

principe actif

le maropitant

Marc Gogny

Unité de Pharmacologie et Toxicologie
École Nationale Vétérinaire
BP 40706
44307 Nantes Cedex 03

Le maropitant est le premier anti-émétique vétérinaire d'une nouvelle classe au mécanisme d'action original : les antagonistes des récepteurs NK-1 des neurokinines.

- Il est indiqué dans le traitement des vomissements, en incluant le mal des transports ou les vomissements induits par la chimiothérapie anticancéreuse.
- Sa commercialisation pour le chien en 2007 a fait rapidement suite à celle de son équivalent chez l'Homme, l'aprepitant, commercialisé en 2003.

PHARMACOLOGIE

Pharmacocinétique

- La biodisponibilité du maropitant après administration orale n'est que de l'ordre de 27 à 37 p. cent selon la dose administrée.
- À la dose unique de 2 mg/kg, la concentration plasmatique efficace est atteinte en une heure environ.

Par voie sous-cutanée, sa résorption n'est pas nettement plus rapide, mais elle est quasi complète.

Très fortement fixé aux protéines plasmatiques, le maropitant passe la barrière hémato-méningée.

- Le maropitant est éliminé sous forme inchangée et en partie sous forme de métabolite. Son élimination se fait surtout par voie biliaire.

Cette élimination est plus lente que celle du métoclopramide : chez le chien, la demi-vie d'élimination est de l'ordre de 4 à 5 heures. La durée d'action de ce composé est donc assez longue et compatible avec une seule prise quotidienne.

- Le maropitant n'est pas autorisé pour l'instant chez le chat, mais son profil pharmacocinétique a été étudié. Son devenir est globalement identique, mais l'élimination est environ 4 fois plus lente que chez le chien.
- Dans les deux espèces, et surtout chez le chat, cette substance peut donc s'accumuler

Classe pharmacologique

- Anti-émétique



Le 1^{er} prix éditorial 2007

PROPRIÉTÉS PHYSICO-CHIMIQUES

● **Dénomination chimique :**
N-[(5-tert-Butyl-2-methoxyphenyl)methyl]-7-[di(phenyl)methyl]-1-azabicyclo[2.2.2]octane-8-amine.

● **Dénomination commune internationale :**
maropitant.

● **Nom commercial :**
Cerenia® (Pfizer).

● **Structure :**

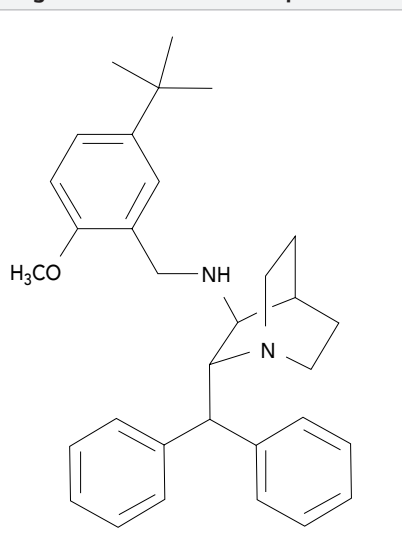
La structure du maropitant est complexe (figure). Sa synthèse, et plus encore celle de l'aprepitant, nécessite le passage par plusieurs étapes coûteuses, ce qui explique en partie le prix du produit.

● **Caractéristiques :**

L'aprepitant est une molécule très liposoluble mais pratiquement insoluble dans l'eau, ce qui interdit la préparation de formes injectables. C'est la raison pour laquelle les laboratoires Merck ont développé un précurseur hydrosoluble, le fosaprepitant, afin de commercialiser une forme injectable.

Le maropitant est une base faible liposoluble, mais sa polarité lui permet toutefois, sous forme de citrate, d'être mise en solution

Figure - Structure du maropitant



aqueuse. En médecine vétérinaire, on la trouve donc sous forme de solution injectable et de comprimés à 16, 24, 60 et 160 mg.

La solution injectable n'a pas fait l'objet d'études particulières de compatibilité. Il faut donc éviter de le mélanger à d'autres produits.

Essentiel

- Le maropitant est un antiémétique d'action longue. Une seule prise quotidienne suffit.
- Il est actif dans différents types de vomissements, du mal des transports aux nausées induites par la chimiothérapie.

RUBRIQUE