

Nouveaux principes actifs pharmaceutiques

Bilan des approbations FDA en décembre 2025

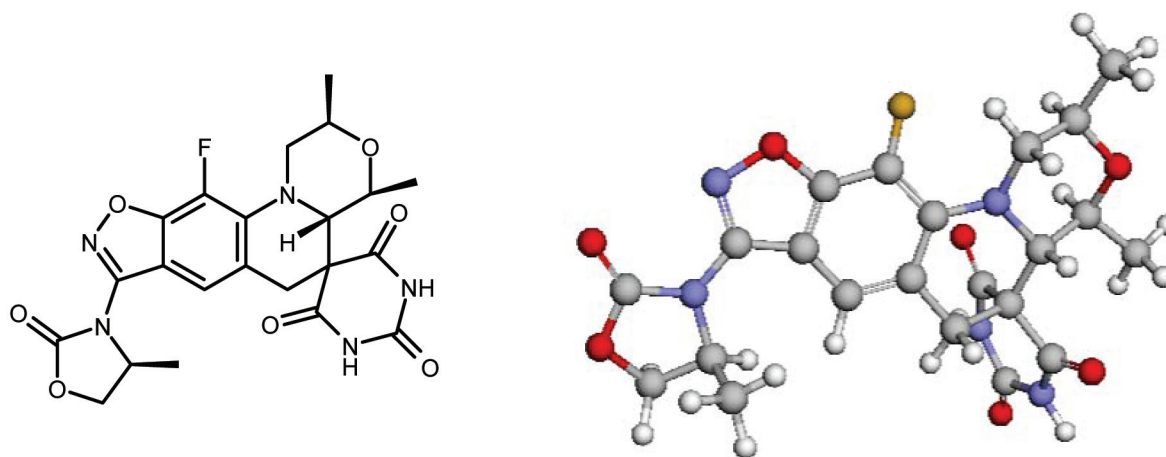
Au cours de cette période, quatre molécules de synthèse et quatre molécules d'origine biologique ont été approuvées.

Molécules de synthèse

Principe actif	Compagnie	Indication
Etripamil	Milestone Pharms USA	Tachycardie paroxystique supraventriculaire
Zoliflodacin	Entasis Therap	Gonorrhée urogénitale
Aficamten	Cytokinetics	Cardiomyopathie hypertrophique obstructive symptomatique
Tradipitant	Vanda Pharms Inc	Vomissements mal des transports

L'**étripamil** est utilisé pour le traitement de la tachycardie supraventriculaire paroxystique ; il agit en bloquant des canaux calciques. La tachycardie paroxystique supraventriculaire est un rythme cardiaque rapide et régulier (160 à 220 battements par minute) qui débute et s'arrête brutalement et qui a son origine au niveau du tissu cardiaque autre que celui des ventricules.

La **zoliflodacin** est approuvée dans le traitement de la gonorrhée urogénitale non compliquée chez les personnes pesant au moins 35 kg. La zoliflodacin est le premier agent antibactérien de la famille des spiropyrimidinetriones, elle inhibe les topoisomérases bactériennes de type II (ADN gyrase et topoisomérase IV). La zoliflodacin se lie au complexe ADN-gyrase clivé pour bloquer la religation de l'ADN et interagit avec des acides aminés conservés de la sous-unité B de la gyrase. Ce mode d'action spécifique, ciblant la sous-unité B de la gyrase, permet une activité contre les souches résistantes à d'autres classes d'antimicrobiens, notamment les fluoroquinolones. La zoliflodacin a démontré une activité *in vitro* contre les espèces bactériennes suivantes : *Staphylococcus aureus*, *Streptococcus pneumoniae*, *Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *Neisseria gonorrhoeae* et *Chlamydia trachomatis* ; ce qui permet d'espérer de nouvelles approbations dans le domaine des maladies infectieuses.



Structure de la zoliflodacin. Nomenclature : (2R,4S,4aS)-11-fluoro-2,4-diméthyl-8-((4S)-4-méthyl-2-oxo-1,3-oxazolidin-3-yl)-1,2,4,4a-tetrahydro-2'H,6H-spiro((1,2)-oxazolo(4,5-g)(1,4)oxazino(4,3-a)quinoline-5,5'-pyrimidine)-2',4',6'(1'H,3'H)-trione ; n° CAS : 1620458-09-4. La représentation 3D provient du site Drugbank⁽¹⁾ : https://go.drugbank.com/structures/small_molecule_drugs/DB12817

L'**aficamten** est indiqué dans le traitement des adultes atteints de cardiomyopathie hypertrophique obstructive symptomatique. La molécule se lie directement au domaine moteur de la myosine cardiaque, ce qui diminue la contractilité cardiaque, entraînant une réduction de l'obstruction de la voie d'éjection du ventricule gauche.

