72. Pharmacocinétique des anticoagulants oraux

Anticoagulants utilisables par voie orale : paramètres pharmacocinétiques

DCI	Spécialités	Demi-vie (heures)	Durée d'action (jours)	Délai d'action (heures)
AVK à demi-vie courte				
Acénocoumarol	SINTROM MINISINTROM	8	2-3	24-48
AVK à demi-vie longue				
Fluindione	PREVISCAN	31	3-4	36-72
Warfarine	COUMADINE	35-45	3-5	36-72
AOD				
Rivaroxaban	XARELTO	7-11		2-4
Apixaban	ELIQUIS	12		3-4
Dabigatran	PRADAXA	12-14		0,5-2

AVK

- Les AVK présentent une résorption digestive rapide et presque complète.
- Leur fixation aux protéines plasmatiques est importante. Ils sont donc présents dans le plasma sous deux formes : l'une libre, active, et l'autre inactive, liée aux protéines. Toute perturbation de l'équilibre entre ces deux formes va modifier l'efficacité des AVK.
- Ils sont métabolisés par le foie et leur élimination est urinaire.
- Les AVK traversent le placenta et passent dans le lait.
- La demi-vie plasmatique des différents AVK varie entre 8 et 45 heures (voir *tableau ci-dessus*).
- L'obtention de l'état d'équilibre nécessite plusieurs jours.
- L'action anticoagulante persiste plusieurs jours (2 à 4 jours) après l'arrêt du traitement.

Anticoagulants oraux directs

- Le **rivaroxaban** a une biodisponibilité de 80 à 100 %.
  - Après prise orale, le pic plasmatique est obtenu en 2 à 4 heures. Ce pic plasmatique rapide ainsi que l'action sur toutes les formes de facteur Xa (formes libres et liées) permettent une utilisation d'emblée sans traitement préalable par héparine.
  - Le traitement préventif en postopératoire est débuté 6 à 10 heures après l'intervention chirurgicale.
  - La demi-vie de 7 à 11 heures permet une seule prise par jour.
  - L'élimination est majoritairement rénale.
- L'**apixaban** a une biodisponibilité de 50 %.
  - Après prise orale, le pic plasmatique est obtenu en 3 à 4 heures.
  - Le traitement préventif en postopératoire est débuté 12 à 20 heures après l'intervention chirurgicale.
  - L'élimination de ce principe actif est à 27 % de sa dose par voie rénale.
- Le **dabigatran étexilate** est converti rapidement et complètement en dabigatran, qui est la forme active dans le plasma après prise orale.
  - Le pic plasmatique est obtenu 0,5 à 2 heures après administration et l'action sur toutes les formes du facteur IIa permet là aussi l'utilisation d'emblée (sans traitement préalable à l'héparine).
  - Le traitement préventif en postopératoire est débuté 1 à 4 heures après l'intervention chirurgicale.
  - La demi-vie comprise entre 12 et 14 heures permet une seule prise par jour.
  - L'élimination est majoritairement rénale.