

MÉDICAMENTS DU SYSTÈME ADRÉNERGIQUE : SYMPATHOMIMETIQUES

Licence 3 Pharmacie

2019-2020

D. FALL

A-DERIVES DE LA PHENYLETHYLAMINE

I-CATECHOLAMINES

I-1 Dérivés naturels

I-2 Dérivés de synthèse

II- DERIVES METADIPHENOLIQUES

III-COMPOSES MONOPHENOLIQUES

ET ANALOGUES

III-1 Dérivés métaphénoliques

III-2 Dérivés paraphénoliques

III-3 Dérivés de la pyridine

IV-AMINOALCOOLS NON PHENOLIQUES

V- RELATIONS STRUCTURE-ACTIVITE

B-DERIVES IMIDAZOLINIQUES

C- AUTRES DERIVES

INTRODUCTION

- STIMULATION SYSTEME SYMPATHIQUE
- RECEPTEURS ALPHA & BETA
- EFFETS SUR ORGANES

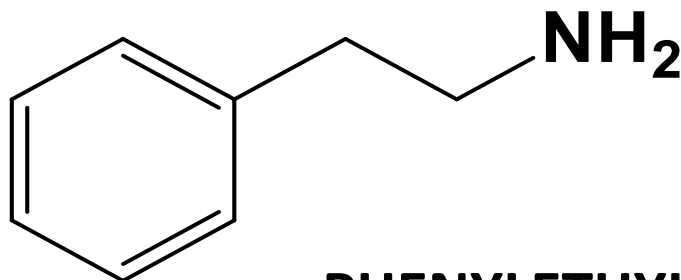
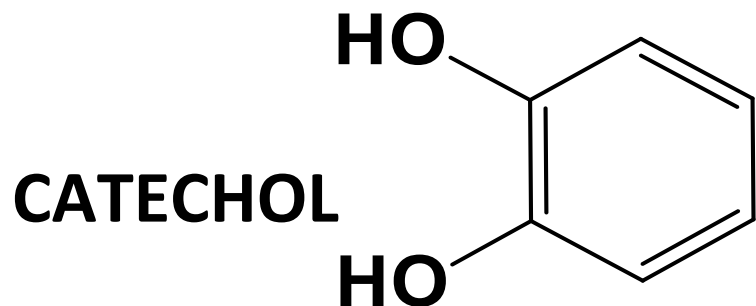
A-DERIVES DE LA PHENYLETHYLAMINE

- **I-CATECHOLAMINES**

- MEDIATEURS

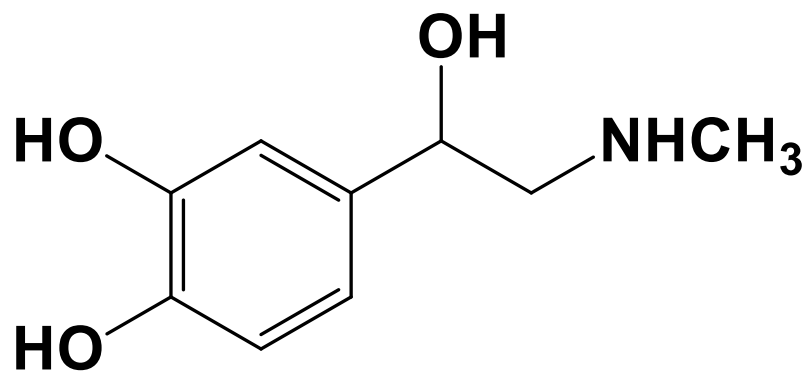
- DERIVES NATURELS ET DE SYNTHESE

- PRESENCE DE OH SUR CHAINE LATERALE OU NON

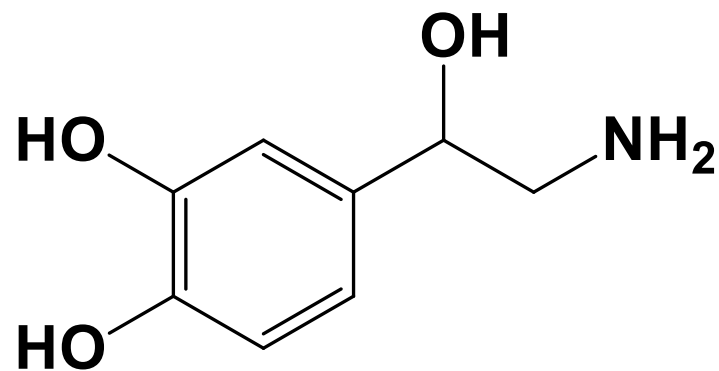


PHENYLETHYLAMINE

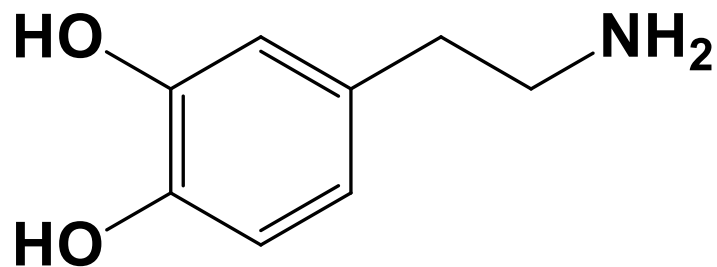
I-1- DERIVES NATURELS



ADRENALINE

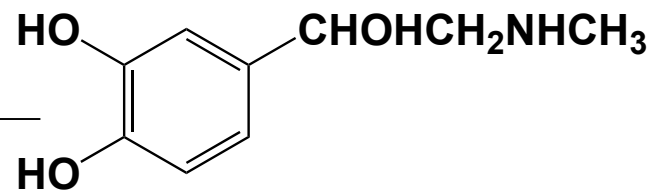
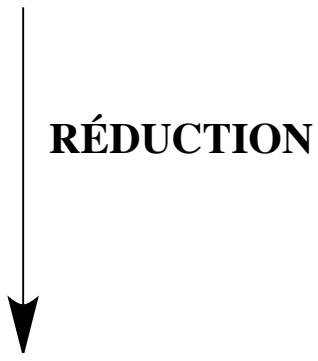
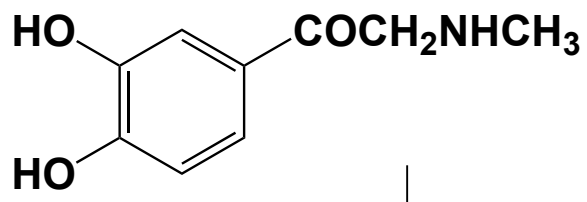
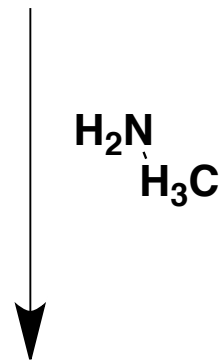
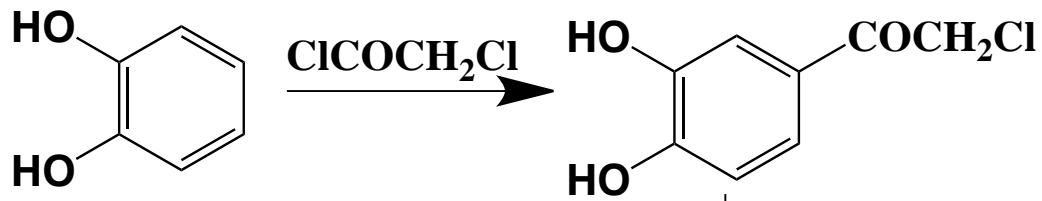


NORADRENALINE



DOPAMINE

SYNTHÈSE ADRENALINE



← ADRÉNALINE
LÉVOGYRE

RACÉMIQUE

UTILISATIONS THERAPEUTIQUES

- A l'extérieur : hémostatique local
 - solution à 1/1000
- Vasoconstricteur en gouttes nasales
- Mydriatique sous forme de collyre
- Douleurs locales : crème ou de pommades à 1/5000.


UTILISATIONS THERAPEUTIQUES

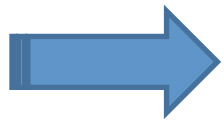
- **ADRENALINE**
- Spécialités
 - ADRENALINE*
 - ANAPEN* Sous forme de seringue pré remplie utilisée pour le traitement d'urgence des symptômes de choc anaphylactique
 - ANAKIT
 - ANAHELP*

UTILISATIONS THERAPEUTIQUES

- **Odontostomatologie**
 - ARTICADEN, ALPHACAÏNE
- **Anesthésie locale :**
- XYLOCAINE ADRENALINE*

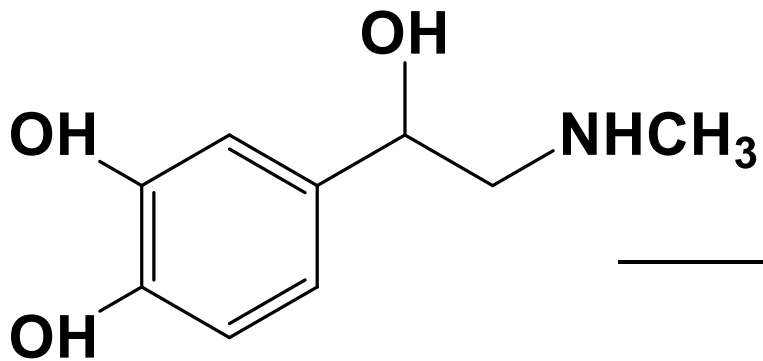
Propriétés physico-chimiques adrénaline

- Poudre microcristalline blanche qui brunit à l'air libre par oxydation
- chlorure ferrique  coloration verte
- caractère réducteur vis-à-vis liqueur de Fehling et du nitrate d'argent ammoniacal



