Zeitschrift: Acta Tropica

Herausgeber: Schweizerisches Tropeninstitut (Basel)

Band: 23 (1966)

Heft: 1

Artikel: Nouveau traitement des schistosomiases et de l'amibiase, le CIBA

32644-Ba

Autor: Lambert, C.R.

Kapitel: II: Chimie

DOI: https://doi.org/10.5169/seals-311336

Nutzungsbedingungen

Die ETH-Bibliothek ist die Anbieterin der digitalisierten Zeitschriften auf E-Periodica. Sie besitzt keine Urheberrechte an den Zeitschriften und ist nicht verantwortlich für deren Inhalte. Die Rechte liegen in der Regel bei den Herausgebern beziehungsweise den externen Rechteinhabern. Das Veröffentlichen von Bildern in Print- und Online-Publikationen sowie auf Social Media-Kanälen oder Webseiten ist nur mit vorheriger Genehmigung der Rechteinhaber erlaubt. Mehr erfahren

Conditions d'utilisation

L'ETH Library est le fournisseur des revues numérisées. Elle ne détient aucun droit d'auteur sur les revues et n'est pas responsable de leur contenu. En règle générale, les droits sont détenus par les éditeurs ou les détenteurs de droits externes. La reproduction d'images dans des publications imprimées ou en ligne ainsi que sur des canaux de médias sociaux ou des sites web n'est autorisée qu'avec l'accord préalable des détenteurs des droits. En savoir plus

Terms of use

The ETH Library is the provider of the digitised journals. It does not own any copyrights to the journals and is not responsible for their content. The rights usually lie with the publishers or the external rights holders. Publishing images in print and online publications, as well as on social media channels or websites, is only permitted with the prior consent of the rights holders. Find out more

Download PDF: 13.12.2025

ETH-Bibliothek Zürich, E-Periodica, https://www.e-periodica.ch

I. Introduction

Si les 3 principales schistosomiases humaines (Schistosoma haematobium, S. mansoni, S. japonicum) représentent l'un des problèmes les plus importants d'hygiène publique dans le monde (estimation de 200 à 300 millions de cas), nul doute qu'elles n'ont pas encore trouvé de réponse thérapeutique valable. Seuls les dérivés trivalents de l'antimoine et à un moindre degré les thioxanthones ont réussi à s'imposer en pratique. D'autres groupes chimiques ont un intérêt expérimental, mais n'ont pas encore leur place en thérapeutique humaine. Aussi les bilharzioses restent l'exemple de parasitoses très répandues, dont les traitements ont des posologies actives trop proches de la toxicité et même de la létalité; le traitement de masse est inapplicable par les médicaments actuellement connus; la thérapeutique éradicative reste encore sans solution pratiquement réalisable.

Le traitement antiamibien a connu un essor florissant en amibicides de contact, mais est resté pratiquement stérile en amibicides tissulaires ou diffusibles; or ces derniers sont les seuls actifs, quand on s'adresse à l'amibiase maladie nettement caractérisée, lorsque la forme végétative du protozoaire a créé les lésions typiques au sein des tissus de la paroi intestinale ou même au-delà, dans le parenchyme hépatique en particulier. Les seuls amibicides tissulaires sont l'émétine (la déhydro-émétine plus récemment), la conessine (presque abandonnée à cause de sa toxicité) et la chloroquine à doses élevées.

Le CIBA 32644-Ba a donné des résultats très prometteurs, laissant présager un avenir beaucoup moins sombre du traitement des schistosomiases et une heureuse alternative de l'émétine dans l'amibiase. C'est à la connaissance de ce nouveau produit que ce travail est consacré, dans toutes ses incidences chimiques, pharmacologiques, biologiques et thérapeutiques. Le 1- (5-nitro-2-thiazolyl)-2-imidazolidinone fut sélectionné sur la base d'une meilleure activité pour une moindre toxicité, parmi les autres dérivés étudiés. Un symposium, tenu à Lisbonne en juin 1965, a réuni une cinquantaine de chercheurs. Leurs rapports sur l'activité du nouveau médicament ont été publiés en un volume (voir Acta Tropica, Supplément N° 9, 1966, Verlag für Recht und Gesellschaft AG., Bâle).

II. Chimie

Le CIBA 32644-Ba est le 1-(5-nitro-2-thiazolyl)-2-imidazolidinone. Synthétisé par Wilhelm & Schmidt (128), sa formule chimique s'inscrit de la façon suivante :

Il se présente sous forme d'une poudre jaune, pratiquement insoluble dans l'eau, colorant en brun l'urine des animaux qui l'absorbent. Son poids moléculaire est de 214.

Les résultats du screening général ont montré 3 groupes de composés ayant une activité intéressante :

- les nitroimidazoles, action trichomonacide;
- les nitrofuranes, action antibactérienne et antischistosomienne ;
- les nitrothiazoles, dont les propriétés antiamibiennes et antischistosomiennes furent plus particulièrement étudiées.

Parmi les nitrothiazoles étudiés, seul le groupe nitrothiazolylimidazolidinone se met en évidence pour ses propriétés antischistosomiennes et antiamibiennes tissulaires. La spécificité du groupe chimique est moins prononcée pour l'action antiamibienne que pour l'action antischistosomienne.

III. Pharmacologie — Toxicité — Tolérance

A. Pharmacologie

Chez le lapin narcotisé, le CIBA 32644-Ba entraîne à la dose de 3 mg/kg i.v. une chute légère et transitoire de la pression artérielle, sans modification de la réactivité circulatoire vis-à-vis de l'adrénaline, de l'acétylcholine et de l'hypertensine. Chez le chien non narcotisé, on n'observe pas non plus d'effet cardio-vasculaire jusqu'à 2 × 10 mg/kg i.v. (pression artérielle, fréquence cardiaque, ECG). Ni chez le chat, ni chez le chien narcotisés, le débit coronarien et le débit cardiaque ne sont modifiés jusqu'à la dose de 10 mg/kg i.v. Le rat, rendu hypertendu par la méthode de Goldblatt, ne voit sa pression artérielle pratiquement pas modifiée jusqu'à la dose de 100 mg/kg/jour p.o., pendant 11 jours.

De même, le CIBA 32644-Ba est sans effet notable sur la respiration du lapin narcotisé jusqu'à 30 mg/kg i.v., mais chez le même animal normal, il inhibe la respiration dès 30 mg/kg i.v. Il ne montre pas de propriétés anticonvulsives (antagonisme contre la strychnine) ou analgésiques (stimulation thermalgésique) chez la