérinaire).

8-2- Classes pharmacologiques

A l'intérieure de chaque classe thérapeutique on a plusieurs "Classes pharmacologiques" (l'action du principe actif sur l'organisme),

Exemple 1 : parmi la classe thérapeutique des "Anti-infectieux", on distingue les classes pharmacologiques suivantes : Antibiotiques, Antiseptiques, Antiparasitaires, Antifongiques, Antiviraux.

A l'intérieure de chaque classe pharmacologique on a plusieurs "Catégories pharmacologiques"

Exemple 2: parmi la classe pharmacologique des antibactériens ou antibiotiques, on distingue les catégories pharmacologiques suivantes: les Bêta-lactamines, les Macrolides, les Tétracyclines.

A l'intérieure de chaque catégorie pharmacologique, on a plusieurs "Groupes pharmacologiques"

Exemple 3 : parmi la catégorie pharmacologique des Bêta-lactamine, on distingue les groupes pharmacologiques suivants : Pénicillines et Céphalosporines.

*** De fait de la complexité de la classification des médicaments, ces derniers sont regroupés en « classes thérapeutiques » ou « Familles thérapeutiques » ou bien "**classe pharmaco-thérapeutiques**"

D'une manière générale, les médicaments sont : soit spécifiques à une seule famille thérapeutique soit concernent quelques familles thérapeutiques (c'est le cas de l'ASPIRINE).

Remarque : Le système de classification ATC (Anatomique, Thérapeutique, Chimique) a été conçu dans les années 1970 puis recommandé comme standard international par l'OMS en 1996. C'est un système d'inventaire des préparations à usage thérapeutique auxquelles est attribué un code pouvant servir à leur classement.

C'est un outil didactique et administratif de regroupement des médicaments par classes en fonction de leur catégorie thérapeutique. La version vétérinaire du système ATC, ATCvet, est basée sur les mêmes principes que le système ATC des médicaments humains. Elle a été élaborée de manière harmonisée à partir de 1990, puis reconnue et soutenue par l'OMS comme standard international à partir de 2001

Parmi les médicaments, on trouve les familles thérapeutiques suivantes :

- Les anesthésiants, qui suppriment temporairement la douleur ex: KETAMINE
- Les analgésiques, qui éliminent la douleur ex: CODEINE
- Les antalgiques, qui diminuent la douleur ex: ASPIRINE
- Les sédatifs (calmants= tranquillisants), qui diminuent l'activité d'un organe ex: DIAZIPAM
- Les antipyrétiques, qui agissent contre la fièvre ex: ASPIRINE

- Les anti-inflammatoires, qui agissent contre l'inflammation ex: ASPIRINE
- Les antihistaminiques, qui agissent contre l'allergie ex: LORATADINE
- Les antibiotiques s'attaquent aux bactéries ex: PENICILLINE
- Les antiviraux, qui agissent contre les virus ex: ACICLOVIR
- Les antiparasitaires, qui agissent contre les parasites ex: CHLOROQUINE
- Les antimycosiques ou antifongiques qui agissent contre les champignons ex: KETOCONAZOLE

9- Le développement et la conception d'un médicament :

Le développement d'un médicament, de la validation d'une hypothèse scientifique à la commercialisation, nécessite en moyenne 10 à 15 ans. Cette période est généralement scindée en 3 étapes.

9-1- L'étape de criblage ou « screening »

Cette phase de recherche a pour objectif de découvrir les candidats médicaments, à savoir les composés qui vont agir le plus efficacement sur une pathologie définie.

Une fois les composés les plus prometteurs sélectionnés, ceux-ci seront testés au cours du développement préclinique, puis clinique pour certains.

9-2- Le développement préclinique

Les études précliniques permettent d'acquérir les premières connaissances sur le comportement d'un candidat médicament, indispensable avant les essais chez l'homme. Les expérimentations sont essentiellement menées sur l'animal.

Au cours du développement préclinique, un grand nombre d'études sont effectuées afin de qualifier le candidat médicament sur le plan de la pharmacologie, de la pharmacocinétique et de la toxicologie. Ces études seront alors intégrées au dossier de demande d'Autorisation de Mise sur le Marché (ou AMM) du futur médicament, délivrée par les autorités de santé.

