

Chapitre 2 : Principe actif, formulation, identification

Introduction

Pour soigner la fièvre et les douleurs, de nombreux médicaments sont vendus en pharmacie. **Comment choisir un médicament à l'aide de sa notice ?**

Le pharmacien propose souvent le médicament générique. **Quelle est la différence avec le médicament prescrit sur l'ordonnance ?**

Sur la notice des médicaments, il y a toujours une rubrique « Mode et voie d'administration ». En effet, l'espèce active doit être administrée sous la forme la mieux adaptée pour atteindre sa « cible » dans l'organisme. **Que deviennent les médicaments absorbés ?**

Objectif du cours

- ✓ Savoir lire la notice d'un médicament
- ✓ Analyser la formulation d'un médicament : principe actif et excipients.
- ✓ Réaliser et interpréter une chromatographie sur couche mince
- ✓ Connaître les caractéristiques physiques permettant d'identifier une espèce chimique.

Travaux préliminaires

- ❖ [Activité introductrice à faire à la maison : Différentes formulation de l'aspirine](#)
- ❖ [Etude de la vidéo : « C'est pas sorcier »- Les médicaments](#)

I. Qu'est ce qu'un médicament ?

1. Définition

La définition du mot médicament est fixée par une loi du 26/02/07 du code de la santé publique.

« On entend par médicament toute substance ou composition présentée comme possédant des propriétés curatives ou préventives à l'égard des maladies humaines ou animales [...] »

Remarque : Cette définition officielle est très importante. En effet, elle permet de différencier le médicament d'un grand nombre d'autres produits qui voudraient bénéficier du statut de « médicament » sans pour autant respecter les conditions drastiques imposées par la loi et requises pour bénéficier de ce statut.

2. De quoi est composé un médicament ?

- ❖ [Voir Activité introductrice à faire à la maison : Doc 2](#)

Un médicament est un mélange **de nombreuses espèces chimiques**. Il contient un ou plusieurs **principes actifs** et des **excipients**.

a) Principe actif

➤ **Définition : Substance active connue pour prévenir ou guérir une maladie**

Exemples : Voir p 30 manuel & Activité introductrice

<u>Nom du médicament</u>	<u>Principe(s) actif(s)</u>
Advil	Ibuprofène
Aspégic	Acétylsalicylate de DL-lysine
Efferalgan	Paracétamol
Actron	Acide salicylique, Paracétamol , caféine

Remarque :

- Le principe actif est, la plupart du temps, en très faible proportion dans le médicament par rapport aux excipients. ...
- Le principe actif est désigné par sa dénomination commune internationale (DCI): c'est le nom utilisé dans tous les pays du monde. C'est souvent son nom scientifique.

b) Excipients

- **Définition :** Un excipient désigne toute espèce chimique présente dans la composition du médicament autre que le principe actif.

Exemples : Voir manuel p 30

Amidon ; silice ; glycine ; arôme mandarine ; bicarbonate de sodium ; acide citrique ; leucine ; ect ...

➤ Propriétés

- Les excipients sont données sur sa notice
- Ils sont dépourvus d'effet thérapeutique.
- Les excipients permettent de :
 - **présenter le médicament sous une forme adaptée pour la voie d'administration souhaitée :** (comprimé, solution buvable, gélules, suppositoire...)
 - **Modifier le goût et l'odeur du médicament**
 - **Moduler la vitesse de libération du principe actif vers l'organisme**
 - **Améliorer la conservation du médicament ...**

[Interroger les élèves : Pourquoi est-il important de lire la notice pour connaître la liste des excipients ?]

Remarque :

Il est important de lire cette notice car la présence de certains excipients (saccharose, lactose par exemple) peut avoir un impact, notamment sur des patients allergiques. Dans ce cas, on parle alors d'excipients à effets notoires.]

3. Quelle est la différence entre un médicament Princeps et générique ?

[Interroger les élèves : Qu'est ce qu'un médicament générique ? Pourquoi les pharmaciens proposent-ils de plus en plus souvent le médicament générique ? Quelle est la différence avec le médicament prescrit sur l'ordonnance ? Le médicament générique aura-t-il le même effet que celui initialement prescrit par le médecin ?]

- ❖ Voir Activité introductrice à faire à la maison : Doc 4
- ❖ Vidéo : Les médicaments génériques
- ❖ Présentation powerpoint.

