

STASMOLYTIQUES

oteur de l'intestin

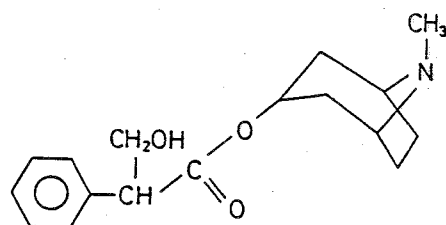
1823

TABLEAU I. — Liste des principales affections s'accompagnant de troubles de la motricité intestinale

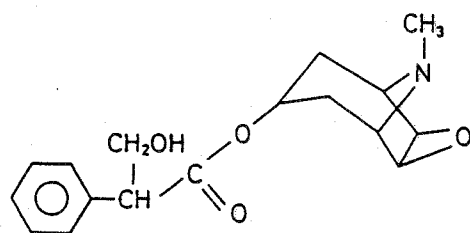
-
- Côlon irritable (« colopathie fonctionnelle » : « colopathie spasmodique » ; « troubles fonctionnels intestinaux » : « intestin irritable »...).
 - Iléus post-opératoire.
 - Diarrhées « motrices » post-vagotomie.
 - Neuropathie diabétique.
 - Tumeurs endocrines (hyperthyroïdie, tumeur à stroma amyloïde, syndrome carcinoïdien).
 - Pseudo-obstructions intestinales chroniques.
 - Sclérodermie.
 - Maladie de Hirschsprung (mégacôlon congénital) et maladie de Chagas (mégacôlon acquis).
 - Diverticulose colique.
 - Colite des laxatifs.
 - Amylose intestinale.
-

(Signé)

Alcaloïdes naturels

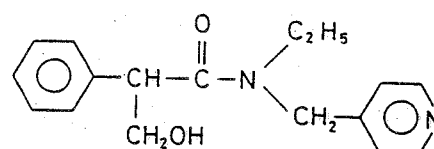


acide tropique + tropine = atropine



scopolamine

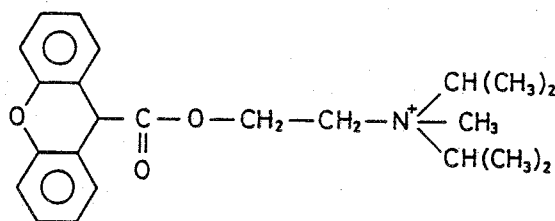
Autres amines tertiaires



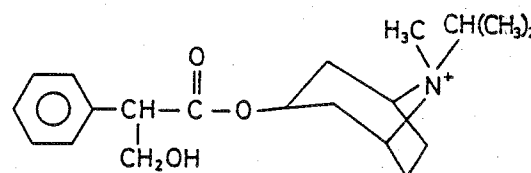
tropicamide*

- benzatropine (cf. Tableau 2, ch. 27)
- pirenzépine (cf. Figure 3, ch. 39)

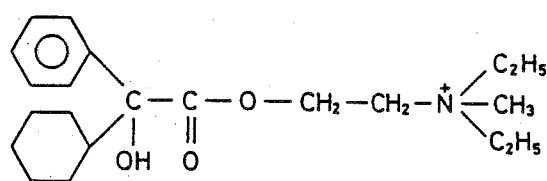
Ammoniums quaternaires



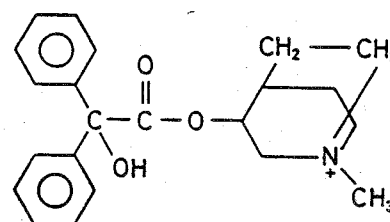
propanthéline



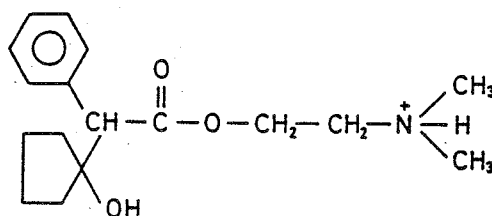
ipratropium



oxyphénonium



clidinium



cyclopentolate*

Figure 1. Structures chimiques des antimuscariniques usuels.

