

Pharmacocinétique

Date : 13/10/04

P.1

M. Darke

1. Définition :

Cinétique : Description de mouvements et de vitesse.

La Pharmacocinétique étudie le **devenir du médicament** dans l'organisme.

On retrouve 4 grandes étapes :

- A bsorption : comment est **diffuser** le médicament
- D istribution : comment est-il **distribuer**
- M étabolisation : Comment est-il **dégrader**
- E limination : Commet est-il **éliminer**

2. Absorption :

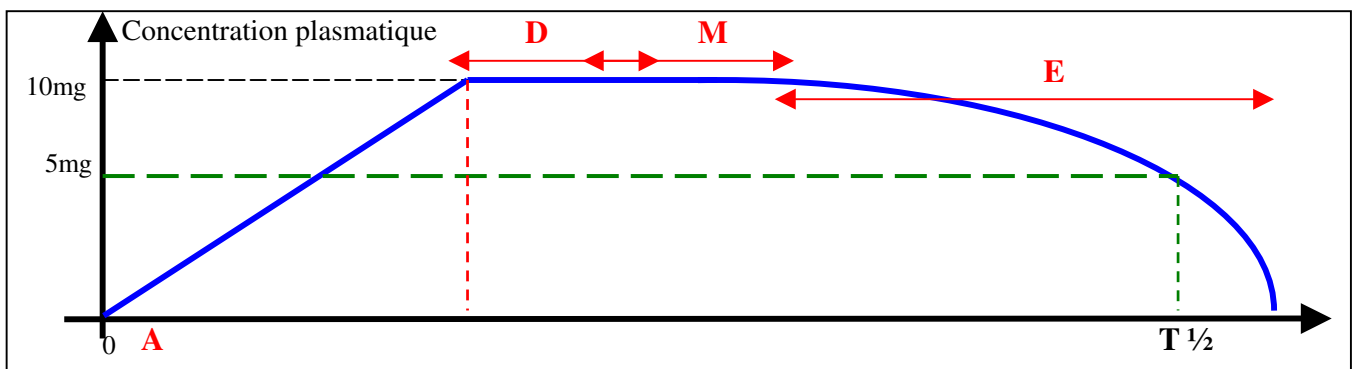
Passage du lieu d'**administration à travers les barrières de l'organisme.**

L'Absorption dépend de la Biodisponibilité qui correspond à la fraction qui passe dans le sang par rapport à la quantité administrer.

$$\text{La biodisponibilité} = \frac{\text{Quantité dans le sang}}{\text{Quantité administrée}}$$

La **biodisponibilité** est **donné pour un produit** et pour une **voie d'administration.**

Elle dépend des **facteurs physiologiques**, de la **vitesse du transit intestinal** et de la **formulation** (vitesse de dissolution du médicament...).



3. La Distribution :

La distribution correspond à la **distribution des principes actifs** du médicament **du sang vers les tissus**.

La distribution dépend :

- de l'irrigation de l'organe
- de l'individu : critère physiologique
- de la structure des produits
- du sang

Le médicament reste accroché à l'albumine du sang et ne veut pas aller jusqu'aux tissus. On appelle cela liaison protéique plasmatique (L.P.P)

On retrouve deux sortes :

- Forme libre ⇨ active
- Forme liée ⇨ pas d'action

Lorsque l'on a beaucoup de liaison protéique plasmatique :