➤ Définitions

Un médicament princeps ou médicament d'origine est un médicament mis au point par un laboratoire pharmaceutique qui en garde l'exclusivité jusqu'à expiration du brevet (environ 10 ans d'exploitation). A l'expiration du brevet, une copie du produit original peut ensuite être développée et commercialisée par d'autres laboratoires : c'est le médicament générique.

Un médicament générique contient la même substance active que le médicament original (princeps). Son aspect ou sa présentation peuvent changer: les excipients peuvent être différents.

Remarques :

- **Un médicament générique est moins cher qu'un princeps (en moyenne 30%)** car les coûts de recherche et de développement n'entrent pas dans le prix. Seuls les coûts de fabrication et de commercialisation interviennent.
- Depuis 2003, l'assurance maladie rembourse les médicaments sur la base du prix des génériques: un assuré qui choisirait d'acheter un princeps à la place du générique devra en assumer le surcoût.
- Depuis le 23 décembre 1998, les pharmaciens ont le droit de substituer un médicament générique à un médicament princeps prescrit par le médecin.

4. Qu'est ce que la formulation d'un médicament ?

❖ Voir Activité introductrice à faire à la maison : Doc 2

Pour un même principe actif, sont disponibles en pharmacie différentes formes possibles d'administration.

➤ **Définition : La formulation (ou mise en forme) permet de présenter le médicament sous la forme la plus adaptée à l'assimilation du principe actif selon le mode d'administration du médicament.**

La formulation consiste à choisir les excipients adaptés au mode d'administration pour en faciliter l'emploi ou la consommation.

Exemples :

- Les comprimés secs contiennent souvent de la cellulose ou de l'amidon qui permettent au cachet de se désagréger.
- Le bicarbonate de sodium présent dans les comprimés effervescents permet au cachet de se dissoudre dans l'eau.
- Les arômes facilitent la prise de comprimé à avaler.

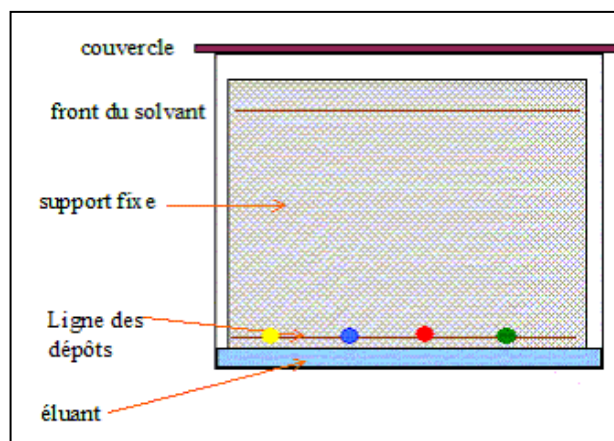
II. Comment identifier des espèces chimiques ?

Les espèces chimiques contenues dans les médicaments sont issues soit de la nature, soit de la synthèse. Pour pouvoir les identifier, il existe différentes techniques expérimentales d'analyse.

1. La chromatographie sur couche mince : C.C.M

- ❖ Voir TP N°4 : Chromatographie et identification
- ❖ Voir cours manuel p 35 & 36

*La chromatographie est une technique qui permet de **séparer** et **d'identifier** les espèces chimiques d'un mélange. Elle est basée sur les différences d'affinité des espèces chimiques*

Schéma :

Principe :

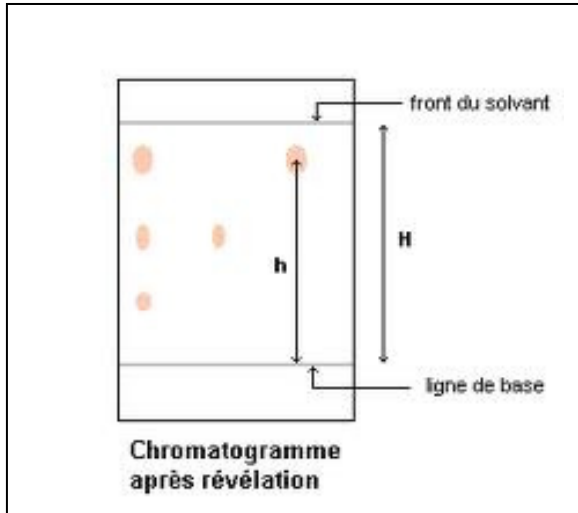
✓ Une chromatographie possède deux phases :

La phase fixe : support où l'on dépose les substances. (papier filtre, plaque de silice)