* Usage ophtalmique (Tableau 3).

Tableau 2: Choix d'antimuscariniques

Antimuscariniques (classes)	Spécialités (B, CH, F) monocomposées ou év. association (ass.)	d.p.d. (mg)	Indication(s) thérapeutique(s) principale(s) *
Amines tertiaires			
atropine (sulfate).....		0.5-2	Spasmolytique, prémédication, antidote, surtout en association
butétamate (citrate)		10-200	Spasmolytique
depropine (citrate).....	Brontine (B)	0.5-4	Asthme
hexahydroadiphenine (chlorhydrate).....	Spasmo-Cibaigine (B, CH) (ass.), Priscophène (CH) (ass.)	20-60	Spasmolytique
oxyphencyclimine (chlorhydrate)	Daritran (B, CH) (ass.), Daricon (B), Manir (F)	5-20	Spasmolytique
pipéridolate (chlorhydrate)	Dactil (B, CH, F)	100-200	Spasmolytique
scopolamine (bromhydrate)	Scopoderm TTS (CH, F), Scopos (F)	0.25-0.5 i.m.	Mal des transports; prémédication
Ammoniums quaternaires			
benzilonium (bromure)	Portyn (B), Minelsin (CH)	30-60	Spasmolytique
butylscopolaminium (bromure)	Buscopan (B, CH, F)	30-100	Spasmolytique
clidinium (bromure).....	Librax (B, CH, F) (ass.)	7.5-20	Spasmolytique
diphémanil (méthylsulfate)	Prantal (F)	100-400	Spasmolytique
diponium (bromure)	Spaslar (CH) (ass.)	30-180	Spasmolytique
émépronium (bromure).....	Cetiprin (CH)	200-600	Incontinence nocturne, spasmes de la vessie, ténésmes
glycopyrronium (bromure)	Robinul (B, CH),	2-12	Prémédication, spasmolytique
hexocyclium (méthylsulfate)	Tral (CH), Traline (F)	25-100	Spasmolytique
ipratropium (bromure)	Atrovent (B, CH, F), Berodual (CH) (ass.)	aérosol	Asthme, bronchospasme
isopropamide (iodure)	Priamide (B), Vésalium (B, CH) (ass.)	10-20	Spasmolytique
mépénzolate (bromure).....	Cantil (B, F)	75-200	Spasmolytique
méthylatropine (nitrate, bromure)		0.2-0.9	Spasmolytique
oxitropium (bromure)	Tersigat (F)	aérosol	Asthme, bronchospasme
oxyphénonium (bromure).....	Antrényl (B, CH)	10-40	Spasmolytique
parapenzolate (bromure).....	Spacine (F)	1	Spasmolytique
penthienate (bromure).....	Monodral (B)	7.5-15	Spasmolytique
pipenzolate (bromure)	Piptal (B, F)	8-20	Coliques, spasmes
prifinium (bromure).....	Riabal (F)	140-210	Spasmes, ulcères
propanthéline (bromure).....	Pro-Banthine (B, CH, F)	60-120	Spasmolytique
propyromazine (bromure)	Diaspasmyl (F)	50-150	Spasmolytique, anti-allergique
tiémonium (iodure, méthylsulfate).....	Viscéralgine (B, CH, F)	150-300	Spasmolytique

* Antimuscariniques antiparkinsoniens: cf. Tableaux 2 et 5, ch. 27

Autres classes d'anti-asthmatiques: cf. Tableaux 2 et 4, ch. 19.

Antispasmodiques, modificateurs de la motricité digestive: cf. Tableau 3, ch. 41.

Drugs and gastrointestinal tract motility



- Purgatives are:
 - bulk laxatives, e.g. ispaghula husk (first choice for slow action)
 - osmotic laxatives, e.g. lactulose
 - faecal softeners, e.g. docusate sodium
 - stimulant purgatives, e.g. senna.
- Drugs which increase motility without purgation:
 - domperidone, used in disorders of gastric emptying.
- Drugs used to treat diarrhoea:
 - oral rehydration with isotonic solutions of NaCl plus glucose or starch-based cereal (important in infants)
 - antimotility agents, e.g. loperamide (unwanted effects: drowsiness and nausea)
 - absorbents, e.g. magnesium aluminium silicate.