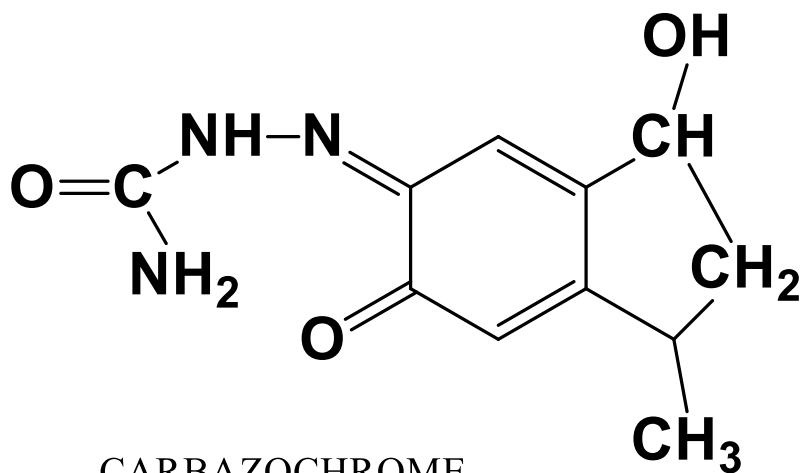
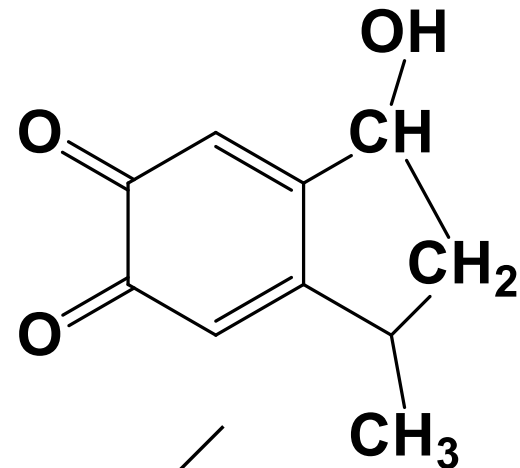
OXYDANT

ADRENOCHROME

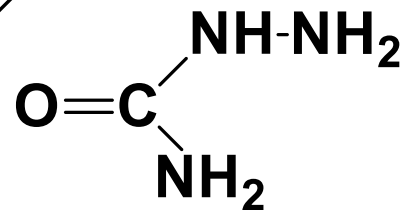


Adrenaline

[O]



**CARBAZOCHROME
ADRENOXYL**



NORADRENALINE α et β 1

DENTAIRE+ ANESTHESIQUE LOCAL

BIOCAÏNE NORADRENALINEE, ZIACAÏNE

NORADRENALINEE, XYLONOR

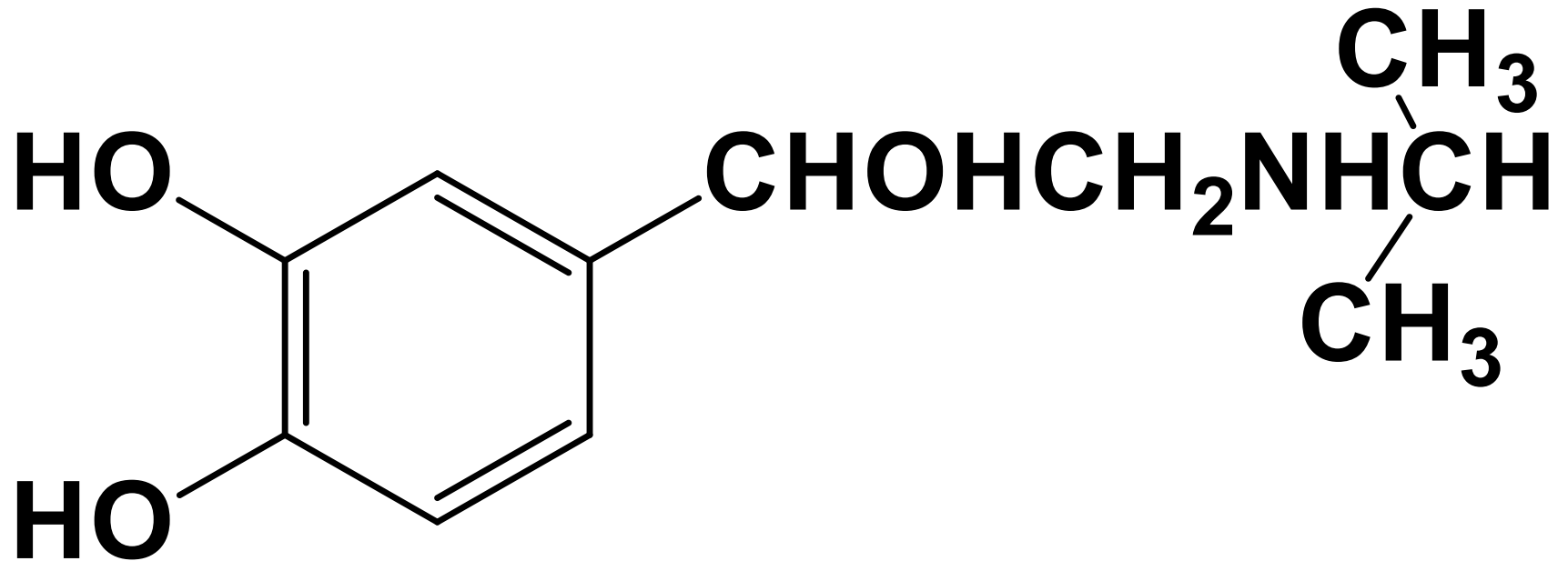
NORADRENALINE

URGENCE : collapsus 8mg/4ml

- **DOPAMINE** α , β et récepteurs dopaminergiques
- Syndrome de bas débit cardiaque, état de choc

