



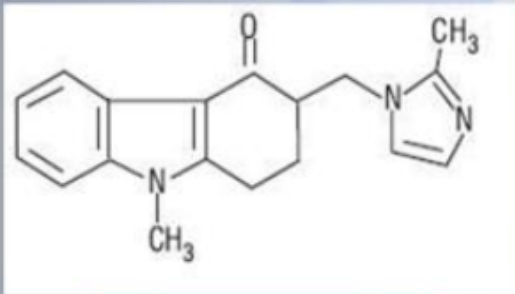
Faculté de Médecine de Annaba
Cours de Pharmacologie
3eme Année Pharmacie

Antiémétiques et émétisants 3

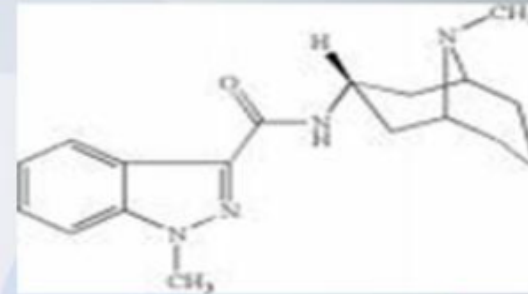
Dr. DOUAOUI ABDELKADER
Maitre assistant HU en pharmacologie
douaouipharmaco@gmail.com

Les Antiémétiques

2- Les antagonistes sérotoninergiques 5HT₃

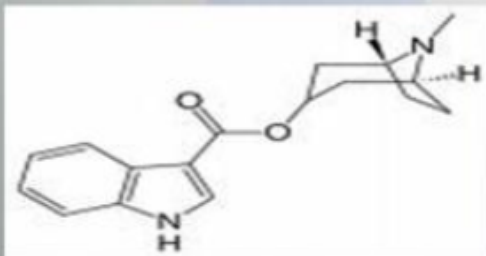


Ondansétron

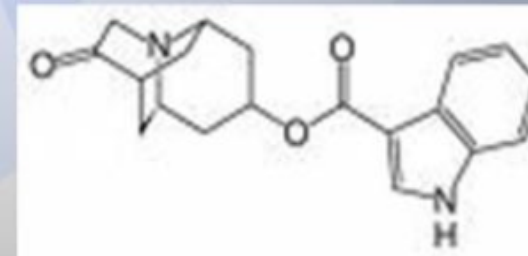


Granisétron

Les sétrons



Tropisétron



Dolasétron

Sétrons

Mécanisme d'action	Antagonistes des récepteurs 5HT ₃ - au niveau de l'area postrema et/ou du noyau solitaire - terminaisons afférentes du vague.
Indications	Traitement préventif ou curatif des vomissements chimio-induits / antinéoplasiques Inconvénients : Coût, Vomissements retardés, par anticipation (+ corticoïde)
Pharmacocinétique	ondansétron se fixe sur l'hématie, $\frac{1}{2}$ vie 3h - Autres 7-9 h
Effets indésirables	bien tolérés (céphalées, asthénie, somnolence, constipation et bouffées de chaleur, hypertension ou hypotension).
Contre- indications	Femme enceinte ou allaitante (déconseillé) Hypersensibilité

Les Antiémétiques

3- Les antagonistes muscariniques

Scopolamine

Sous forme de patch

4- Les antihistaminiques H₁

Cyclizine,
Méclozine

Hydroxyzine,
Prométhazine
Diphénhydramine

+ anti D2



El: atropiniques

5- Les antagonistes NK₁

Aprépitant

Sous forme de fosaprépitant

Mécanisme d'action	Antagonistes sélectifs des récepteurs NK ₁
Indications	Traitement préventif N et V chimio-induit en complément d'un traitement antiémétique / association d'un corticoïde (dexaméthasone) et d'un sétron (ondansétron).
Pharmacocinétique	Inhibiteur CYP3A4 (partiellement) inducteur du CYP2C9
Effets indésirables	Céphalées, asthénie, vertiges, troubles digestifs. Anémie, bradycardie, euphorie (peu fréquents).