Rang p 377

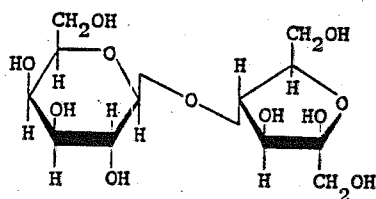
LAXATIFS

Notions essentielles

- Il existe peu de médicaments donnant lieu à une autoprescription aussi importante et injustifiée que les laxatifs. Bien que la plupart de ces produits soient peu dangereux lorsqu'ils sont prescrits occasionnellement, leur consommation abusive est une cause d'accidents iatrogènes, parfois graves.
- Une caractéristique de ce groupe de médicaments est la grande diversité de leur structure chimique et de leur mécanisme d'action présumé. Par commodité, on classe les laxatifs en cinq familles :
 - les laxatifs de lest : fibres alimentaires (son) et mucilages ;
 - les laxatifs lubrifiants (huile de vaseline et de paraffine) ;
 - les laxatifs osmotiques salins (sels de magnésium) et sucrés (mannitol, lactulose) ;
 - les laxatifs stimulants (dérivés du diphénylméthane, des anthraquinones et du dioctyl-sulfosuccinate de sodium) ;
 - les laxatifs utilisés par voie rectale.
- Après avoir éliminé une cause organique, le traitement de la constipation habituelle est basé avant tout sur des règles hygiéno-diététiques. La prescription d'un laxatif doit toujours se faire parmi les produits les moins dangereux et agissant : soit en hydratant et en augmentant le volume des selles, (fibres, mucilages, lactulose), soit en ramollissant et en lubrifiant le bol fécal (huile de paraffine).
- L'usage des laxatifs stimulants doit être abandonné compte tenu de leur toxicité et de leur mode d'action irrationnel.
- La maladie des laxatifs est l'une des complications majeures mais heureusement exceptionnelle de l'usage prolongé de ces médicaments et particulièrement des laxatifs stimulants. Il s'agit d'une véritable affection psychiatrique qui s'observe le plus souvent chez la femme et qui peut mettre en jeu le pronostic vital. La difficulté majeure est d'obtenir l'arrêt de l'automédication.

(Séverin)

5196. **Lactulose**, 4-O-β-D-Galactopyranosyl-D-fructose; 4-D-galactopyranosyl-4-D-fructofuranose; 4-O-β-D-galactosyl-D-fructose; 4-β-D-galactosido-D-fructose; Bifiteral; Duphalac; Laevilac. $C_{12}H_{22}O_{11}$; mol wt 342.30. C 42.10%, H 6.48%, O 51.42%. Prepd from lactose by alkaline epimerization: Montgomery, Hudson, *J. Am. Chem. Soc.* 52, 2101 (1930); Oosten, *Rec. Trav. Chim.* 86, 673 (1967).

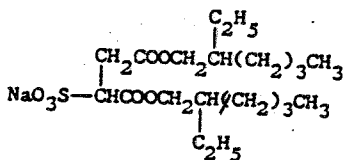


Hexagonal clustered plates from methanol, mp 169.0° (1°/min). Sweeter than lactose, but not as sweet as sucrose. Shows mutarotation; constant value after 24 hrs: -51.4° (c = 4 in H_2O at pH 4.8 and 20°). Soly in water (w/w) at 30°: 76.4%; at 60°: 81%; at 90°: > 86%. Acid hydrolysis yields galactose and fructose. Reduces Fehling's soln.

THERAP CAT: Laxative.