La phase mobile : c'est l'éluant

✓ Chaque espèce chimique a une **vitesse de migration** qui lui est propre et qui dépend de l'éluant et de la nature de la phase fixe. **Les espèces chimiques qui ont migré à des hauteurs identiques sont les mêmes.**

Exploitation d'une C.C.M : Le Rapport frontal



$$R_f = \frac{h}{H}$$

- ➔ h est la distance entre la ligne de dépôt et le centre de la tache = distance parcourue par l'espèce chimique
- ➔ H est la distance parcourue par l'éluant dans le même temps
- ➔ h et H doivent être exprimées dans la même unité
- R_f est sans unité

A retenir : Dans les mêmes conditions expérimentales, deux espèces identiques ont le même rapport frontal.

- ❖ Exercices d'application : 7 ; 8 ; 12 ; 13_p 39- 41
- ❖ Pour s'entraîner : Exercice résolu p 40

2. Les températures de changements d'état

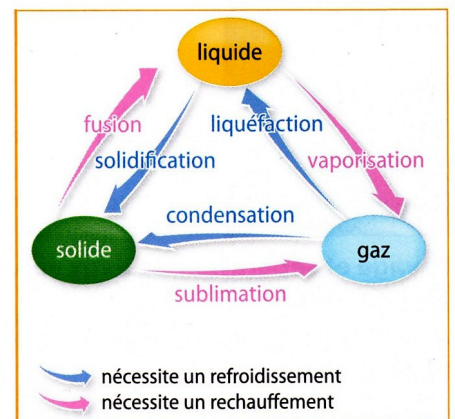
[Interroger les élèves : Qu'est ce qu'un changement d'état ? Quels sont les changements d'états ?...]

Définition : Un changement d'état est la transformation physique correspondant au passage d'un état à un autre

• **La température d'ébullition** d'un corps pur (sous pression constante), notée T_{éb}, est la température à laquelle l'espèce passe de l'état liquide à l'état gazeux, à une pression donnée.

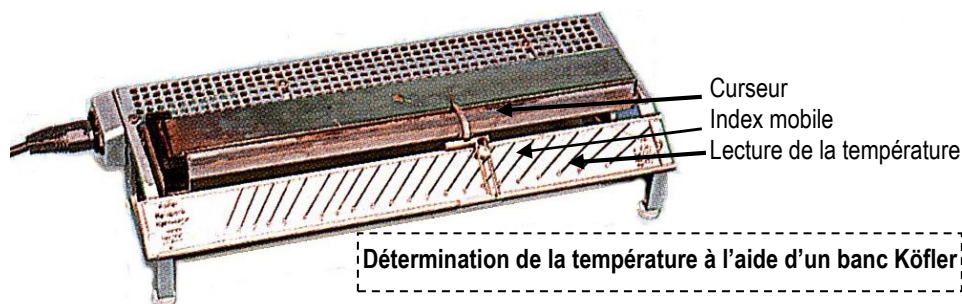
• **La température de fusion** notée T_f, est la température à laquelle une espèce passe de l'état solide à l'état liquide, à une pression donnée.

La mesure de la température de fusion d'un solide est simple et rapide à mettre en oeuvre, grâce à un appareil appelé **banc Köfler**.



Les différents changements d'état de la matière.

- ❖ Voir fiche méthode manuel p 333



*[Démonstration du banc Kofler sur l'exemple de l'acide benzoïque par exemple.
Montrer l'étiquette du produit et demander à un élève de lire la T_f – Faire faire l'expérience]*

Propriété :

Les températures de changement d'état sont caractéristiques d'une espèce chimique pure.

Exemples : Voir doc 14 p 36

- ✓ La glace fond à 0°C et l'eau bout à 100°C
- ✓ L'eau pure bout à **100°C** au niveau de la mer, mais à 3000 m d'altitude, où la pression est plus faible, sa température d'ébullition est **de 91°C** .
- ✓ Le fer fond à 1535°C alors que le plomb fond à 328°C

[Montrer les étiquettes de différents flacons et demander à des élèves de venir lire les température de changement d'état]

Conséquence : Si un échantillon ne change pas d'état à la température attendue, soit il n'est pas pur, soit ce n'est pas l'espèce chimique attendue

Exemple : La banquise dégèle vers -4°C , alors que la température de fusion de l'eau pure est 0°C car la glace de la banquise n'est pas de l'eau pure

- ❖ **Exercices d'application : 9 ; 10 & 13 p 39**
- ❖ **Exercices de synthèse : 14 ; 15 16 ; 17 p 41**