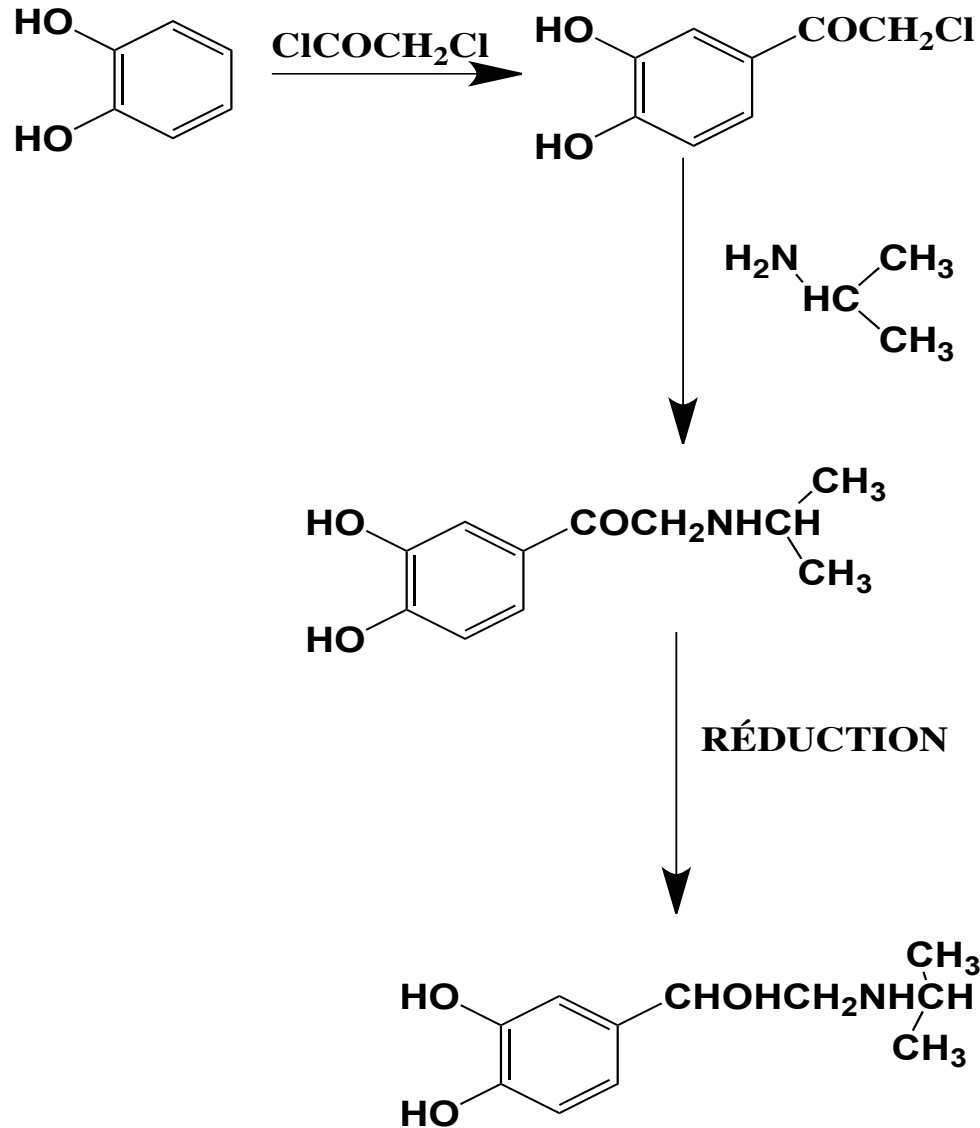
I-2 Dérivés de synthèse

II-2-1- Dérivés comportant la fonction alcool secondaire



ISOPRENALINE

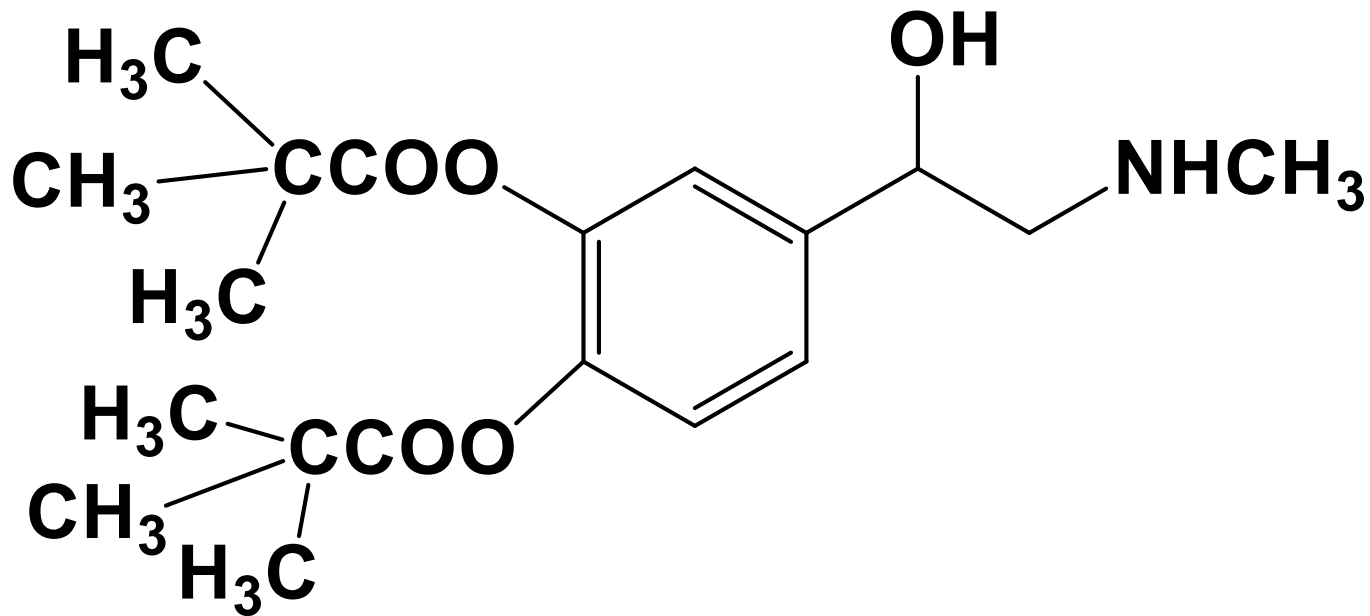
SYNTHÈSE ISOPRENALINE



PROPRIÉTÉS ET UTILISATIONS

- **ISOPRENALINE** β_1 , β_2 Stimulant
 - ISUPREL*, ISOPRÉNALINE*
 - Syndrome de Stockes-Adams
 - Bradycardies extrêmes
 - Bas débit cardiaque
- Ampoule 0,2mg/ml

DIPIVEPHRINE (ou DIPIVEFRINE)

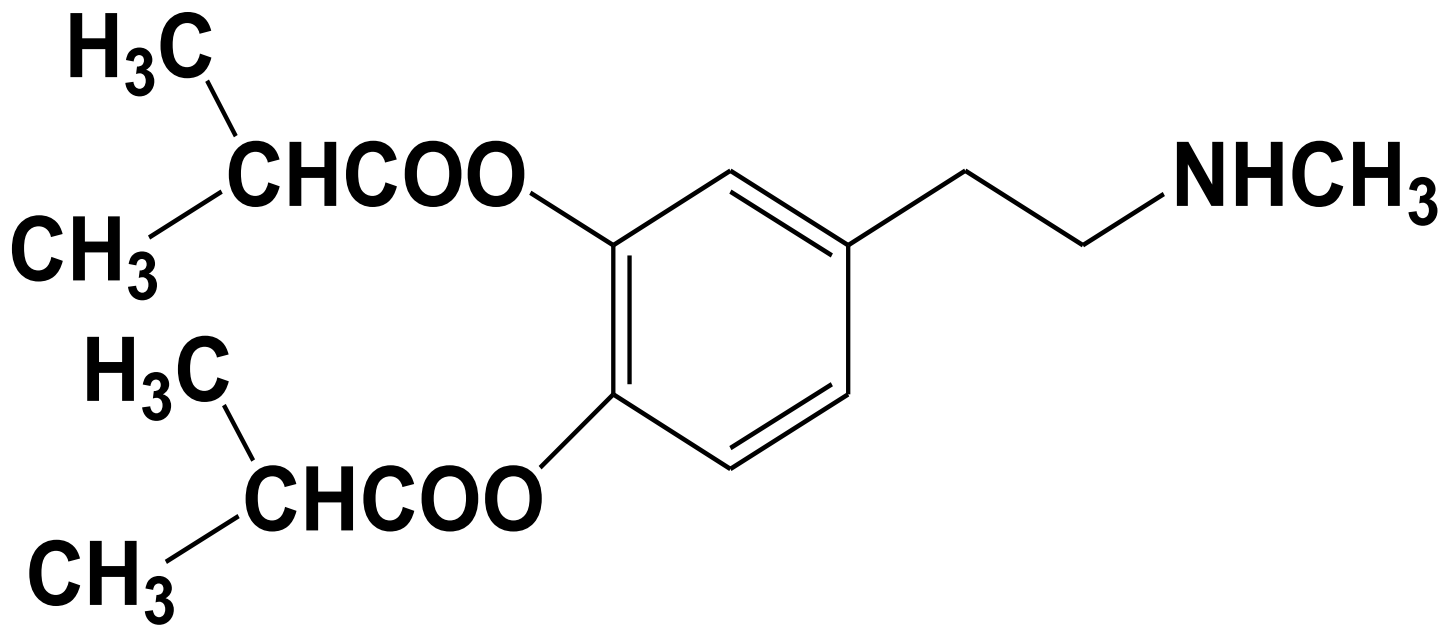


DIPIVEPHRINE

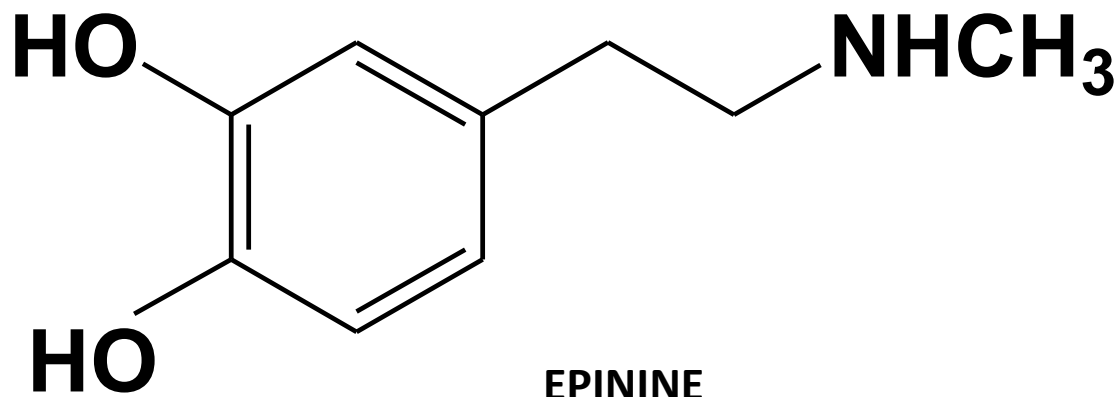
PROPINE, collyre 0,1% ; 5ml

II-2-2- Dérivés ne comportant pas la fonction alcool secondaire

- IBOPAMINE
- DOBUTAMINE
- DOPEXAMINE

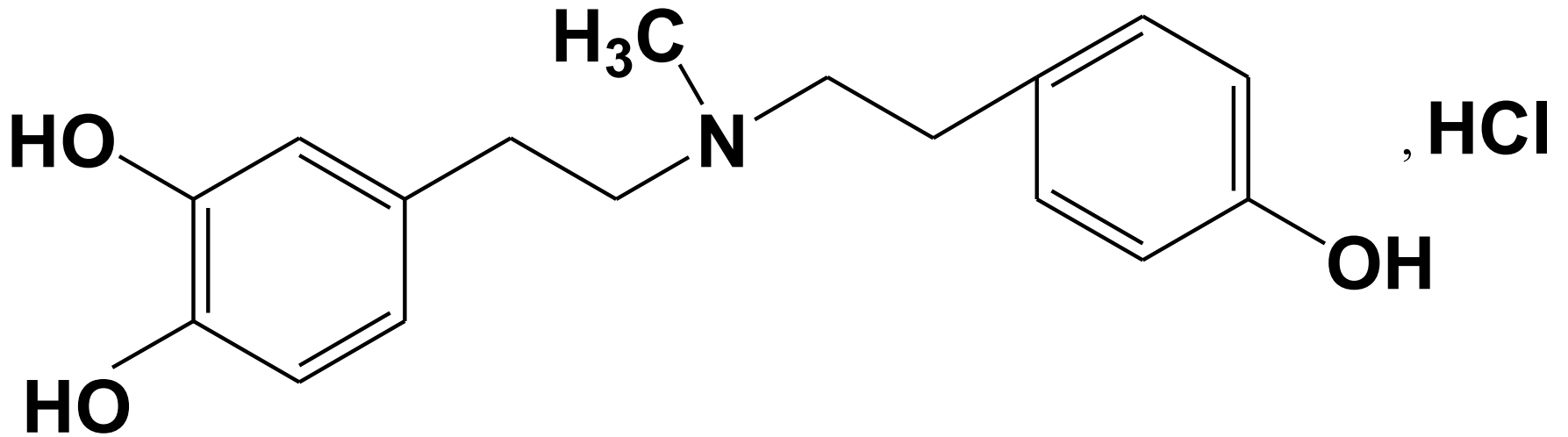


IBOPAMINE [N-méthyl 3,4-O-diisobutyryl Dopamine]



