

principe actif

la métaflumizone

Jean-Dominique Puyt

Unité de Pharmacologie et Toxicologie
ENVN
BP 40706
44307 Nantes Cedex 03

La métaflumizone est un antiparasitaire externe qui appartient à la famille des semi-carbazones.

Après un développement comme insecticide phytosanitaire, cette molécule est maintenant proposée en médecine vétérinaire soit seule, soit en association avec l'amitraz comme antiparasitaire externe pour le traitement et la prévention des infestations par les puces et les tiques, chez le chien et le chat.

PHARMACOLOGIE

Pharmacocinétique

● La métaflumizone est destinée à être appliquée sur la peau, sous forme de solution *spot on*.

En raison des caractéristiques de ces excipients, la métaflumizone diffuse à la surface de la peau, mais son absorption transcutanée est très faible.

● Lors d'application unique, sa concentration plasmatique reste en dessous des seuils de détection. Il s'agit par conséquent d'un *spot on* à action de surface.

Les puces s'intoxiquent non par ingestion de sang, mais par ingestion de la substance présente à la surface de la peau.

● Des concentrations actives se maintiennent chez le chien pendant environ 6 semaines et sont même quantifiables jusqu'à 56 jours. Néanmoins, comme avec tout *spot on*, ces teneurs cutanées sont assez variables.

● La biodisponibilité orale de la métaflumizone chez le rat est faible. La molécule s'élimine principalement dans les fèces et très faiblement par voie urinaire.

La distribution de la métaflumizone est très large, ce qui se traduit par un volume apparent de distribution élevé.

La molécule subit des biotransformations très importantes dans l'organisme, qui conduisent à plus d'une dizaine de métabolites retrouvés dans la bile, l'urine, le foie et les reins.

Pharmacodynamie

● La métaflumizone fait partie des bloqueurs dits "état-dépendants" des canaux sodiques membranaires.

- Elle se fixe en effet sur les canaux sodiques voltage-dépendants, avec une affinité supérieure pour les canaux à l'état activé, c'est-à-dire ouverts au moment de la dépolarisation.

- Cette molécule bloque donc la naissance et la conduction de l'influx nerveux, mais elle atteint de préférence les neurones qui ont, chez l'insecte, une activité tonique permanente, notamment les neurones moteurs, d'où son action paralysante.

- Sa fixation sur les canaux n'est pas immédiate, mais prend une vingtaine de minutes. Il s'ensuit une paralysie flasque qui apparaît progressivement, entre 1 et 3 heures après le contact avec l'insecticide.

Classe pharmacologique

- Ectoparasiticide (insecticide)
- Classe : semi-carbazones

Indication

■ La métaflumizone est un ectoparasiticide destiné au traitement des puces et sans activité sur les tiques.



Le 1^{er} prix éditorial 2007

Essentiel

■ La métaflumizone agit sur les canaux sodiques membranaires, provoque une paralysie puis la mort de l'insecte sur 24 heures ; elle bloque la ponte de la puce mais n'a pas d'action ovicide.

■ La métaflumizone est appliquée sur la peau en solution *spot on*.

■ Chez le chat, elle est utilisée seule dans la lutte contre les puces.

■ Chez le chien, elle est associée à l'amitraz et agit sur les puces et sur les tiques.

■ La tolérance locale et générale des spécialités *spot on* à base de métaflumizone est excellente.

PROPRIÉTÉS PHYSICO-CHIMIQUES

● **Dénomination chimique :**

2-[2-(4-cyanophényl)-1-[3-(trifluorométhyl)phényl]éthylidène]-N-[4-(trifluorométhoxy)phényl]hydrazinecarboxamide

● **Dénomination commune internationale :** métaflumizone

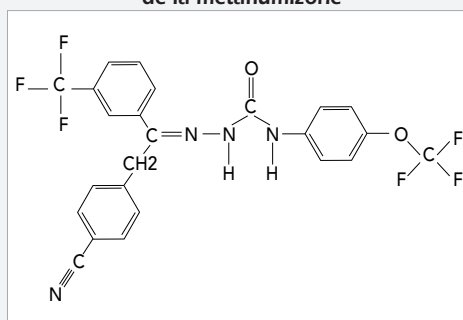
● **Noms commerciaux :** Promeris[®], Promeris Duo[®]

● **Structure et filiation :**

Découverte au début des années 1990, la métaflumizone appartient à une nouvelle classe chimique d'insecticides : les semi-carbazones (figure).

Elle est constituée d'un mélange d'isomères E et Z, dans des proportions 9 : 1.

Figure - Structure de la métaflumizone



● **Caractéristiques :**

La métaflumizone est une base faible liposoluble et très peu soluble dans l'eau.

RUBRIQUE