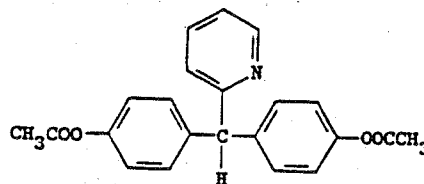
= DOCUSATE

3288. **Diocetyl Sodium Sulfosuccinate**. *Sulfobutanedioic acid 1,4-bis(2-ethylhexyl) ester sodium salt; sulfosuccinic acid 1,4-bis(2-ethylhexyl) ester S-sodium salt; bis(2-ethylhexyl)-sodium sulfosuccinate; sodium dioctyl sulfosuccinate; DSS; Aerosol OT; Alphasol OT; Colace; Comfolax; Complemix; Coprol; Dioctylal; Dioctyl-Medo Forte; Diotilan; Diovac; Disonate; Doxinate; Doxol; Dulcivac; Molatoc; Molcer; Molofac; Nevax; Norval; Regutol; Softil; Soliwax; Solusol; Sulfinel DOS; Valsol OT; Velmol; Waxsol.* $C_{20}H_{37}NaO_5S$; mol wt 444.56. C 54.03%, H 8.39%, Na 5.17%, O 25.19%, S 7.21%. Prepd by reaction of the appropriate alcohol with maleic anhydride followed by addition of sodium bisulfite: Jaeger, U.S. pats. 2,028,091; 2,176,423 (1936, 1939, both to Am. Cyanamid). Structure and wetting power: Caryl, *Ind. Eng. Chem.* 33, 731 (1941).



Available as wax-like solid, usually in rolls of tissue-thin material; also as 50-75% solns in various solvents. To make aq gel-like suspension, soak solid in some water overnight before making final dilution. Soly in water (g/l): 15 (25°), 23 (40°), 30 (50°), 55 (70°). Sol in carbon tetrachloride, petr ether, naphtha, xylene, dibutyl phthalate, liq petrolatum, acetone, alcohol, vegetable oils. Very sol in water + alcohol, water + water-miscible organic solvents. Surface ten-

1256. **Bisacodyl**, 4,4'-(2-Pyridylmethylene)bisphenol diacetate; bis(p-acetoxypheyl)-2-pyridylmethane; (4,4'-diacetoxypheyl)(2-pyridyl)methane; 2-(4,4'-diacetoxypheyl)methylpyridine; Dulcolax; Dulcolan; DAMP; Nigalax; Laco; Laxadin; Laxorex; Durolax; Pyrilax; Perilax; Endokolat; Brocalax; Telemin; Ulcolax. $C_{22}H_{19}NO_6$; mol w 361.38. C 73.11%, H 5.30%, N 3.88%, O 17.71%. Prepn Karl Thomae GmbH, Brit. pat. 730,243 (1955). Pharmacology and toxicology: Schmidt, *Arzneimittel-Forsch.* 3, 1 (1953).



Tasteless crystals, mp 138°. Practically insol in water and alkaline solns. Sol in acids, alc, acetone, propylene glycol and other organic solvents. LD₅₀ orally in rats: > 3 g/kg. Combination with tannin, *clysodrast*.

THERAP CAT: Cathartic.

1257. **Bis(4-amino-1-anthraquinonyl)amine**. 1,1'-Iminobis[4-amino-9,10-anthracenedione]; 4,4'-diamino-1,1'