- **Les études de pharmacologie** : elles ont pour but de valider le mécanisme d'action et mesurer l'activité du candidat médicament.
- **Les études de pharmacocinétique** : permettent de décrire le comportement et le devenir du composé dans un organisme vivant.
- **Les études de toxicologie** : visent à établir quels sont les organes cibles et les doses toxiques du candidat médicament.

A partir des résultats de ces études, les doses à administrer chez l'homme (lors des essais cliniques) seront déterminées afin de réduire les risques au maximum.

Enfin, une partie du développement préclinique, appelée évaluation du risque environnemental a pour objectif de mesurer l'impact de la mise sur le marché d'un nouveau médicament pour l'environnement.

9-3- Le développement clinique

Les essais cliniques sont les essais systématiques d'un médicament chez l'homme afin d'en vérifier les effets et/ou d'identifier tout effet indésirable et/ou d'en étudier l'efficacité et la sécurité d'emploi.

Le déroulement des études cliniques est encadré de manière internationale par des réglementations qui garantissent le suivi médical étroit et la protection des participants aux études. En France, comme partout en Europe, le lancement d'une étude clinique n'est possible qu'après autorisation par les autorités de santé.

Cette phase de développement correspond à 4 types d'études conduites sur l'homme :

- **Les études cliniques de phase 1** : elles sont réalisées sur des petits effectifs de volontaires non malades et ont pour but d'étudier la tolérance (capacité de l'organisme à supporter, sans effets gênants, l'administration du médicament) et le devenir dans l'organisme du médicament.
- **Les études cliniques de phase 2** : elles sont réalisées sur un petit nombre de personnes malades et ont pour objectif de déterminer la dose optimale en termes d'efficacité et de tolérance du candidat médicament.
- **Les études cliniques de phase 3** : elles sont réalisées sur un grand nombre de volontaires malades et visent à répondre à la question du bénéfice du médicament pour le patient ainsi qu'à identifier les risques potentiels. L'objectif, à terme, est d'évaluer le rapport bénéfice/risque. S'il existe déjà un traitement de référence, des études comparatives sont menées entre le candidat médicament et le traitement de référence.
- **Les essais cliniques de phase 4** : ils sont menés après la mise sur le marché du médicament (en post AMM) et permettent, le plus souvent, d'améliorer les conditions d'utilisation du médicament.

10- Le conditionnement des médicaments :

Tous les médicaments ont une « date de péremption » qui est la date limite d'utilisation au-delà de laquelle le produit doit être jeté. Cette date est portée en clair sur l'emballage.

Le conditionnement est en verre (ampoules, flacons), en matières plastiques, en aluminium (pommades), ou en complexes aluminium-polyéthylène (conditionnements unitaires des comprimés et des suppositoires).

Il donne au médicament son aspect définitif que l'on trouve dans les pharmacies et a pour but :

- De rendre facile l'utilisation du médicament par le malade ;
- De porter un étiquetage conforme à la législation pour la sécurité du malade ;
- D'être inerte vis-à-vis du médicament ;
- De protéger le médicament des chocs et de tous les facteurs possibles d'altération : lumière, vapeurs d'eau

11- Les règles de prescription des médicaments :

L'étape terminale de l'acte médical est l'établissement d'ordonnances, d'attestations, de rapports médicaux, de documents ou de certificats médicaux.

Cette rédaction doit être conforme aux constatations que le médecin est en mesure de faire. Les documents sont une source inépuisable d'actions devant les juridictions civiles, pénales ou disciplinaires.

11-1- L'ordonnance médicale :

L'ordonnance médicale se définit comme un message ou un écrit, contenant une prescription médicale, ordonnée par le médecin au destinataire qu'il soit : malade, pharmacien, confrère ou une caisse de sécurité sociale.

Elle pourra comprendre soit une prescription médicale, soit une demande d'examen complémentaires, mais aussi des conseils hygiéno-diététiques.

11-1-1- Caractères d'une ordonnance :

Il est indispensable qu'une ordonnance médicale soit :

- **Présentable** : sur papier propre et non froissé.
- **Claire** : comprenant le nom du médicament (en majuscules de préférence), sa présentation (ampoules, comprimés...) et enfin sa posologie.
- **Lisible** : le malade doit pouvoir lire et comprendre sans peine les instructions qui lui sont destinées. Cela permettra au pharmacien d'éviter des erreurs et des confusions entre noms médicamenteux qui se ressemblent.

