

SECONDE / PHYSIQUE-CHIMIE

LA SANTE

Chapitre 2 :

Principe actif, formulation, identification



I. Les médicaments

Définition :

Toute substance ou composition présentée comme possédant des propriétés curatives ou préventives à l'égard des maladies humaines ou animales. (*voir annexe A*)

Composition :

- Principe actif (ou substance active) : substance qui a un effet thérapeutique pour guérir ou prévenir une maladie.

- Excipients (ou substances auxiliaires) : toute autre substance que le principe actif.
Ils peuvent avoir différents rôles :
 - Donner au médicament la forme souhaitée pour la voie d'administration
 - Donner un goût au médicament
 - Régler la vitesse de libération du principe actif dans l'organisme



I. Les médicaments

Formulation :

La formulation est un domaine de la chimie qui consiste à établir les différents composés (et leurs proportions) nécessaires à la fabrication d'un produit.

Médicament « princeps » et générique :

Le médicament princeps est celui créé au départ par un laboratoire pharmaceutique. Quand le brevet de ce médicament est expiré, d'autres entreprises peuvent produire un médicament générique :

Princeps et générique ont le même principe actif

En revanche, leur formulation est différente (excipients, ...)

Un médicament générique coûte généralement moins cher qu'un princeps car les coûts de recherche n'entrent plus en compte (*voir annexe B*)



II. Identification d'espèces chimiques

A/ La Chromatographie sur Couche Mince (CCM)

CCM :

La chromatographie sur couche mince est une technique d'identification d'espèces chimiques. Elle se compose :

- d'une phase stationnaire (généralement un gel de silice sur une plaque en aluminium)
- d'une phase mobile (l'éluant)

L'éluant est un solvant (*voir annexe C*) ou un mélange de solvants qui, par capillarité (*voir annexe C*), va entraîner les différents produits que l'on aura préalablement déposés (par petites gouttes), sur la plaque.

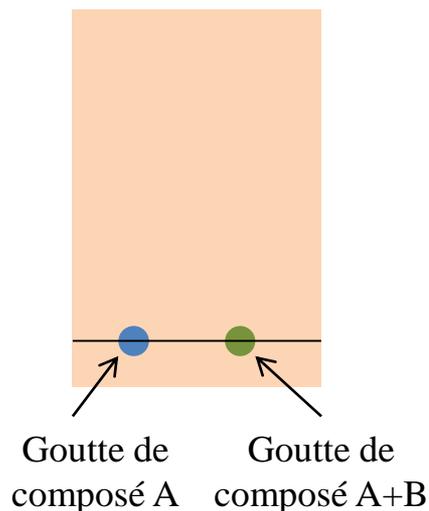
Suivant leurs affinités avec la phase stationnaire et l'éluant, les différents composés vont alors plus ou moins migrer sur notre plaque (suivant leurs vitesses de migration).



II. Identification d'espèces chimiques

A/ La Chromatographie sur Couche Mince (CCM)

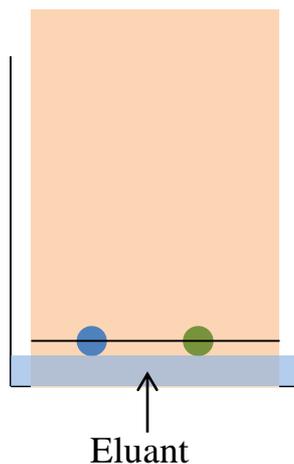
Schéma d'une chromatographie sur couche mince :



Goutte de composé A Goutte de composé A+B

Etape 1 :

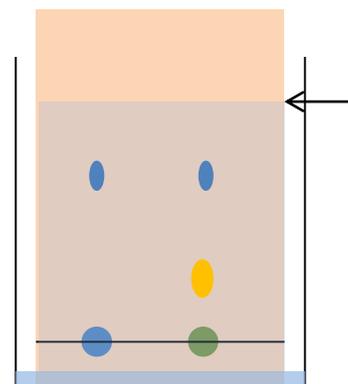
On dépose les gouttes des composés sur une ligne tracée au bas de la plaque.



Eluant

Etape 2 :

On place la plaque dans un fond d'éluant. La ligne de dépôt ne doit pas être dans l'éluant.



Front du solvant

Etape 3 :

Elution. L'éluant migre et entraîne avec lui les différents composés suivant leurs affinités.

Avec des espèces colorées, on observe directement les taches.

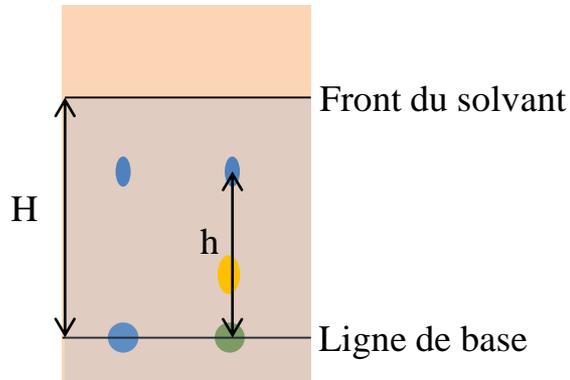
Sinon, il faut les « révéler », par exemple en utilisant une lampe UV.