Le **tradipitant** est utilisé pour prévenir les vomissements induits par le mal des transports. C'est un antagoniste des récepteurs de la neurokinine 1. Il agit en bloquant la substance P, une petite molécule de signalisation agissant sur ces récepteurs.

Molécules d'origine biologique

Principe actif	Type de molécule	Compagnie	Indication
Lerodalcibep-liga	Protéine de fusion	Lib Therapeutics, Inc.	Hypercholestérolémie
Depemokimab-ulaa	Anticorps monoclonal	Glaxosmithkline Llc	Asthme sévère
Amivantamab and hyaluronidase-lpuj	Anticorps bispécifique / Enzyme	Janssen Biotech	Cancer du poumon à non petites cellules
Narsoplimab-wuug	Anticorps monoclonal	Omeros Corp	Microangiopathie thrombotique associée à la greffe de cellules souches hématopoïétiques.

Le **lerodalcibep** est utilisé pour le traitement de l'hypercholestérolémie. Il s'agit d'une protéine de fusion recombinante contenant un inhibiteur de la protéine convertase subtilisine/kexine de type 9 (PCSK9) et de l'albumine sérique humaine.

Le **depemokimab** est un anticorps monoclonal antagoniste de l'interleukine-5 (IL-5). Il est structuellement similaire au mépolizumab mais contient sept substitutions d'acides aminés dans la séquence de la chaîne lourde. Il est indiqué en traitement d'entretien adjuvant de l'asthme sévère caractérisé par un phénotype éosinophilique chez les personnes âgées de douze ans et plus.

L'**amivantamab/hyaluronidase** est une association médicamenteuse à dose fixe utilisée dans le traitement du cancer du poumon non à petites cellules. L'association contient de l'amivantamab, un anticorps bispécifique dirigé contre le récepteur du facteur de croissance épidermique (EGFR) et le récepteur du facteur de croissance des hépatocytes (MET), et une enzyme, l'hyaluronidase. L'administration est effectuée par perfusion sous-cutanée.

Le **narsoplimab** est un anticorps monoclonal utilisé dans le traitement de la microangiopathie thrombotique associée à la greffe de cellules souches hématopoïétiques. C'est un inhibiteur de la sérine protéase-2 associée à la lectine liant le mannose (MASP-2). La microangiopathie thrombotique associée à la greffe de cellules souches hématopoïétiques est une complication grave et potentiellement mortelle de cette intervention, caractérisée par la formation de minuscules caillots sanguins dans les petits vaisseaux sanguins. Ceci peut entraîner des lésions organiques, notamment au niveau des reins, du système cardiovasculaire et du tube digestif.

⁽¹⁾Drugbank est une banque de données sur les principes actifs accessible sur Internet : D.S. Wishart *et al.*, DrugBank 5.0: a major update to the DrugBank database for 2018, *Nucleic Acids Res.*, **2018**, 46, p. D1074-D1082.

Cette rubrique est coordonnée et alimentée par **Jean-Marc PARIS**, ancien directeur de recherche pharmaceutique dans le groupe Rhône-Poulenc et ancien directeur scientifique de la chimie organique et biotechnologies de Rhodia (jeanmarc.paris@free.fr), et **Josette FOURNIER**, qui a présidé de 2007 à 2010 le comité d'orientation et de prospective scientifique de l'Observatoire des résidus de pesticides (ORP) (josette.fournier4@orange.fr).

45
Sc
21

**Culture
sciencesChimie**


ENS


MINISTÈRE
DE L'ÉDUCATION
NATIONALE, DE
L'ENSEIGNEMENT
SUPÉRIEUR ET DE
LA RECHERCHE

Mis à disposition
**CAPES et
AGRÉGATION**
 aux épreuves orales

Site de ressources en Chimie pour les enseignants

Thèmes en lien avec les

**PROGRAMMES
D'ENSEIGNEMENT**

Contenu validé par des

CHERCHEURS

Articles, Vidéos, Diaporamas

AGENDA, ACTUALITÉS

événements, conférences, parutions
scientifiques...

http://culturesciences.chimie.ens.fr

