

Fiche Pharmacologie

Les Antalgiques

I. Objectifs et classification des antalgiques

Les objectifs des antalgiques :

- Diminuer/supprimer les sensations douloureuses
- Sans altération de la conscience
- Sans modification des autres sensibilités

Classification de la douleur :

- Douleur par excès de nociception : Douleur en réponse à une agression par une stimulation des voies nerveuses. Stimulation de récepteurs de la douleur transmise au système nerveux central. La stimulation peut être mécanique, chimique ou thermique.
- Douleur neurogène : Pas d'agressions nociceptives. Résultat d'une lésion des voies de transmissions nerveuses.

Catégories des antalgiques :

- Palier I : Antalgiques périphériques non opioïdes = Douleur légère
- Palier II : Opioïdes centraux « faibles » = Douleur modérée
- Palier III : Opioïdes centraux « forts » = Douleur sévère

Antalgiques de palier I :

- Paracétamol
- Aspirine
- AINS
- Nefopam

II. Antalgiques de palier II

Les opioïdes « faibles » :

- Codéine
- Tramadol
- Buprénorphine
- Nalbuphine

Récepteurs opioïdes :

- Distribution centrale : moelle épinière, tronc, hypothalamus → Analgésie
- Distribution périphérique → Effets latéraux
- Ligands : endorphine, enképhalines
- Agonistes de demi-vie très courte

LA CODEINE :

- Latex de *Papaver somniferum*
- Opiode faible
- Effet antalgique moins important que la morphine
- **Meilleure tolérance**

➔ Effets indésirables : Nausées, vomissements, constipation, somnolence, dépression respiratoire, risque de dépendance et syndrome de sevrage.

➔ Association :

- Codéine + paracétamol = Codoliprane
- Codéine + ibuprofène = Antarene codéine

LE TRAMADOL :

- Double action
- Inhibition de la recapture de la noradrénaline et de la sérotonine
- Mauvaise tolérance
- Topalgic, contramal ...
- Association avec du paracétamol : Ixprim, Zaldiar
- Effets secondaires : Nausées, vomissements, constipation, vertiges, somnolence, baisse de la concentration, hypotension, dépression respiratoire, dépendance, syndrome de sevrage à l'arrêt du traitement.

Autres antalgiques de palier II :

- Nubain (Nalbuphine)
- Temgesic (Buprénorphine) : utilisé pour le sevrage aux opiacés (Subutex)

III. Antalgiques de palier III

- Opium : pavot somnifère
- Morphine identifiée en 1817
- Synthèse de nombreux dérivés : Héroïne, Fentanyl
- Douleur par excès de nociception
- Intensité et délai d'apparition de l'effet antalgique dépendant de :
 - ➔ Forme galénique
 - ➔ Lipophilie

Pharmacodynamie :

- Effet antalgique puissant
- Effet dépresseur central
- Effet dépresseur respiratoire dose-dépendant
- Nausées et vomissements
- Constipation
- Prurit

Pharmacocinétique :

- Métabolisme hépatique ➔ vigilance si insuffisance hépatique
- Élimination rénale ➔ vigilance si insuffisance rénale
- Pas de dose maximale
- Risque de tolérance
- Risque de sevrage et de dépendance au moment de l'arrêt du traitement

MORPHINE :

- Skenan, Actiskenan, Moscontin : Per os
- Chlorhydrate, sulfate : IV, SC

FENTANYL et dérivés :

- Abstral : comprimé Lyoc → orodispersible
- Actiq : sucettes
- Durogésic : Patch
- Pecfent : pulvérisations nasales
- Formes injectables

OXYCODONE :

- Oxycontin, oxynorm : Per os et injectable

HYDROMORPHONE :

- Sophidone : Per os

PETHIDINE :

- IV uniquement

METHADONE :

- Durée d'action longue, peu d'effets euphorisants
- Utilisée pour le sevrage aux opiacés

EFFETS CENTRAUX	EFFETS PERIPHERIQUES
Comportement : euphorie, dysphorie	Tractus gastro-intestinal : constipation
Effet déprimeur respiratoire	Voies urinaires : rétention urinaire
Nausées, vomissements	Utérus : augmentation de la durée du travail
Inhibition de la toux	Prurit, bronchospasme, hypotension artérielle
Myosis	

IV.Utilisation des antalgiques

- Toujours rechercher la posologie minimale efficace
- Traitement de fond avec les formes LP (libération prolongée)
- Association avec des antalgiques de palier I
- Morphine et dérivés = stupéfiants
- Prescription sur ordonnance sécurisée
- Posologie en toutes lettres
- Durée limitée : 7, 14 ou 28 jours