

# Actiskenan®

## Sulfate de morphine en gélules à libération immédiate

La Rédaction



### **RAPPELS PHARMACO-CHIMIQUES :**

La morphine est un alcaloïde opiacé utilisé sous forme de sulfate pentahydraté de structure chimique :  $2(C_{17}H_{19}NO_3), H_2SO_4, 5H_2O$ . La morphine se présente sous forme d'une poudre blanche cristalline. La solubilité dans l'eau de la forme sulfate est meilleure que celle du chlorhydrate.

### **PHARMACOCINÉTIQUE DE L'ACTISKÉKAN®**

L'absorption au niveau du tractus gastro-intestinal est rapide. La biodisponibilité est de 30% par rapport à la morphine administrée par voie veineuse. Environ 30% des molécules de morphine sont liées aux protéines plasmatiques. La distribution se fait vers les tissus parenchymateux et les muscles squelettiques. La métabolisation hépatique produit des dérivés glycoconjugués sans action antalgique. L'élimination est rénale.

### **BIOÉQUIVALENCE :**

L'évaluation de la bioéquivalence entre le sulfate de morphine en gélule à libération immédiate et une solution de morphine a été réalisée avec des formulations dosées à 30 mg. Les concentrations plasmatiques, du moment

de l'ingestion jusqu'à 24 heures, sont parfaitement superposables.

La tolérance au cours de l'étude a permis de relever les mêmes effets indésirables pour les deux formes : somnolence, nausées et vomissements, ainsi que constipation. Ces effets, prévisibles, peuvent tous être anticipés. Il en est de même pour la dépression respiratoire, qui apparaît pour de fortes posologies. La tolérance pour les deux formes est jugée équivalente.

### **TOXICOLOGIE :**

La DL 50 du sulfate de morphine chez le rat est de 461 mg/kg par voie orale et de 70 mg/kg par voie veineuse. Pour la forme microgranule, elle est supérieure à 750 mg/kg. Le décès survient après la 12<sup>ème</sup> heure, après une phase d'agitation et d'excitation.

### **PRÉSENTATION :**

L'Actiskenan® se présente sous forme de gélules dosées à 5, 10, 20 et 30 mg. Leur diamètre est compris entre 0, 6 et 0, 9 mm. Elles sont disponibles à l'hôpital, comme en usage libéral. Les quatre dosages sont homothétiques. Les gélules peuvent être ingérées entières ou ouvertes et diluées dans des aliments.

### **INDICATIONS ET POSOLOGIE :**

L'indication recommandée est celle des douleurs intenses ou rebelles aux antalgiques de niveau plus faible. L'Actiskenan® trouve aussi sa place comme traitement des douleurs aiguës. Sa biodisponibilité et sa rapidité d'action en font un médicament intéressant en urgence.

Pour un usage prolongé, il est recommandé d'effectuer une « titration » pour définir la dose quotidienne juste nécessaire. L'administration se fera toutes les 4 heures. L'avantage par rapport aux formes à libération prolongée réside en une rapidité d'action intéressante dans les pics douloureux et en une adaptation de la posologie plus facile.

Pour les douleurs aiguës intenses de l'adulte, la prise initiale sera de 10 mg.

L'administration est possible dès l'âge de 6 mois.

Chez les personnes âgées et fragiles, les posologies sont réduites de moitié.

La prescription d'un anti-émétique et de règles hygiéno-diététiques simples peuvent être utiles dès le début du traitement.