

Questions Pr Garraffo

1- -CM 14 : Un médicament base faible dont le Pka est égal à 8 sera, après administration orale :

D: peu influencé par les variations physiologiques de PH intestinal

Cet item est-il bien faux ou vrai ? Comme le pH de l'intestin tourne autour de 8 et le pKa aussi pour cette base faible, on donne cet item vrai mais nous avons eu plusieurs fois la question de la part des étudiants qui nous ont demandé une confirmation

→ : Une base faible avec un PKA à 8 est encore dépendante des variations de pH (entre 6 et 11)

2- l'item "mieux résorbé à partir du jéjunum » peut-il être un piège par rapport au duodénum ?

→ : Non

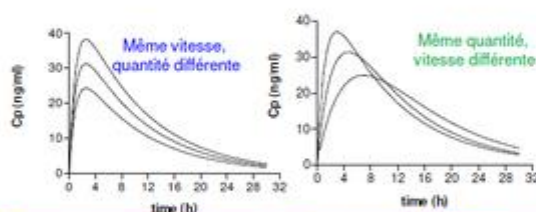
3- QCM 8 : A propos de la pharmacocinétique, donnez la (ou les) réponse(s) vraie(s) :

- A) Deux médicaments qui ont la même vitesse mais des quantités différentes ne sont pas bio équivalents
 - B) Deux médicaments qui ont des vitesses différentes mais la même quantité sont bio équivalents
 - C) Deux médicaments qui ont des vitesses et des quantités différentes ne sont pas bio équivalents
 - D) Deux médicaments qui ont des vitesses et des quantités identiques sont bio équivalents
 - E) Toutes les réponses sont fausses
- Correction ACD

C'est un item rédigé pour un devoir maison inspiré d'une de vos diapositives mais nous avons eu des questions au sujet de l'item D, est-il juste pour vous aussi ou ne correspond-il pas aux caractéristiques Tmax, Cmax et AUC identiques ?

BIODISPONIBILITE/BIOEQUIVALENCE

Dans ce contexte la **biodisponibilité** qualifie la **quantité** du PA qui est absorbée à partir de la forme pharmaceutique et la **vitesse** avec laquelle le principe actif est absorbé dans la circulation générale.



Bioéquivalence = biodisponibilité équivalente: AUC, Tmax et Cmax du PA sont très similaires, IC (0,8 à 1,25), avec les deux formes pharmaceutiques.

Cela conduit à ce qu'ils produisent en réalité les mêmes effets, en termes d'**efficacité** comme de **tolérance**.

R. Garraffo - PACES, 2015

→ Oui, mais les questions sont mal posées, il faut un qualificatif après vitesse (d'absorption) et quantité (résorbée). De plus certaines sont mutuellement exclusives:

4- Concernant la phase biopharmaceutique qui est composée d'une étape de libération et de dissolution, quelle est la bonne version ?

PA en solution=Pa solubilisé?

Solubilisation du PA = libération + dissolution ?

Quelle est la différence entre solubilisation et dissolution ?

biopharmaceutique = désintégration = 1) libération + 2) dissolution (= solubilisation) ?

- ➔ : Il s'agit simplement de chronologie des faits : le médicament est d'abord désagrégré pour se dissoudre plus facilement puis lorsque la dissolution est complète il est alors solubilisé (en solution).
- 5- **Quelle est le délai d'induction maximale** d'une interaction pharmacocinétique du métabolisme ?
 - ➔ : Si vous me demandez le délais d'induction enzymatique, il est de plusieurs jours (7 à 15 j) alors que l'inhibition se fait en quelques heures
- 6- **Le transfert passif est-il considéré comme possible via des transporteurs membranaires ?**
 - ➔ : Ça n'est plus alors un transfert passif mais **facilité**
- 7- **Est-il juste de dire que la constante d'association** est le premier paramètre qui détermine d'abord la liaison aux protéines ou est-ce la constante de dissociation, ou les 2 ?
 - ➔ Les deux sont équivalents puisque l'un est l'inverse de l'autre, mais on parle là de la qualité de la LP, la détermination de la liaison aux protéines s'exprime d'abord en %
- 8- **La destruction de pénicilline par la voie orale peut-elle être considérée comme une intolérance ?**
 - ➔ : Non
- 9- **Lorsqu'on parle d'un pro-médicament**, peut-on tout de même retrouver une partie des métabolites à l'origine d'effets toxiques en plus de ceux à l'origine de l'effet thérapeutique ?
 - ➔ Le pro médicament va donner naissance au principe actif, c'est ensuite ce dernier qui sera vecteur de l'activité et éventuellement de la toxicité. Il peut subir un métabolisme et le/les métabolite(s) pourront actifs, inactifs et/ou toxiques.