EPININE

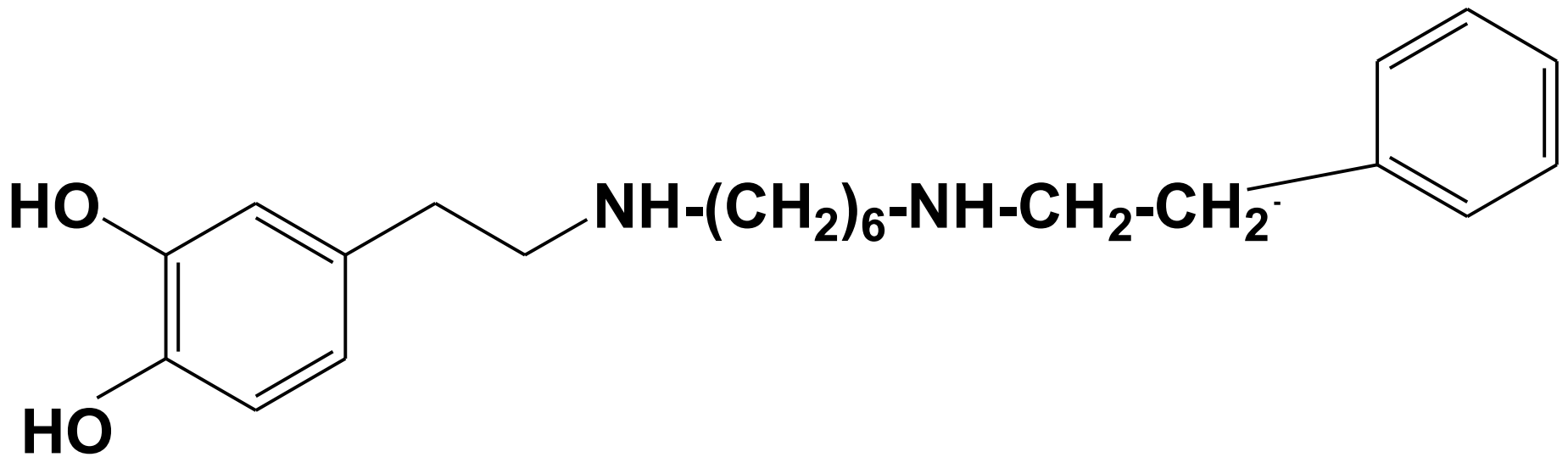
DOBUTAMINE



DOBUTAMINE

DOBUTAMINE*, DOBUTREX*

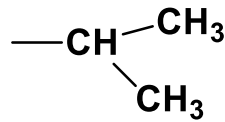
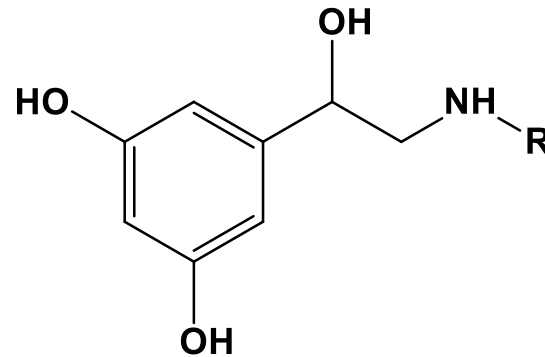
DOPEXAMINE



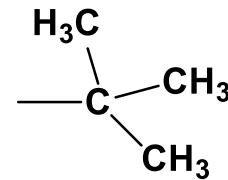
DOPACARD* 50mg/50ml

II-DERIVES METADIPHENOLIQUES (1)

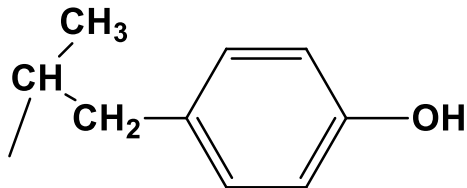
- II-1- STRUCTURES



ORCIPRENALINE



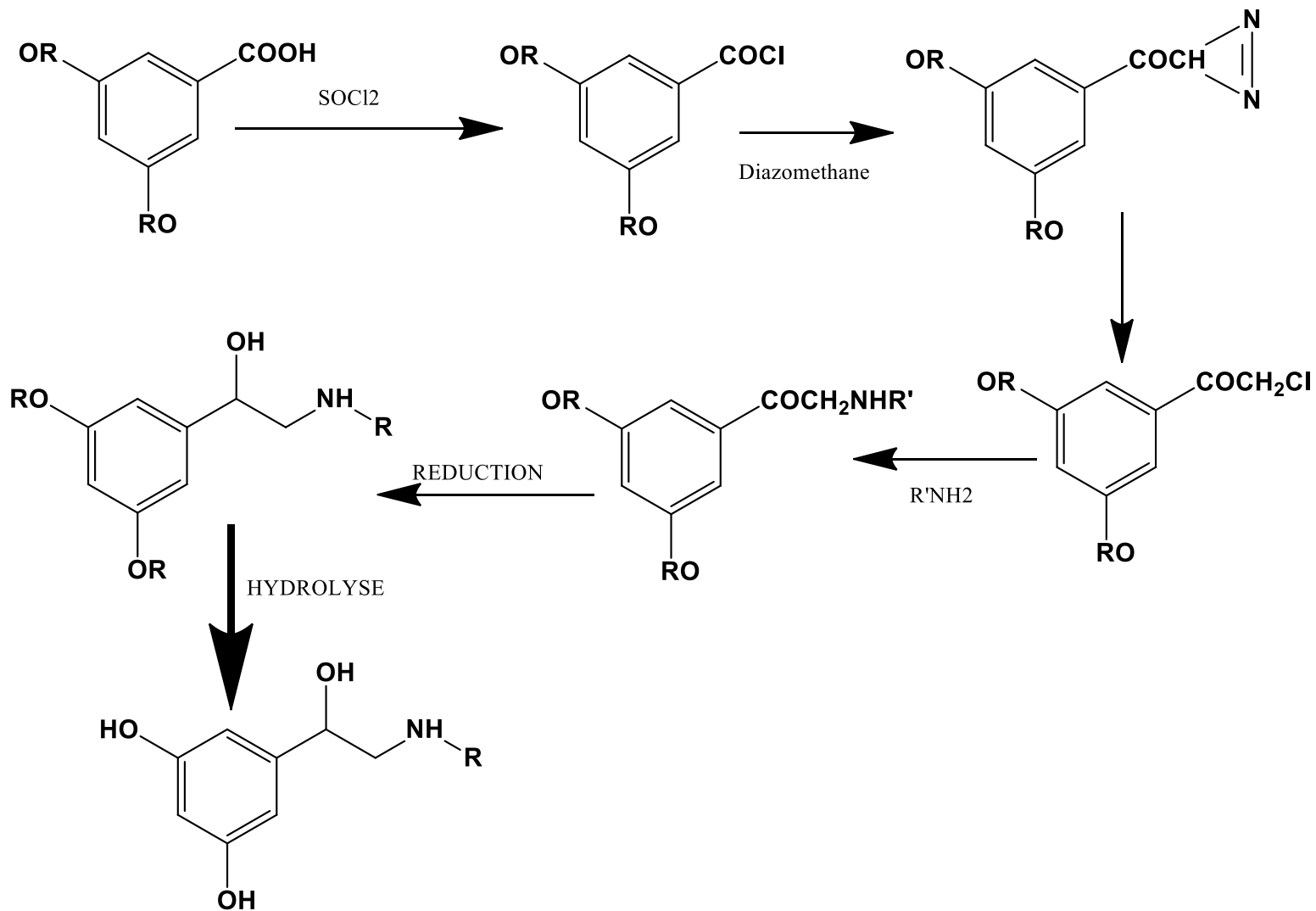
TERBUTALINE



FENOTEROL

II-DERIVES METADIPHENOLIQUES (2)

• II-2- PREPARATION

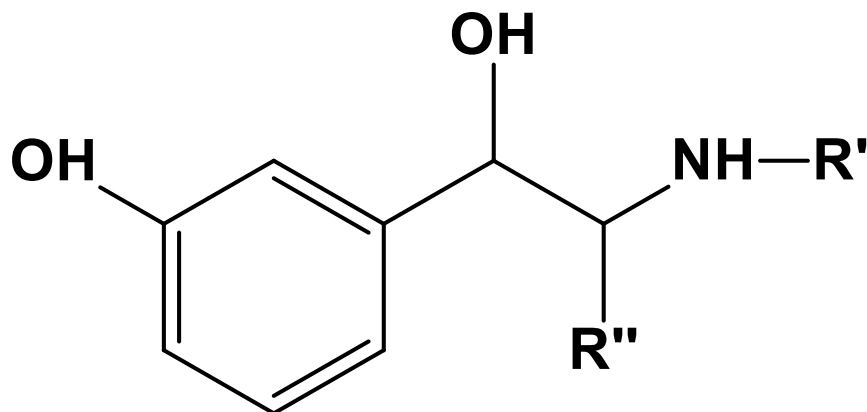


II-DERIVES METADIPHENOLIQUES (3)

- **II-3- PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET UTILISATIONS THERAPEUTIQUES**
 - Propriétés bronchodilatatrices
 - ➔ Asthme, bronchopathies
 - ORCIPRENALINE : ALUPENT*
 - TERBUTALINE : BRICANYL*
 - FENOTEROL : BEROTEC*

III- COMPOSES MONOPHENOLIQUES ET ANALOGUES

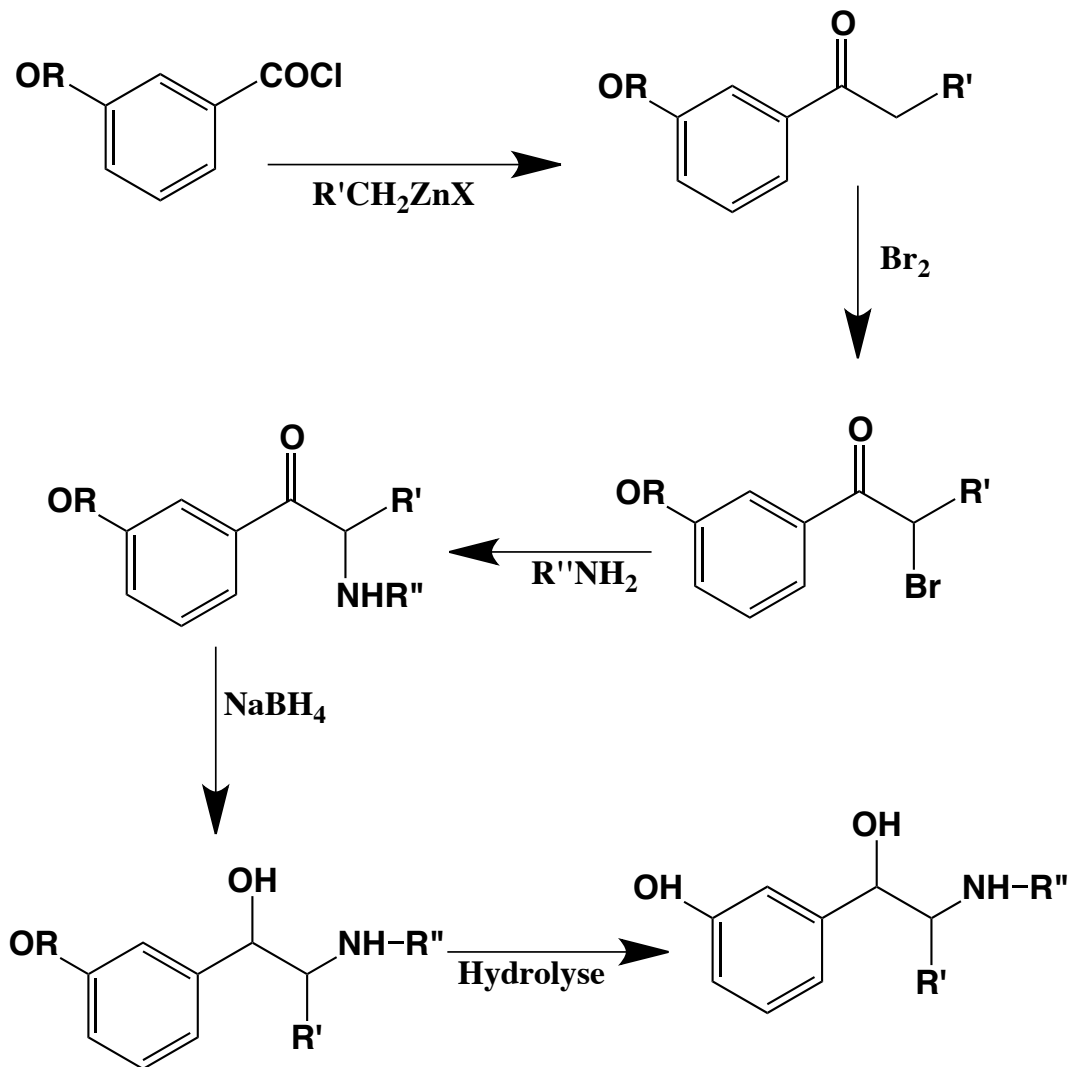
- III-1- COMPOSES METAPHENOLIQUES
 - III-1-1- STRUCTURES