Consult the cross ind

Tableau 1: Laxatifs agissant par leurs propriétés physico-chimiques

A) Laxatifs à base de gomme (g) ou de mucilage (m)	Choix de spécialités (B, CH, F)
carragaheen (m)	Coréine (B, F)
guar (g)	Mucipulgit (+ simaldrate) (B, CH, F)
karaya (g)	Colosan mite (CH)
ispaghule (m)	Agiolax mite (+ plantago ovata) (CH), Spagulax mucilage pur (F)
psyllium (m)	Metamucil (B, CH), Mucilar (CH), Osmolax (F), Effersyllium (+ KHCO ₃ , citrate de K) (CH), Psyllium Langlebert (F)
sterculia (g)	Inolaxine (B, CH, F), Decorpa (B), Normacol (B, CH, F), Enteromucilage (+ Vit PP et B ₁) (F)
B) Laxatifs lubrifiants	
paraffine	Agarol (+ agar-agar) (B, CH), Lansoyl gelée (F), Laxamalt (+ extrait de malt) (B, F), Lubentyl (CH, F), Nujol (F), Paragar (+ phénolphtaléine et agar-agar) (CH)
vaseline	Molagar (+ gélose) (F), Parilax (F)
C) Laxatifs osmotiques	
à base de magnésium	Kruschels ² (KCl, NaCl, MgSO ₄ , K ₂ SO ₄ , Na ₂ SO ₄) (B) Magnésie San Pellegrino ² (ac. tartrique, NaHCO ₃ , Mg(OH) ₂) (B, F) Citrato Espresso San Pellegrino ² (Mg(OH) ₂ , ac. citrique, NaHCO ₃) (CH) Andrew's Pulver ² (MgSO ₄ , NaHCO ₃ , ac. citrique) (CH) Chlorumagène ² (Mg(OH) ₂) (CH) Milk of Magnesia (Mg(OH) ₂) ¹ (CH) Manicol ² (F), Mannite Saprochi ² (CH) Bifiteral ¹ (B), Duphalac ¹ (B, CH, F), Gatinar ¹ (CH) Limonette ¹ (ac. tartrique, NaHCO ₃) (B) Sorbitol Delalande (sorbitol) ² (F)
à base de mannitol à base de lactulose divers	

¹ Liquide.² Poudre.

Tableau 2: Laxatifs stimulants

A) Dérivés anthraquinoniques	Choix de spécialités (B, CH, F)
1) Naturels	
à base d'aloïne	Boldine Houdé à l'aloïne ³ (B)
à base de cascariosides	Mucinum ³ (F), Péristaltine ¹ (F)
à base de frangulosides	Colosan ² (+ g. karayae) (CH), Irgalax ¹ (CH), Normacol ² (B, CH, F)
à base de rhamnosides	Peristaltine ¹ (CH)
à base de sennosides	Laxilène au Séné ¹ (B), Laxiplant ² (+ plantago) (CH), Laxomid ¹ (CH), Pursennide ¹ (CH, F), Senokot ³ (B, F)
2) Synthétiques	
à base de dantrone	Dioctylal Peristaltic ⁴ (+ docusate de Na) (B), Dorbanex ⁴ (+ poloxamère) (B), Dorbantyl ¹ (+ docusate de Na) (CH), Fructines Vichy ³ (F), Jamiène (+ docusate de Na) (F), Modane ¹ (+ panth. de Ca) (F), Muxol (+ bisacodyl, nicotinamide) (CH), Pilules Vichy ³ (B), Softène (+ docusate de Na) (B, CH)
B) à base de bisacodyl	Bekunis B ¹ (B), Codylax ¹ (B), Critex ¹ (B), Contalax ³ (F), Dulcolax ¹ (B, CH, F), Prontolax ¹ (CH)

¹ Dragées.² Granulés.³ Comprimés.⁴ Capsules.

Tableau 3: Laxatifs par voie rectale

Composition	Choix de spécialités (B, CH, F)
A) Suppositoires	
NaHCO ₃ , bitartrate de Na, docusate de Na	Suppolax (B)
NaHCO ₃ , bitartrate de Na	Eductyl (F)
glycérine, stéarate de Na bisacodyl	Bulboïd (CH) Dulcolax (B, CH, F), Arcalax (B), Contalax (F)
B) Microlavements	
glycérine, docusate de Na	Laxavit (B)
laurylsulfoacétate de Na, citrate de Na	Microlax (B), Microlax bébé (F) Microklist (CH)
bisacodyl	Ercolax (CH) Dulcolax Rectal (B)
gélatine, glycérine	Bébégel (F)
gélatine, mannitol	Doulax (F)
C) Lavements	
Na ₂ HPO ₄ , NaH ₂ PO ₄	Fleet-Enema (B), Klysma (B), Practo-Clyss (B, CH)
docusate de Na + sorbitol	Klyx (B, CH)
sorbitol	Klysma au sorbitol (B)
glycérine	Practomil (CH)