Le prescripteur peut rédiger l'ordonnance manuellement ou par micro-ordinateur.

11-1-2- Rédaction d'une ordonnance :

La prescription d'une ordonnance comprendra des mentions obligatoires et des mentions facultatives souhaitables.

11-1-2-1- Mentions obligatoires :

- Nom du médecin.
- Nature du médicament, posologie, mode d'administration et la durée du traitement.
- Date et signature du médecin.

11-1-2-2- Mentions facultatives :

- Titres universitaires ou hospitaliers.
- Nom du malade.
- Age du malade (indispensable pour les enfants).
- Sexe du malade.

Dans la prescription, le fractionnement dans la journée sera indiqué préférentiellement de la manière suivante :

Exp: 2 CP matin, midi et soir au lieu de : 2 CP x 3/j et de: 6cp en 3 fois.

Le dépassement des doses du Codex (Vidal) est possible à condition de débiter la prescription par « je dis ».

Les prescriptions non médicamenteuses (les règles d'hygiène corporelle et alimentaire) peuvent être rédigées sur des feuilles séparées.

11-2- Prescription des différentes substances vénéneuses :

Certaines substances douées d'activité dangereuse ont été classées dans des tableaux C, A, B, afin de prévenir des accidents et d'empêcher une utilisation frauduleuse ou criminelle.

Tableau C:

Il regroupe les substances dites « dangereuses » de toxicité assez faible.

Exp: antibiotiques, anti-inflammatoires non stéroïdiens, barbituriques et sulfamides. La rédaction de l'ordonnance comportera les indications suivantes :

- Date.
- Nom et adresse du médecin.
- Nom du malade.
- Nature des médicaments prescrits.
- Quantité prescrite en toutes lettres.
- Mode d'administration.
- Signature du médecin.
- La durée dépend de la pathologie.
- Le renouvellement d'achat est possible sauf si indication contraire.
- Etiquetage (cadran): vert.

Tableau A:

Il regroupe les substances dites « toxiques » qui peuvent par surdosage entraîner des accidents graves.

Exp: digitalines, corticoïdes, sulfamides hypoglycémiantes.

La rédaction est la même que pour le tableau C.

- La durée : normale.
- Le renouvellement d'achat : inscription non renouvelable sauf si indiquée par le médecin.
- Etiquetage : rouge.

Tableau B:

Comporte les substances dites « stupéfiants » ou encore « narcotiques », ceux sont en général des analgésiques centraux et ils ont un effet toxicomangène.

Exp: Morphine, l'opium.

La réglementation est encore plus restrictive :

- Le médecin devra inscrire sa prescription sur un carnet à souches, contenant des feuillets numérotés délivrés par le conseil de l'ordre des médecins ou par la DSP.
- La morphine ne pourra être prescrite que sous forme de soluté injectable ou de sirop et non à l'état naturel.
- La rédaction est la même que pour les tableaux A et C, mais il devra indiquer le nom et l'adresse du malade.
- La durée ne peut excéder 7 jours.
- Le renouvellement est impossible.
- Etiquetage : rouge.

11-3- Fondement juridique :

La rédaction médicale est un exercice dangereux, car il peut engager la responsabilité civile, pénale ou disciplinaire du rédacteur.

Code de déontologie :

✓ Article 13 : «Le médecin est responsable de chacun de ses actes professionnels, ne peut exercer que sous sa véritable identité, tout document qu'il délivre doit porter son nom et sa signature »

✓ Article 56 : «toute prescription, certificat, attestation ou document établi par un médecin doit être rédigé lisiblement et permettre l'identification du signataire et comporter la date et la signature du médecin».

✓ Article 57 : « Sans céder à aucune demande abusive de ses malades, le médecin doit s'efforcer de leur faciliter l'obtention d'avantages sociaux auxquels leur état de santé leur donne droit ».

✓ Articles 58 : « La délivrance d'un rapport tendancieux ou d'un certificat de complaisance est interdite ».