R'	R''	DCI	ND
H	CH ₃	Phenylephrine	NEOSYNEPHRINE*
H	C ₂ H ₅	Ethylefrine	EFFORTIL*
CH ₃	CH ₃	Metaraminol	ARAMINE*

III-1- COMPOSES METAPHENOLIQUES

III-1-2- PREPARATION



III-1- COMPOSES METAPHENOLIQUES

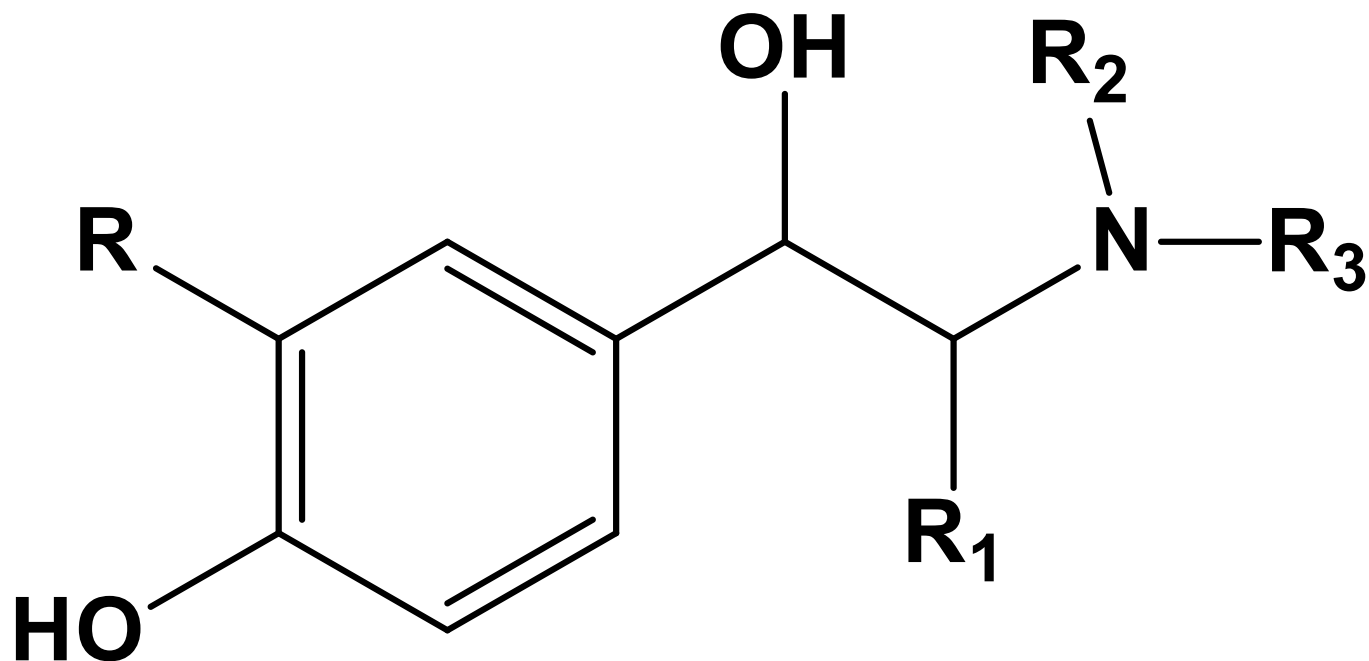
III-1-3- PROPRIETES ET UTILISATIONS THERAPEUTIQUES

- Phénylèphrine, stimulant α_1 adrénergiques
 - collyre, gouttes nasales ou auriculaires.
 - NEOSYNEPHRINE* collyre à 10%.
 - in BOROCLARINE*, MARTIGENE* collyre
 - in AURISTAN* solution auriculaire

- Ethylefrine
- Metaraminol

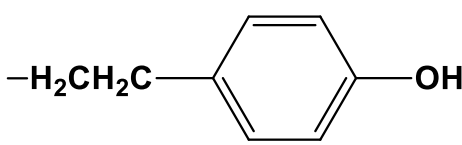
III-2- COMPOSES PARAPHENOLIQUES

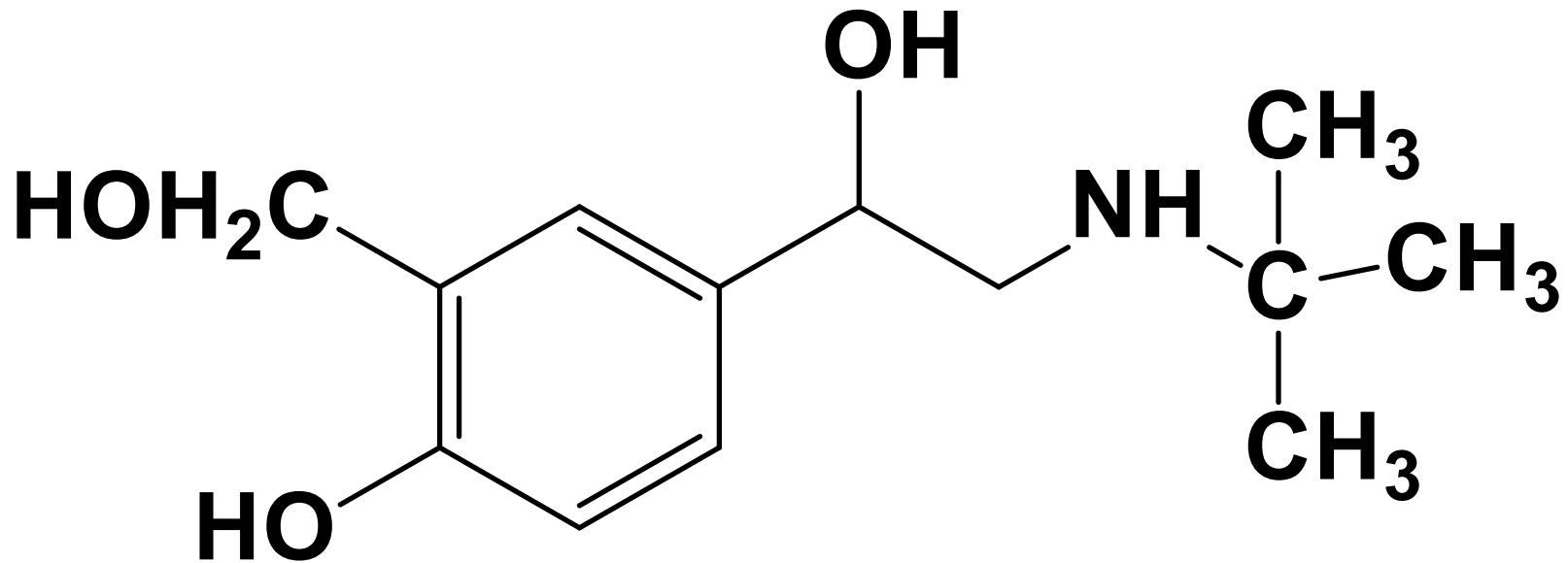
III-2-1-STRUCTURE GENERALE



III-2- COMPOSES PARAPHENOLIQUES

III-2-2-PRINCIPAUX DERIVES

R	R1	R2	R3	DCI
H	H	H	CH ₃	OXEDRINE (SYNEPHRINE)
H	H	H	C ₄ H ₉	BAMETHAN
H	CH ₃	H		RITODRINE



SALBUTAMOL

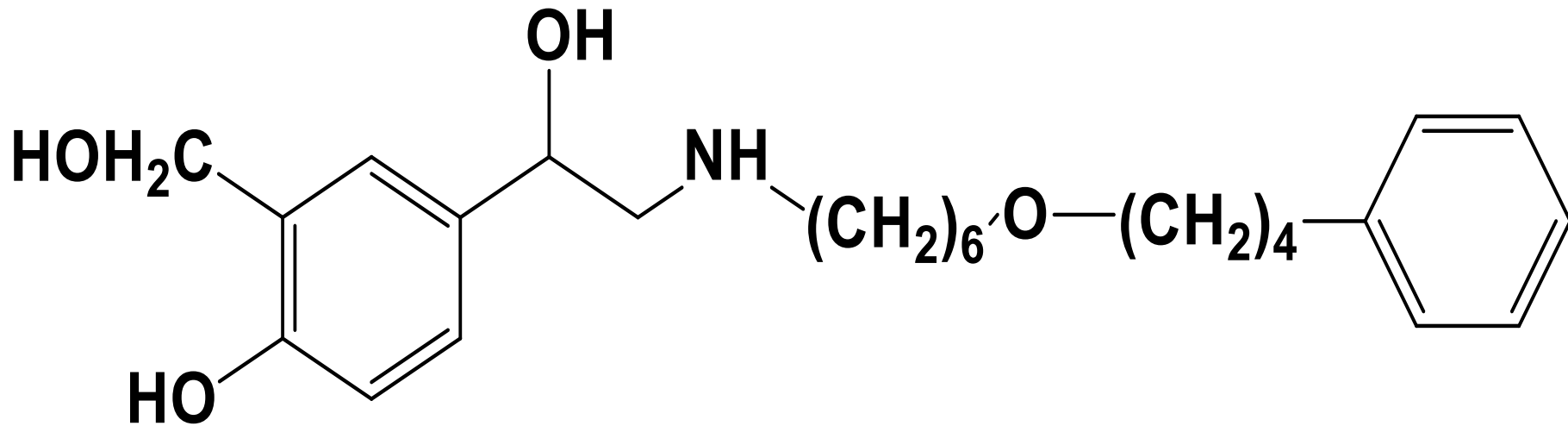
Bronchodilatateur puissant \longrightarrow **anti asthmatique**

