

Activité documentaire : Différentes formulations de l'aspirine

Objectifs : Réinvestir les connaissances du cours précédents sur les *espèces chimiques naturelles et de synthèse*
 Découvrir les notions de *principe actif, excipients, formulations, médicaments princeps et génériques*.
 Analyser les différentes formulations de l'aspirine avec support expérimental.
 Savoir lire l'étiquette d'un médicament.

➤ **Document 1 : Historique de l'aspirine**

A l'origine de la synthèse de l'aspirine, molécule qui n'existe pas dans la nature, il y a l'acide salicylique, molécule extraite de plantes telles que le saule, la reine-des-prés (spirée) qui agit comme *antipyrétique* et *analgésique*. L'acide salicylique est synthétisé industriellement dès 1874, c'est-à-dire avec les débuts de la chimie organique, mais en raison d'effets secondaires, on cherche à le transformer pour obtenir un médicament moins agressif pour l'organisme.

C'est le chimiste allemand Félix Hoffmann, qui travaille pour l'entreprise de chimie Bayer, qui met au point la synthèse de l'aspirine ou acide acétylsalicylique ; son collègue pharmacologue Arthur Eichengrün avait, quant à lui, remarqué en premier les propriétés *antalgiques* de l'aspirine. Aspirin® est le nom choisi par la firme Bayer et Cie.

➤ **Document 2 : Extrait d'une encyclopédie**

La forme galénique d'un médicament est la forme sous laquelle le médicament est présenté : comprimé, sirop, gélule, suppositoire, poudre ...

Elle est choisie pour faciliter la prise du médicament, son absorption, sa tolérance et en permettre une bonne conservation.

Le **principe actif** du médicament est un corps pur possédant des propriétés thérapeutiques reconnues.

Il est mélangé à d'autres espèces chimiques, appelées **excipients**, le plus souvent dépourvues d'actions thérapeutiques et qui permettent de rendre le principe actif plus efficace.

La **formulation** d'un médicament consiste à déterminer la nature et les proportions des différents ingrédients qui le composent.

La formulation permet entre autres :

- de présenter le médicament sous une forme adaptée pour la voie d'administration souhaitée.

➤ **Document 3 : Notices de deux médicaments**



500 mg

forme : comprimé

paracétamol 500 mg par cp

excipients : lactose, amidon prégélatinisé, carboxyméthylamidon, stéarate de magnésium, amidon de blé (gluten)

classement pharmaco-thérapeutique VIDAL : antalgique/antipyrétique : paracétamol



500 mg

forme : comprimé effervescent sécable

paracétamol 500 mg par cp effervo

excipients : acide citrique, carbonate de sodium anhydre, bicarbonate de sodium, sorbitol, saccharine sodique, docusate sodique, povidone, benzoate de sodium.

classement pharmaco-thérapeutique VIDAL : antalgique/antipyrétique : paracétamol

➤ **Document 4 : Médicaments princeps et médicaments génériques**

Lorsqu'une substance active est susceptible d'aboutir à un médicament commercialisable, un brevet est déposé par un laboratoire pharmaceutique qui mène alors des recherches pour étudier l'effet de la substance active sur des organismes vivants.

Jusqu'à expiration du brevet (environ 20 ans), le laboratoire garde l'exclusivité de la commercialisation du médicament original, appelé princeps.

Une copie du produit original peut ensuite être développée et commercialisée par d'autres laboratoires : c'est un médicament générique qui contient le même principe actif.

Depuis 1999, les pharmaciens ont le droit de substituer un médicament générique à un médicament princeps prescrit par un médecin.

➤ **Document 5 : Comparaison de deux aspirines**

ASPIRINE DU RHONE 500

Composition

Acide acétylsalicylique 500 mg
Excipient : amidon, gel de silice.
Antalgique, antipyrétique, anti-inflammatoire à dose élevée, antiagrégant plaquettaire.

Mode d'administration

Doit être utilisé de préférence avant ou au cours d'un repas même léger. Absorber les comprimés après les avoir fait désagréger dans un verre d'eau.

Contre indication

Ne doit pas être utilisé en cas d'ulcère de l'estomac ou du duodénum, de maladies hémorragiques.

ASPIRINE pH8^{1M}

Composition

Acide acétylsalicylique : 500 mg
Excipient : amidon de riz, acétophtalate de cellulose, phtalate d'éthyle q.s.p. 1 comprimé gastro-résistant de 580 mg.
Analgésique, antipyrétique, anti-inflammatoire à dose élevée, antiagrégant plaquettaire.

Mode d'administration

Les comprimés sont à avaler tels quels avec une boisson (eau, lait ou jus de fruit).

➤ **Document 6 : Comparaison de notices**

Les notices de trois médicaments sont données ci-dessous :



ASPIRINE DU RHONE[®]

forme : comprimé
acide acétylsalicylique 500 mg par cp
excipients : amidon de maïs, cellulose en poudre
classement pharmaco-thérapeutique :
antalgique/antipyrétique



LEVOTHYROX[®]

forme : comprimé sécable
lévothyroxine sodique 100 µg par cp
excipients : lactose monohydraté, amidon de maïs, gélatine.
classement pharmaco-thérapeutique :
hormone thyroïdienne



ACTRON[®]

forme : comprimé effervescent
acide acétylsalicylique 267 mg
paracétamol 133 mg
caféine 40 mg
excipients : bicarbonate de sodium, acide citrique
classement pharmaco-thérapeutique :
antalgique/antipyrétique

Exploitation des documents

➤ **Doc 1**

Q1 / Rechercher la signification des mots en italiques.

Q2 / Expliquer l'origine du nom commercial « *Aspirin* » donné à la molécule d'acide acétylsalicylique.

➤ **Doc 2 & 3**

Q3 / « Un médicament est un mélange d'espèces chimiques ». Justifier cette affirmation.

Q4/ Rappeler comment on nomme une substance constituée d'une seule espèce chimique.

Q5/ Quelles sont les deux catégories d'espèces chimiques présentes dans chaque médicament ?

Q6/ Quel est le principe actif des deux médicaments étudiés ?

Q7/ Quel est le mode d'administration de chacun de ces deux médicaments ?

➤ **Doc 4 & 5**

Q8/ A votre avis, pourquoi les pharmaciens proposent-ils souvent le médicament générique à la place du médicament princeps ?

Q9/ Quel est le principe actif commun à ces deux médicaments ?

Q10 / Par quoi diffèrent ces deux médicaments ?

➤ **Doc 6**

Q11/ Quels sont les principes actifs de chacun de ces médicaments ?

Q12/ Rechercher l'origine naturelle ou synthétique des principes actifs et de chacun des excipients de ces médicaments. Présenter les résultats des recherches sous forme d'un tableau.

Q13/ Parmi les espèces chimiques synthétiques, quelles sont celles qui sont artificielles (*inventées par l'homme*) ?

Q14/ Que signifie le symbole ® présent après chaque nom de médicament ?