12- Voies d'administration des médicaments :

Il existe plusieurs voies d'administration qui ont toutes des avantages et des inconvénients. Lorsqu'on recherche un effet général, le médicament est administré par voie buccale ou parentérale. Si l'on veut obtenir un effet local, on utilise des préparations spéciales comme les collyres, les pommades.....

12-1- Voie orale ou voie buccale

C'est la voie la plus utilisée (70 à 80 % des médicaments). Après administration orale, le médicament traverse la barrière intestinale puis le foie avant d'atteindre la circulation générale et de là les organes pour son action thérapeutique.

12-1-1- Avantages

- L'administration de médicaments par cette voie est aisée.
- Elle est bien acceptée par le patient.
- Des doses élevées peuvent être prises en une seule fois.

12-1-2- Inconvénients

→ Les médicaments empruntent la veine porte et passent par le foie où ils peuvent être dégradés par diverses enzymes ou être excrétés par voie biliaire. Si le passage par le foie est important, l'activité du médicament peut être considérablement diminuée (aspirine, propranolol, trinitrine, par exemple).

→ Il y a irritation du tube digestif par certains médicaments (anti-inflammatoires, corticostéroïdes...). La voie orale devra donc être évitée en cas d'ulcère gastroduodéal ou de gastrite.

Elle ne peut pas être utilisée pour les médicaments détruits par le tube digestif (hormones peptidiques comme l'insuline, par exemple).

→ L'action n'apparaît qu'après un temps de latence correspondant au temps d'absorption (l'absorption est plus rapide à jeun).

→ Parfois l'absorption est incomplète, voire nulle (certains sulfamides, les sels métalliques).

→ L'odeur et le goût des médicaments sont parfois désagréables (d'où l'emploi d'aromatisants).

→ La voie orale est difficile d'utilisation en cas de nausées et de vomissements.

→ Elle ne peut pas être utilisée chez un patient inconscient.

12-2- Voie parentérale ou voie injectable

C'est la voie la plus directe, car elle met directement en contact le médicament avec le sang ou les liquides interstitiels et évite le tractus digestif (tableau). Les médicaments administrés par voie parentérale sont les préparations injectables liquides (solutions, émulsions, suspensions) ou solides (les implants).

12-2-1- Avantages

→ Effet rapide, surtout après administration intraveineuse.

→ Passage immédiat dans l'organisme.

→ Pas de destruction par les enzymes du tube digestif qu'elle permet d'éviter.

→ Injection possible au lieu désiré (par exemple injection intracardiaque).

→ Voie utile pour un malade inconscient ou incapable d'avaler.

12-2-2- Inconvénients

→ L'injection est parfois douloureuse.

→ Elle peut entraîner un risque d'infection.

→ Il y a des difficultés en cas d'injections répétées, car le nombre de points d'injection est limité.

→ Les suspensions injectables ne peuvent être administrées que par voie intramusculaire.

→ Il ne faut pas injecter des produits irritants qui pourraient léser la veine.

→ La durée d'action médicamenteuse est généralement courte, surtout après administration intraveineuse.

→ Les médicaments administrés par voie parentérale doivent être stériles et apyrogènes.

Tableau 2 : Différents modes de pénétration par voie parentérale

| Voie d'administration | Abréviation | Lieu d'injection |
|-----------------------|-------------|---|
| Intraveineuse | IV | Veine au pli du coude, main, poignet |
| Intramusculaire | IM | Muscles fessiers |
| Intra-artérielle | IA | Artère fémorale |
| Intracardiaque | IC | Muscle cardiaque |
| Sous-cutanée | SC | Sous la peau, dans le tissu conjonctif (ventre, épaule, cuisse) |
| Intradermique | ID | Sous la peau, à la limite de l'épiderme et du derme |
| Épidurale | – | Espace épidural (ou péri-dural) |

12-3- Voies transmuqueuses

12-3-1- Voie perlinguale

Elle correspond à la muqueuse linguale et aux muqueuses du plancher, de la bouche, et de la face interne des joues. On administre par cette voie des petits comprimés que l'on place sous la langue (glossettes), des solutions aqueuses ou alcooliques, des granules (homéopathie).