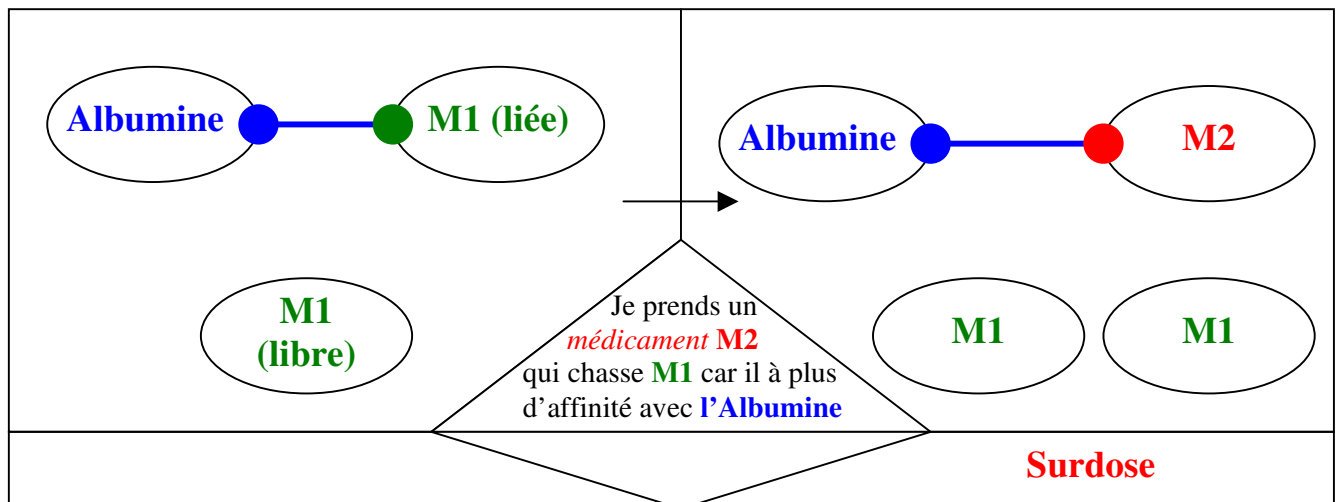
- baisse de la Métabolisation
- baisse de l'effet

Libération progressive :

Au fur et à mesure de médicament se **libère progressivement de l'albumine** ⇨ libération progressive du médicament dans le temps

Libération Massive :

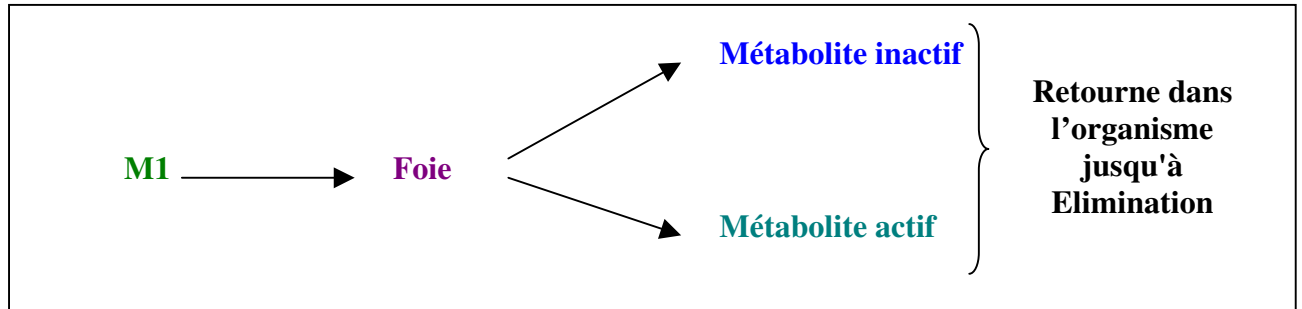
Il existe des médicaments qui possèdent une **meilleure affinité avec l'albumine** et il prendra alors la place du premier médicament on aura donc 2M1 au lieu d'un ⇨ **surdose**



4. La Métabolisation :

La **Métabolisation** du médicament **correspond à la modification du médicament** et a sa **destruction par le foie**.

Le foie est le principal organe de la Métabolisation car le foie est très richement vascularisé et il contient beaucoup d'enzymes.



La **Métabolisation** est très **variable selon les individus**, d'autant plus si la personne a une maladie tel qu'une hépatite.

Il existe des médicaments (**Inducteurs enzymatiques**) qui favorisent l'action des enzymes. Les autres médicaments présents dans l'organisme seront encore **plus métabolisés** ➔ ils seront **moins actifs**.

D'autres médicaments (**Inhibiteurs Enzymatiques**) vont **réduire l'action des enzymes** et ainsi les médicaments présents dans l'organisme auront **une plus forte action**.

5. L'Élimination :

L'**élimination** des médicaments se fait **le plus souvent par les urines**, on retrouve également par les selles et par voie pulmonaire.

Le **médicament est filtré** (filtration glomérulaire), puis vient la **sécrétion** et la **réabsorption** (il peut être réabsorbé du rein pour le remettre dans l'organisme.)

Le paramètre qui définit l'absorption est la **clairance** qui correspond au **volume de plasma débarrassé de la substance** (le médicament) **par unité de temps** (100ml/min...)

➔ chaque minute j'élimine 100ml de produit par litre de sang.

- La demi vie : $T_{1/2}$ correspond au temps pour lequel **il ne reste que la moitié de médicament dans le sang**.