Interactions

5- Autres

Les corticoïdes

Dexaméthasone - Méthylprédnisolone

- Mécanisme mal élucidé
- TRT adjuvant des vomissements chimio-induits :
 - ↗ efficacité
 - ↘ leurs effets indésirables

Les sédatifs et hypnotiques

Lorazépam - Alprazolam

- Action antiémétique faible
- Action sédatif, anxiolytique et amnésiant
 - ↗ efficacité des corticoïdes et du métoclopramide

5- Autres

Les cannabinoïdes

Δ 9- tétrahydrocannabinol **Dronabinol®**

- Mécanisme mal élucidé :
 - Action sur récepteurs CB₁ et CB₂
 - Interférence avec les neuromédiateurs (sérotonine, Ach)
- TRT des vomissements intense chimio-induits ou en cas d'intolérance aux autres TRT

Les effets indésirables :

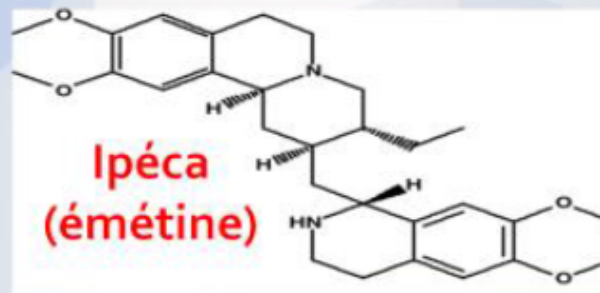
- Euphorie, sédation, hallucinations, paranoïa ...
- Syndrome de sevrage à l'arrêt du TRT

Les émétisants

Centraux

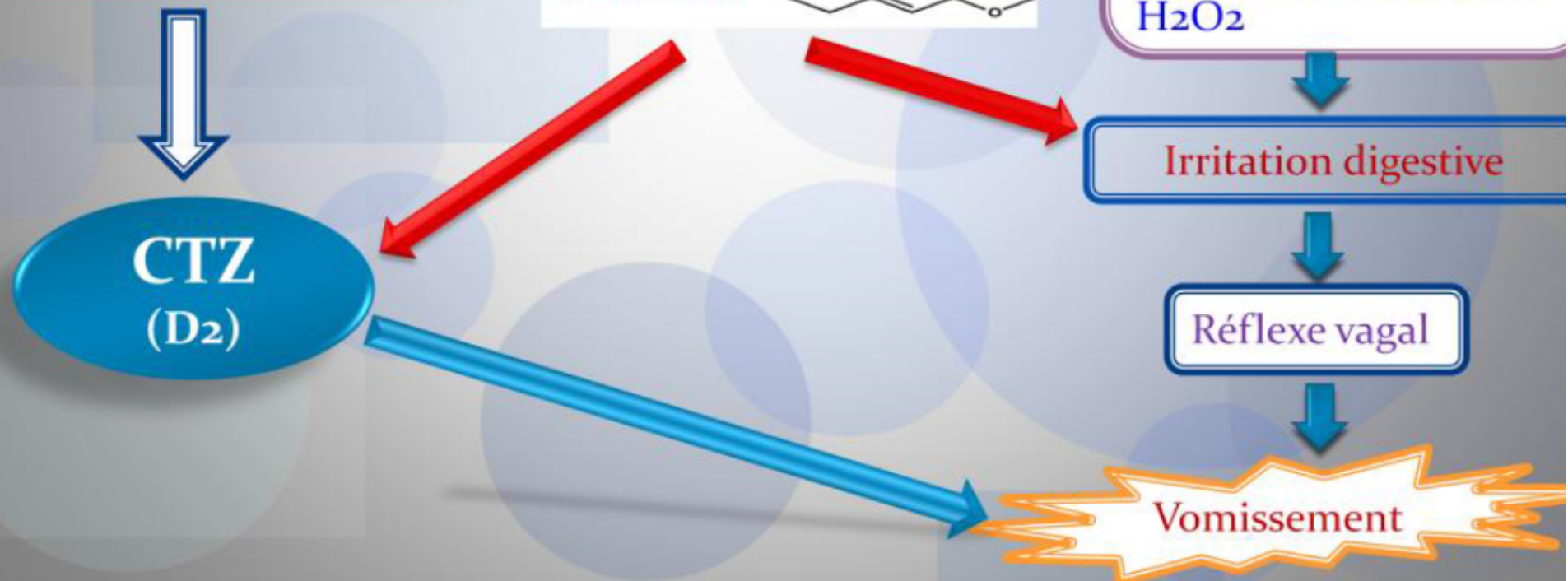
- Sulfate de morphine
- **Apomorphine**

Mixtes



Périphériques

Sulfate de cuivre
Solution de NaCl
concentrée
Solutions détergentes,
H₂O₂



Stratégie thérapeutique

Cause	Classe utilisée
Mal de transport	Anti H ₁ , antimuscariniques
Cérébrale	Corticoïdes
Chimio/radiothérapie	anti5HT ₃ + corticoïdes
N+V retardées	Sétron + aprépitant+ corticoïde
N+V anticipés	Anxiolytiques
N+V post opératoires	Sétrons/antiD ₂
N+V de la grossesse	Anti D ₂ : métoclopramide
Agonistes Dopaminergiques	Anti D ₂ ne traverse pas la BHE
Morphine, opiacés	Sétrons/ anti D ₂
Agonistes sérotoninergiques	Anti 5HT ₃