VENTOLINE, SPREOR, EOLENE

In COMBIVENT (avec ipratropium bromure)

ASMASAL (clickhaler), BUVENTOL (Easyhaler), AIROMIR (Autohaler)

Gynécologie/Obstétrique



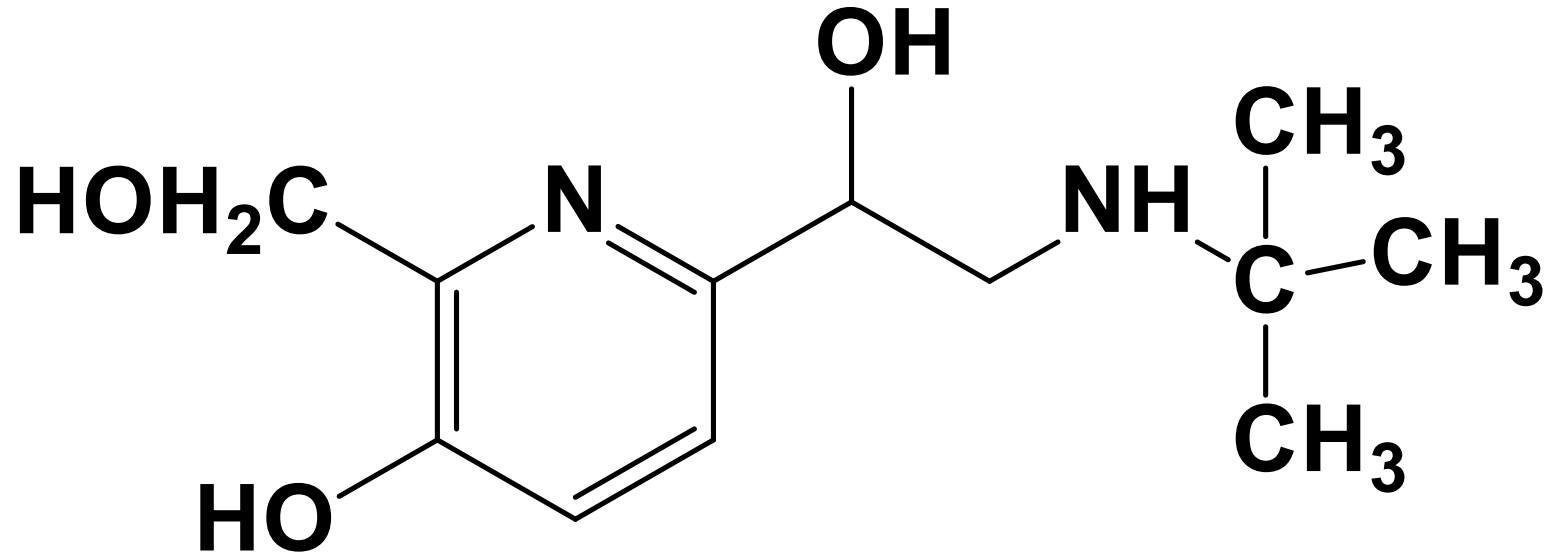
SALMETEROL

Fonction amine à substituant lourd
grande sélectivité sur récepteurs β_2 des muscles lisses
Traitement symptomatiques de l'asthme et autres
bronchopneumopathies obstructives reversibles

SERETIDE, SEREVENT

Formétérol: FORADIL*

III-3-DERIVE DE LA PYRIDINE



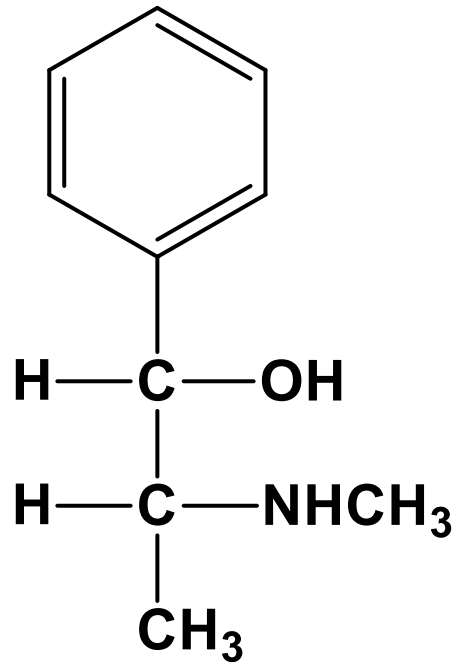
PIRBUTEROL

Pirbuterol = MAXAIR*

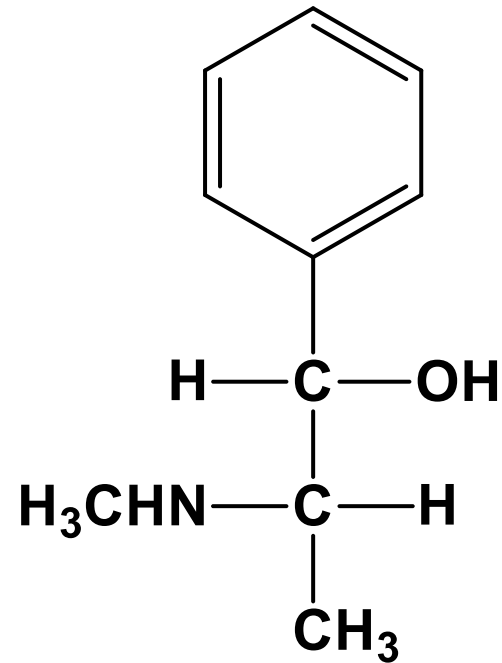
Crise d'asthme, bronchite chronique obstructive,
Prévention de l'asthme d'effort.

IV- Amino-alcools non phénoliques

IV-1-STRUCTURES



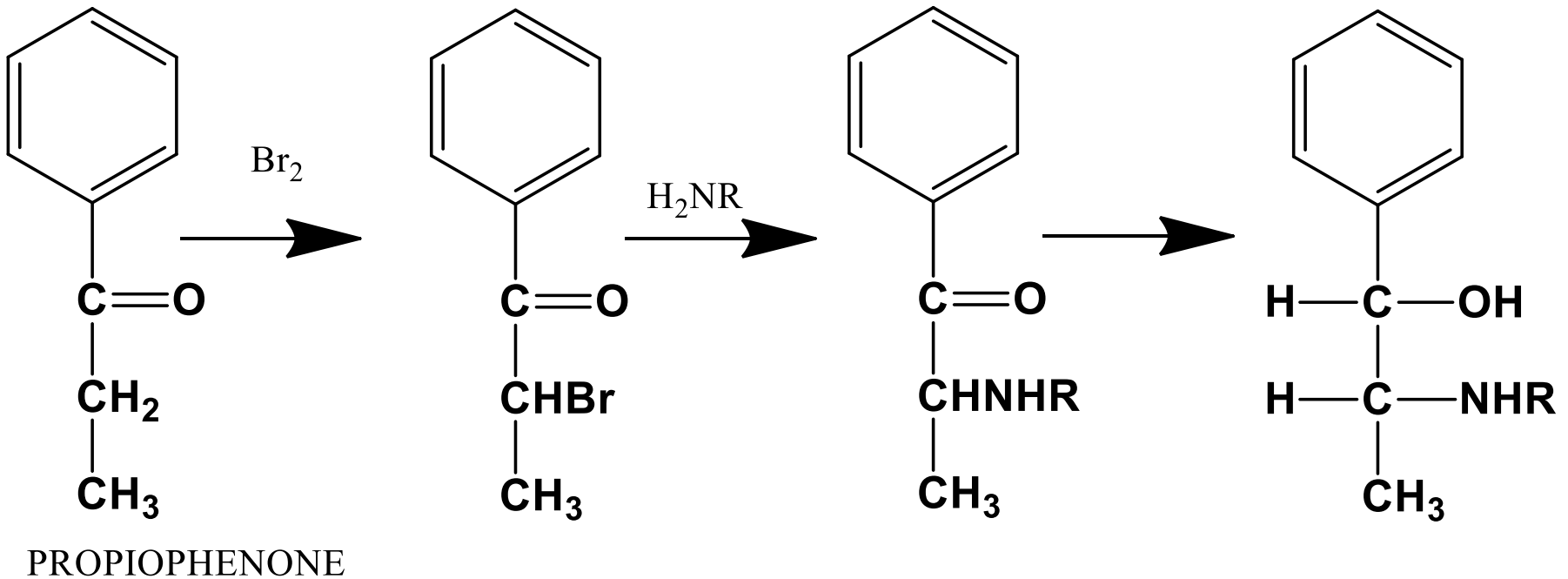
EPHEDRINE



PSEUDOEPHEDRINE

IV-2-MODES D'OBTENTION

- Extraction à partir d'espèces d'Ephédra (Conifères)
- SYNTHÈSE

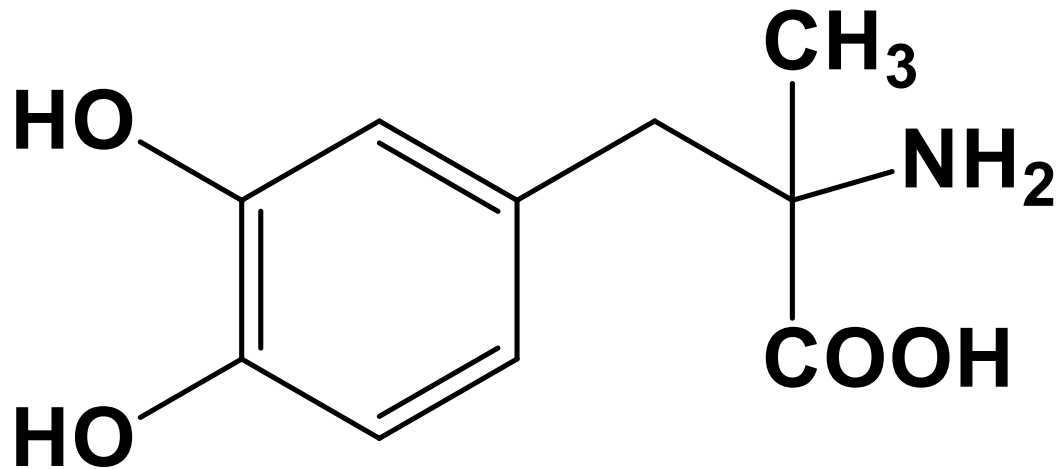


IV-3-PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET UTILISATIONS THERAPEUTIQUES