II. Identification d'espèces chimiques

A/ La Chromatographie sur Couche Mince (CCM)

Exploitation d'une CCM :



Un composé présentera autant de taches que d'espèces chimiques qu'il contient.

Deux corps ayant le même rapport frontal sur la même plaque de chromatographie, sont des espèces chimiques identiques.

Rapport frontal :

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

h et H dans la même unité

R_f sans unité

Un corps pur présentera une seule tache.



II. Identification d'espèces chimiques

B/ Autres techniques

Il faut noter qu'il existe de très nombreuses techniques d'identification d'espèces chimiques.

Les techniques vues dans le chapitre précédent permettent notamment d'identifier dans certains cas des espèces chimiques, ou de confirmer des résultats attendus :

- Densité (masse volumique)
- Températures de changement d'état T_{EB}° , T_F°
- Solubilité

D'autres techniques seront étudiées dans les prochains chapitres.



Principe actif, formulation, identification

Exercices

Exercice 1 :

Répondre par vrai ou faux

- 1/ Un médicament princeps est identique à un médicament générique.
- 2/ Princeps et générique ont toujours les mêmes excipients.
- 3/ Le principe actif d'un médicament est une substance qui a un effet thérapeutique pour guérir ou prévenir une maladie.

1/ Faux, ils ont le même principe actif, les autres composés peuvent différer.
2/ Faux, voir 1/
3/ Vrai!

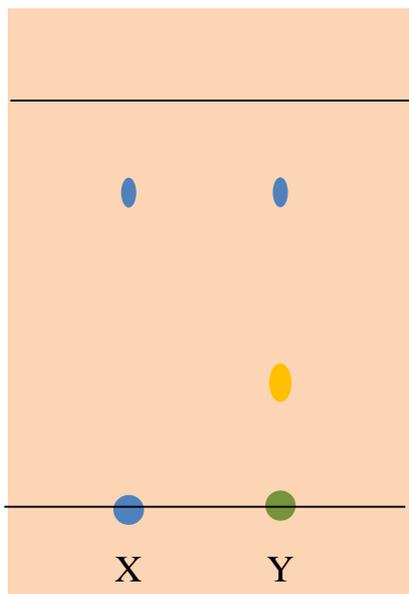
Corrigé



Principe actif, formulation, identification

Exercices

Exercice 2 : On a cherché à synthétiser le composé X. A la fin de la synthèse le composé Y a été obtenu. On a alors réalisé une CCM de X et Y.



Plaque après révélation

Justifier dans tous les cas.

1/ Le composé X était-il pur ?

2/ Le composé Y était-il pur ?

3/ Calculer R_f pour chaque tache.

4/ La synthèse est elle réussie et terminée ?

Note : la plaque est reproduite à taille réelle.



Principe actif, formulation, identification

Exercices

Correction de l'exercice 2 :

1/ Le composé X est pur puisqu'on observe une seule tache.

2/ Le composé Y n'est pas pur car on observe deux taches sur la plaque.

3/ Calcul de R_f :

On mesure la distance entre la ligne de base et le centre de notre tache (notée h), puis on mesure la distance entre la ligne de base et le front du solvant (notée H), et $R_f = h/H$ (Pas de valeur numérique dans ce PowerPoint car les distances dépendent de l'impression)

4/ La synthèse est réussie, en effet on a bien présence de X dans notre composé Y. Toutefois, elle n'est pas terminée, puisqu'il y a présence d'une autre espèce chimique. On devra donc utiliser une technique d'extraction.



Annexes

A/ Les médicaments

Définition complète d'un médicament :

On entend par médicament toute substance ou composition présentée comme possédant des propriétés curatives ou préventives à l'égard des maladies humaines ou animales, ainsi que toute substance ou composition pouvant être utilisée chez l'homme ou chez l'animal ou pouvant leur être administrée, en vue d'établir un diagnostic médical ou de restaurer, corriger ou modifier leurs fonctions physiologiques en exerçant une action pharmacologique, immunologique ou métabolique.

Définition tirée de la LOI n° 2007-248 du 26 février 2007 portant diverses dispositions d'adaptation au droit communautaire dans le domaine du médicament.



Annexes

B/ Médicament princeps et générique

Prix de ces médicaments :

Les médicaments génériques sont globalement moins chers que les médicaments princeps (30% de moins en moyenne). Toutefois, certains laboratoires, lorsque les brevets de leurs médicaments expirent, choisissent de baisser le prix de leurs médicaments princeps, en n'intégrant plus les coûts de recherche. Certains princeps peuvent donc être moins chers que les médicaments génériques.

En France, il est actuellement possible de refuser un médicament générique (au 1^{er} août 2013), toutefois leur remboursement sera différé.



Annexes

C/ Définitions

- Solvant :
Produit chimique pouvant diluer, dissoudre ou extraire d'autres substances sans modification ni pour ces substances, ni pour lui-même.
- Capillarité (dans ce cas) :
C'est le nom donné au phénomène qui permet à certains liquides de remonter le long d'un support malgré la force de gravité qui les attirent vers le bas.