

Compétences exigibles

- Analyser la formulation d'un médicament.
- Comprendre le rôle de la chimie de synthèse.

Chapitre 5 – Principe actif, formulation, identification

(chapitre 2 du livre)

1 Formulation d'un médicament

Qu'est-ce que la formulation d'un médicament ? Quelle est son utilité ?

Doc. 1 – Définitions

Un médicament est constitué d'un ou plusieurs **principe(s) actif(s)** possédant des effets thérapeutiques. Il contient aussi des **excipients**, espèces chimiques généralement sans effet physiologique.

Par exemple, le lactose est un excipient souvent utilisé, car il permet d'obtenir un volume de poudre suffisant pour fabriquer un comprimé de taille convenable. Il est dit à effet notoire, car il n'est pas sans effet : certaines personnes ne peuvent pas le digérer.

Doc. 2 – Formulation d'un médicament

« L'une des étapes essentielles dans la conception d'un médicament est sa préparation ou "**formulation**". Celle-ci est destinée à accompagner le principe actif d'un excipient pour le rendre stable et le délivrer là où il est censé agir. Les chimistes cherchent ainsi à découvrir quelle est la meilleure forme de préparation et d'administration du médicament. »

« Une nouvelle stratégie pour concevoir des médicaments », Journal du CNRS du 4 décembre 2007.

a. Quel est le principe actif des médicaments du doc. 3 ?

Compétence S'approprier : Mobiliser ses connaissances ; extraire l'information utile.

b. Quel est le mode d'administration de chacun de ces médicaments ?

Compétence Analyser : Exploiter des informations.

c. Dans le médicament dont il est question au doc. 3, la forme buvable est destinée aux enfants. Quel est son intérêt ?

Compétence Valider : Faire preuve d'esprit critique.

d. Quel est le rôle du lactose dans ces médicaments ? Pourquoi est-il mis en évidence dans leur notice (doc. 1 et 3) ?

Compétence Valider : Faire preuve d'esprit critique.

Doc. 3 – Quelques médicaments antidiarrhéiques

Voici quatre extraits de notices.

L'Imodium, médicament mis au point le premier et protégé par brevet, est appelé médicaments *princeps*. Il existe sous deux formes. Les autres médicaments sont des **génériques** fabriqués à l'expiration du brevet : ils n'ont pas nécessité les mêmes études de développement et sont souvent moins chers.

IMODIUM	Par gélule
Lopéramide chlorhydrate	2 mg
Lactose	+

Excipients : lactose, amidon de maïs, talc, stéarate de magnésium, gélatine, dioxyde de titane, érythrosine, oxyde de fer jaune, bleu patenté V.

LOPÉRAMIDE BIOGARAN	Par gélule
Lopéramide chlorhydrate	2 mg
Lactose	159 mg

Excipients : amidon de riz, gélatine, lactose monohydrate, magnésium stéarate, talc, titane dioxyde.

IMODIUM	Solution buvable
Lopéramide chlorhydrate	0,2 mg par mL

Excipients : glycérol, saccharine sodique, rouge cochenille A (E 124), acide citrique monohydraté, eau purifiée. Conservateurs : parahydroxybenzoates de méthyle (E 218) et de propyle (E 216). Arômes artificiels.

LOPÉRAMIDE ZYDUS	Par gélule
Lopéramide chlorhydrate	2 mg
Lactose	+

Excipients : lactose monohydrate, titane dioxyde.

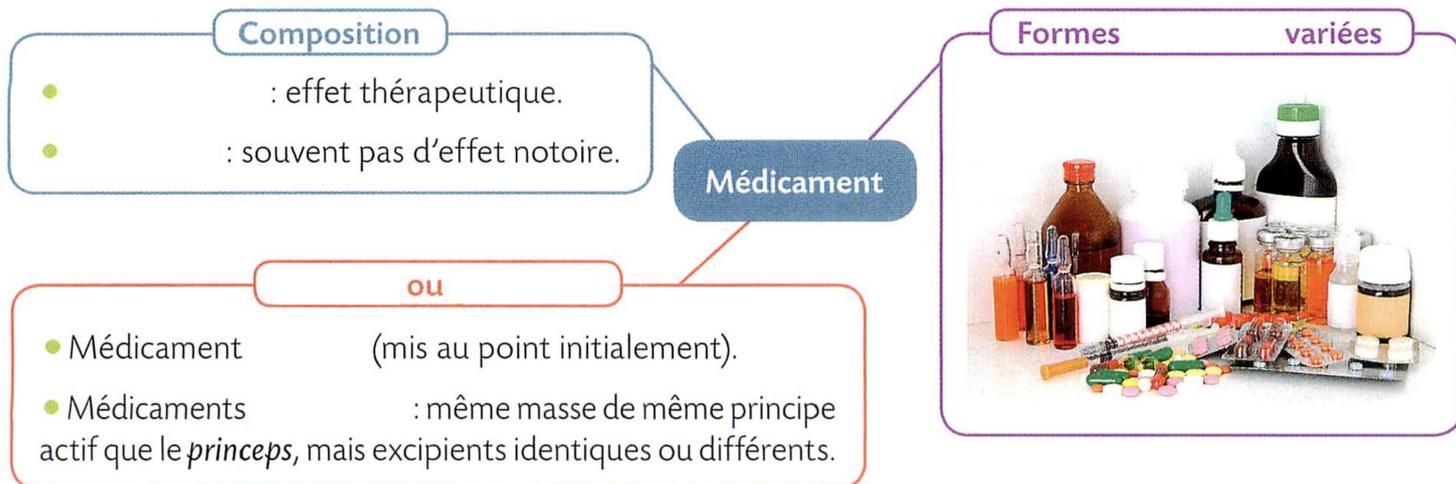
e. Commenter le nom des médicaments génériques.

Compétence Communiquer : Rédiger une réponse.

f. En quoi diffèrent un médicament *princeps* et un médicament *générique*?

Compétence Valider : Faire preuve d'esprit critique.

1.1 Résumé : formulation d'un médicament



2 Intérêt de la chimie de synthèse

Un médicament contient de nombreuses espèces chimiques. Comment sont-elles obtenues ?

Doc. 1 – Naturel ou synthétique ?

- Une espèce chimique qui existe dans la nature est dite naturelle.
- Une espèce chimique fabriquée par l'homme est dite synthétique. Elle est dite artificielle lorsqu'elle n'existe pas dans la nature.

g. Quelles sont les utilisations du menthol (doc. 2) ?

Compétence S'appropriier : Extraire et exploiter des informations.

h. Le menthol est-il une molécule naturelle ou synthétique ? Est-ce une espèce artificielle ? Justifier (doc. 1 et 2).

Compétence S'appropriier : Extraire et exploiter des informations.

i. Pourquoi l'industrie chimique synthétise-t-elle le menthol (doc. 2) ?

Compétence Analyser : Exploiter des informations.

Doc. 2 – Le menthol



Le menthol peut être extrait de la menthe ou obtenu par synthèse à partir du myrcène par exemple. Il est utilisé comme anesthésique local, désinfectant ou décongestionnant des voies respiratoires.

Comme beaucoup d'espèces naturelles employées couramment, la demande en menthol excède considérablement l'approvisionnement à partir des ressources naturelles. Ainsi, 400 tonnes de menthol sont synthétisées chaque année.