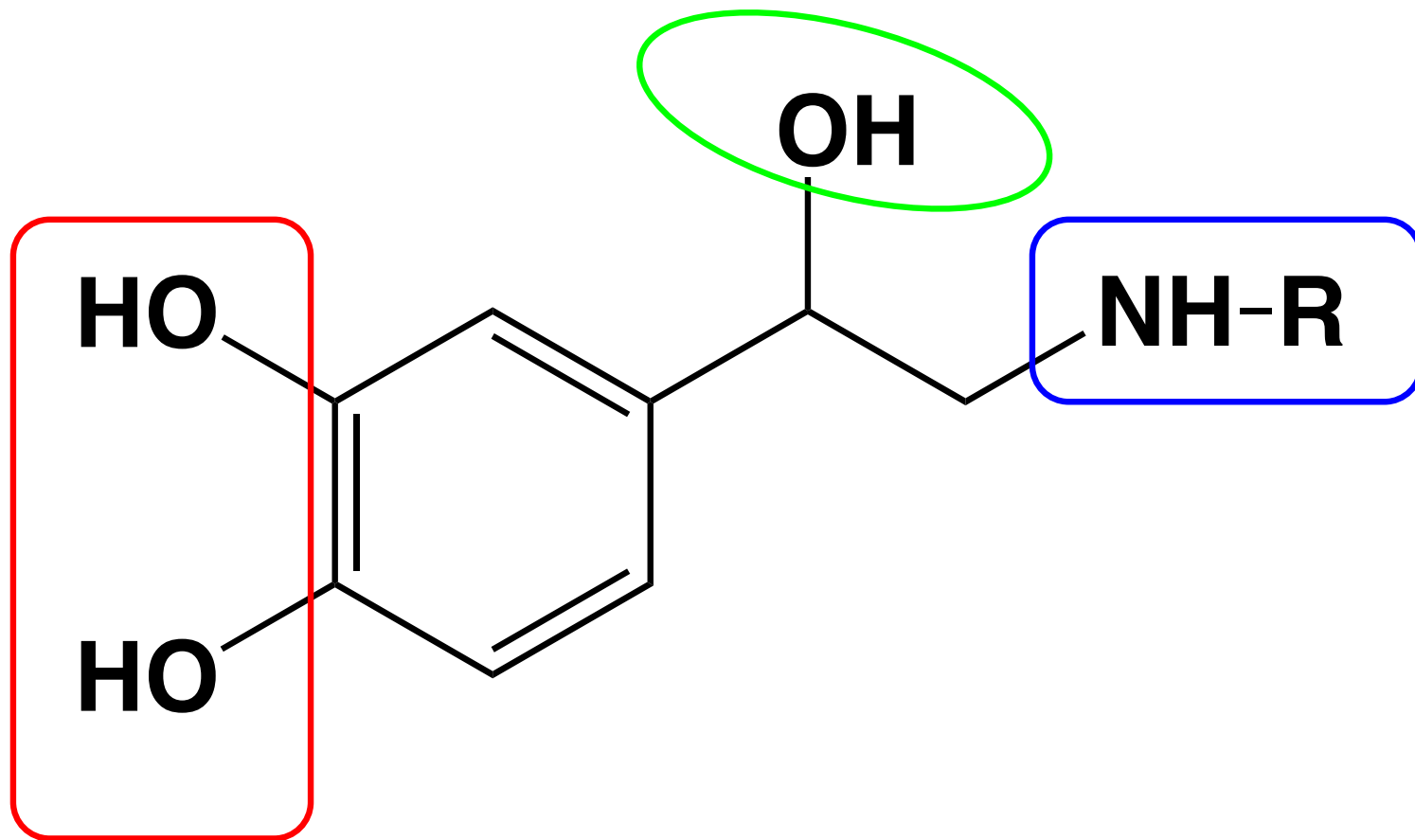
- Sympathomimétiques indirects
- Analeptique cardiovasculaire
- Vasoconstricteur local → rhinites, décongestionnant des voies aériennes supérieures.
- Ephédrine in ACTIFED, TUSSIFED
- Norephédrine in DENORAL, HUMEX.

METHYLDOPA

- ALDOMET*

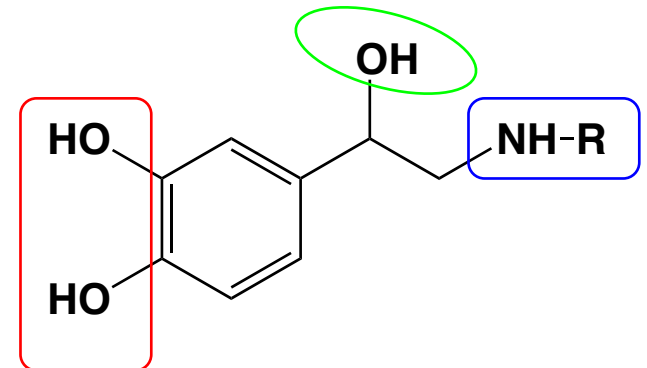


V-RELATIONS STRUCTURE-ACTIVITE

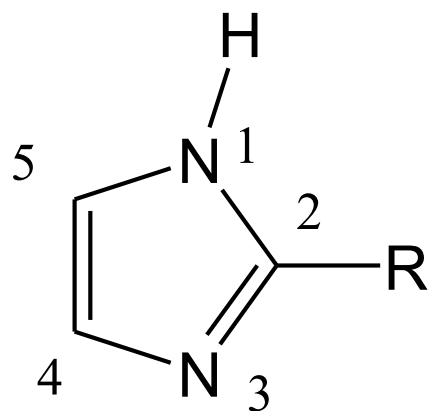


V-RELATIONS STRUCTURE-ACTIVITE

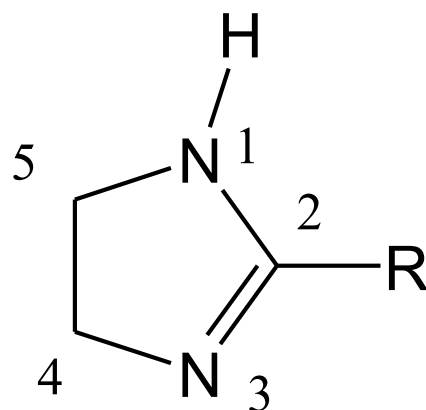
- Importance de la fonction OH secondaire
- Stéréo-isométrie est importante
- Importance de la fonction amine
- Groupes phénoliques
- Chaîne latérale