C'est une voie d'administration facile, pratique et rapide permettant une pénétration directe du médicament dans la circulation générale, sans passer par le foie, ce qui évite l'effet de premier passage hépatique.

Seuls les médicaments ayant des effets pharmacologiques puissants peuvent être utilisés par cette voie (adrénaline, estrogènes, androgènes, trinitrine...). C'est une voie d'urgence dans le traitement de la crise d'angor (par la trinitrine en sublingual).

12-3-2- Voie rectale

Comme la muqueuse rectale est très vascularisée, elle permet d'obtenir une action générale ou locale selon le type de médicament. Sont administrés par cette voie les suppositoires, les lavements et les pommades rectales. Les suppositoires sont utilisés pour obtenir un effet local (hémorroïdes, rectites, constipation) ou une action générale. Les lavements sont maintenant relativement peu utilisés.

12-3-3- Voie vaginale

Les médicaments employés par cette voie sont destinés à une action locale car la muqueuse vaginale est faiblement perméable. On utilise les ovules, les comprimés vaginaux, les crèmes et gelées vaginales et les capsules vaginales pour des traitements antibactériens, antiseptiques, antiparasitaires et anti- fongiques, ainsi que dans des indications hormonales.

12-3-4- Voie nasale

On l'utilise pour traiter localement les affections de la sphère nasale (poudres, pommades, solutions).

12-3-5- Voie oculaire

La fragilité et la sensibilité de la muqueuse oculaire exigent l'utilisation de médicaments parfaitement contrôlés et stériles (collyres, pommades oph- talmiques, inserts ophtalmiques).

12-3-6- Avantages

→ Le médicament ne subit ni l'action des enzymes digestives, ni celle de l'acide chlorhydrique gastrique. Cependant les bactéries du côlon peuvent détruire certains produits comme la pénicilline, par exemple.

→ Cette voie est commode chez l'enfant et le nourrisson, chez le malade nauséux, inconscient ou incapable d'avaler.

12-3-7- Inconvénients

→ Elle peut provoquer une irritation ou même une ulcération de la muqueuse rectale.

→ Elle peut être jugée désagréable par le patient.

→ Elle peut entraîner, en particulier chez l'enfant, un réflexe de rejet du suppositoire.

→ Elle ne permet pas d'éviter la barrière hépatique car la résorption s'effectue par les veines hémorroïdales supérieures qui aboutissent à la veine porte et donc au foie (effet de premier passage hépatique).

12-4- Voie pulmonaire

L'arbre pulmonaire, qui a une surface de 100 m² chez l'homme adulte et une vascularisation importante, permet une absorption rapide des médicaments. Cette voie est utilisée pour faire absorber les gaz (oxygène, chloroforme, éther, etc.) ; certaines huiles sont données par voie intratrachéale (lipiodol, huile goménolée).

On peut administrer un grand nombre de médicaments (sulfamides, anti-biotiques, antiasthmatiques, etc.) grâce aux aérosols, qui sont des brouillards de fines particules médicamenteuses. Pour être efficace, une séance d'aérosol doit durer au moins 15 minutes. Les aérosols sont administrés sous forme de sprays, par des nébulisateurs ou encore par des inhalateurs dans le cas de poudre sèche.

12-5- Voies cutanée et percutanée

Il s'agit de l'application directe d'un médicament sur la peau par différents moyens. L'action est locale si les composants ne peuvent pas pénétrer à travers la peau. Elle est générale si les composants peuvent traverser la barrière cutanée.

Seule la peau saine est une barrière efficace entre les milieux intérieur et extérieur. Dans le cas contraire (lésions, brûlures, eczéma), tout médicament appliqué sur la peau sera résorbé de façon importante.

La pénétration d'un médicament qui se fait à travers l'épiderme, au niveau de l'appareil pilosébacé, dépend de nombreux facteurs, la pénétration percutanée étant favorisée par les massages et les frictions. Les formes d'administration par voie percutanée sont les pommades, les gels, les lotions, les timbres, les patchs. Des systèmes de délivrance à travers la peau qui permettent une durée d'action régulière et prolongée (Nitriderm, Cordipatch) ont été développés.

L'inconvénient principal de la voie cutanée est une réaction d'hypersensibilité lors de l'utilisation de patchs, due à l'adhésif.