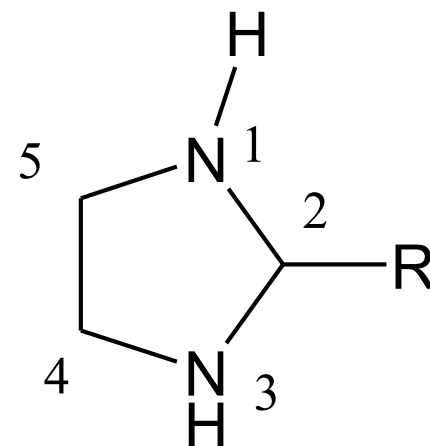
B-DERIVES IMIDAZOLINIQUES



IMIDAZOLE



IMIDAZOLINE



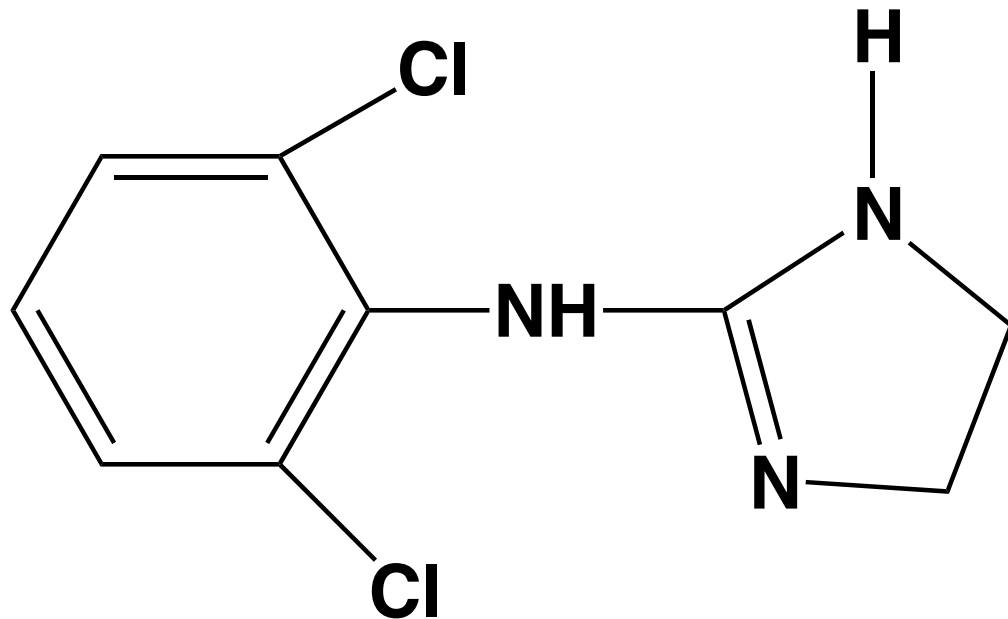
IMIDAZOLIDINE

I-DERIVES UTILISES PAR VOIE GENERALE

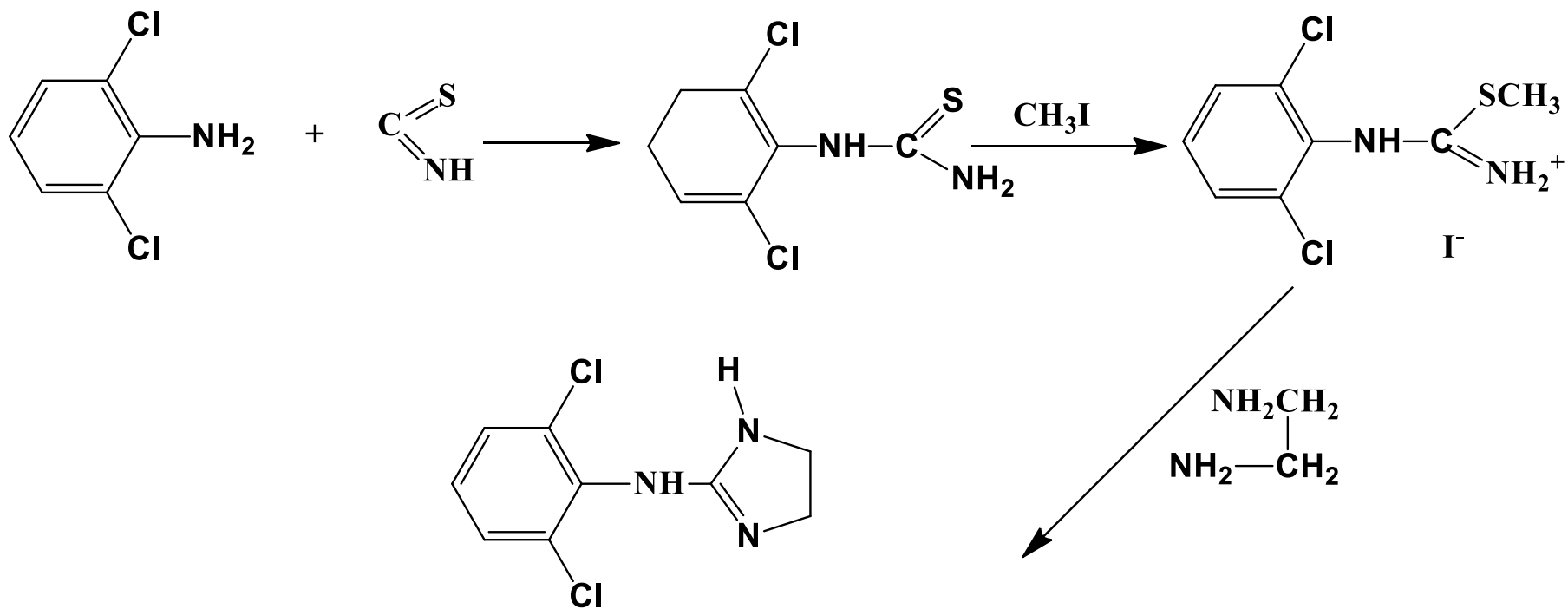
I-1 Clonidine = CATAPRESSAN*

Cp 0,15 mg, injectable:0,15mg/ml

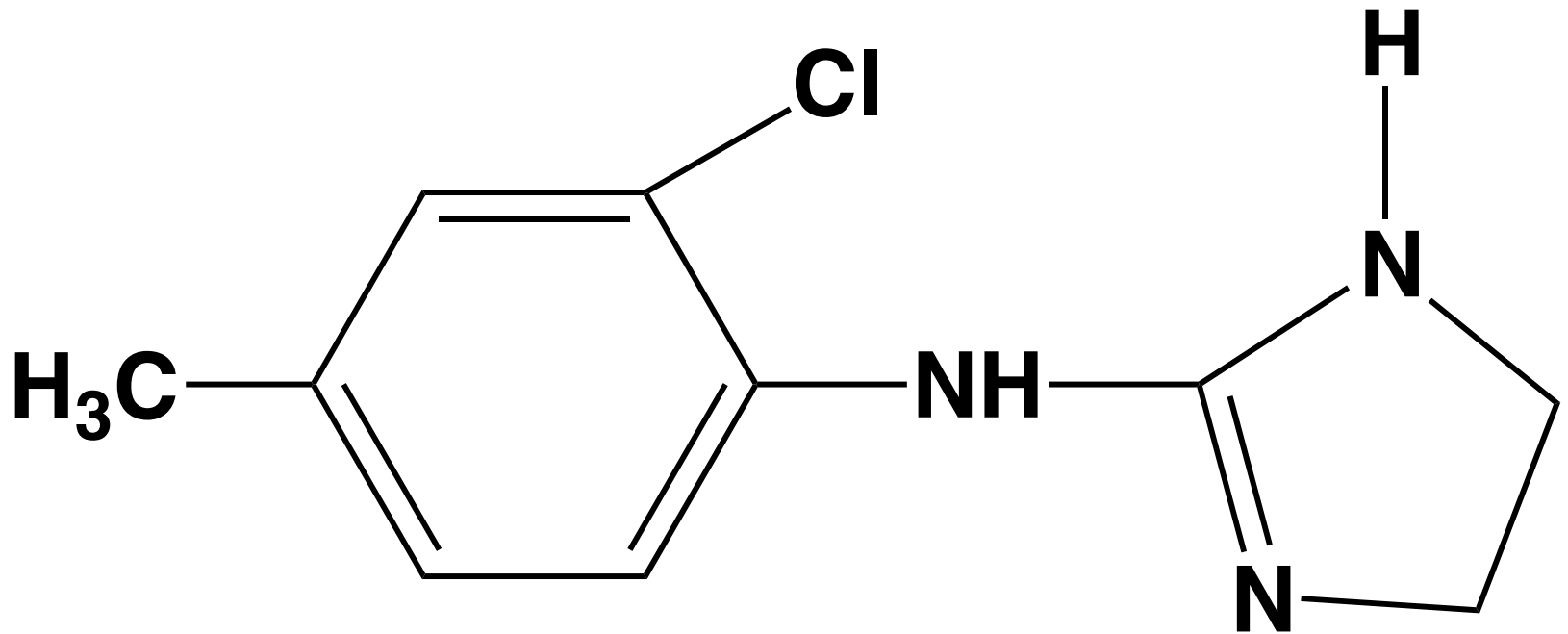
- Synthétisée dans les années 1960



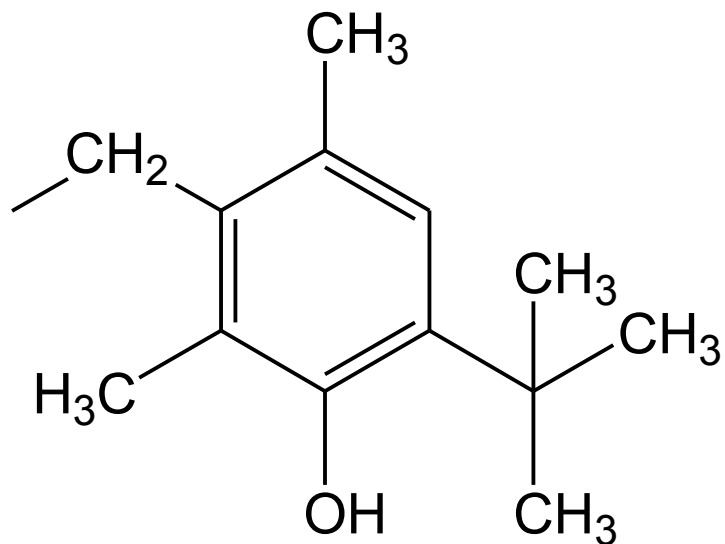
CLONIDINE = CATAPRESSAN*



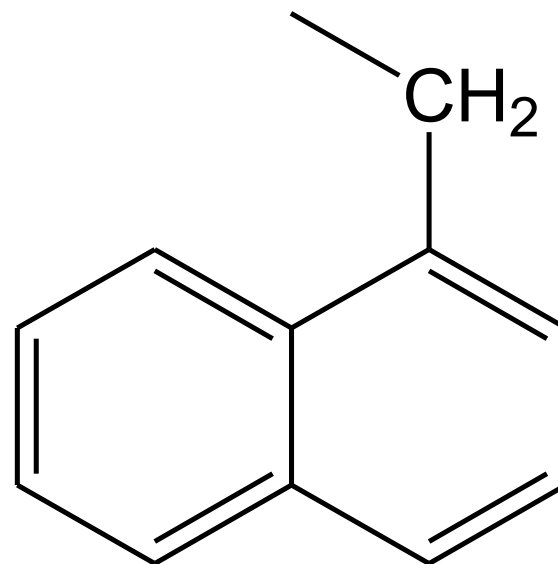
- 1-2 Tolinidine EUCTAN*



II-DERIVES UTILISES PAR VOIE LOCALE



OXYMETAZOLINE



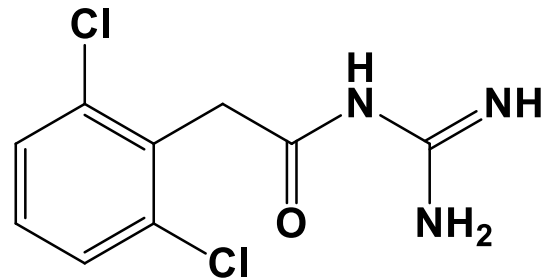
NAPHAZOLINE

II-DERIVES UTILISES PAR VOIE LOCALE

- **DÉRINOX[®]**
prednisolone, naphazoline
- ***ATURGYL[®]**
oxymétazoline
- **DÉTURGYLONE[®]**
prednisolone, oxymétazoline
- Traitement symptomatique local de courte durée des états congestifs et inflammatoires au cours des rhinites aiguës de l'adulte (à partir de 15 ans).

C-AUTRES DERIVES

- I-GUANIDINES
 - GUANFACINE= ESTULIC
 - α_2 adrenergique



Guanfacine= ESTULIC

-GUANOXABENZ= BENZERRAL

