

REPUBLIQUE ALGERIENNE DEMOCRATIQUE ET POPULAIRE

وزارة التعليم العالي و البحث العلمي

MINISTERE DE L'ENSEIGNEMENT SUPERIEUR ET DE LA RECHERCHE SCIENTIFIQUE

Université Mohamed Boudiaf-

M'sila

Faculté des Sciences

Département de Chimie



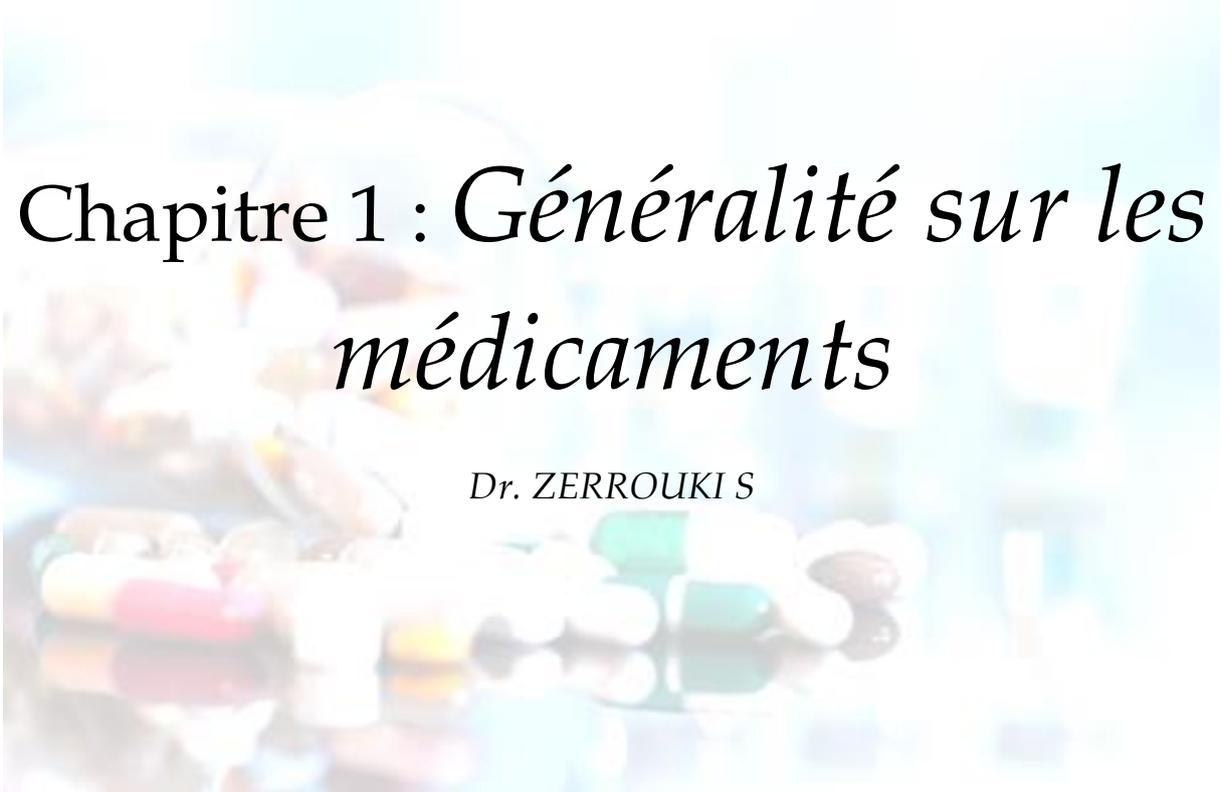
جامعة محمد بوضياف بالمسيلة

كلية العلوم

قسم الكيمياء

# Chapitre 1 : *Généralité sur les médicaments*

Dr. ZERROUKI S



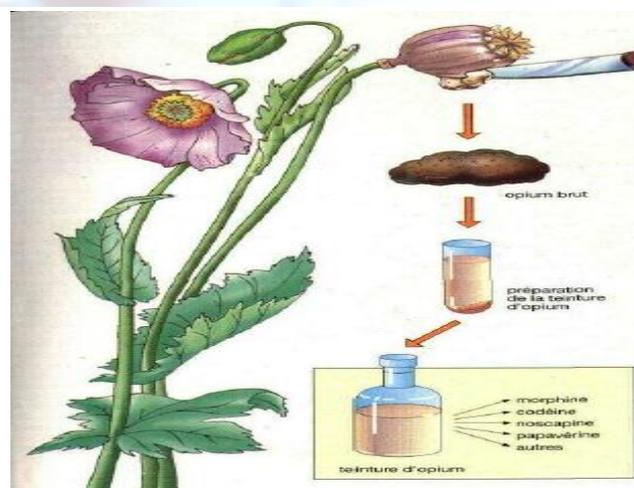
# Chapitre 1 : généralité sur les médicaments

## 1. Introduction

De la mémoire d'homme, on a toujours cherché à soulager les maux de l'homme ou des animaux avec des médicaments. La connaissance des vertus curatives de certaines plantes ou de certains minéraux était déjà inscrite dès l'antiquité dans les traités de botanique. Cette croyance en la vertu bénéfique des plantes ou de certaines substances, transmise exclusivement par tradition, n'avait été soumise à aucun examen critique.

Jusqu'à la fin du siècle dernier, **les médicaments** utilisés pour le traitement des maladies étaient **des produits naturels**, dérivés ou non de **la matière vivante** le plus souvent **des plantes** ou des fragments **de plantes séchées** mais parfois **fraîches**. Celles-ci peuvent renfermer des substances exerçant une action thérapeutique mais aussi des composés toxiques.

Pour pouvoir disposer de **substances médicinales**, dérivées du règne végétal, à longueur d'année et non pas simplement au moment de la récolte, on savait déjà depuis l'antiquité conserver les plantes sous forme séchée ou en les **tremplant** dans **l'alcool ou l'huile végétale**, on obtient une *teinture* : les composants pharmacologiquement actifs sont extraits par l'alcool. Les teintures ne contiennent cependant pas l'ensemble des substances présentes dans la plante ou la drogue mais seulement celles solubles dans l'éthanol. Les composants des produits naturels ont été isolés sous forme chimiquement pure dans les laboratoires pharmaceutiques. Dans le cas de la teinture d'opium, ces substances solubles dans l'alcool sont principalement des **alcaloïdes** : morphine, codéine, noscapine = narcotine, papavérine, narcéine et bien d'autres.



**Figure 1** : du pavot à la morphine

**La purification de ces composants a pour but : L'identification** de la (ou des) molécule(s) active(s), L'analyse des propriétés biologiques (*pharmacodynamiques*) de chacun des composants ; l'analyse de leur devenir dans l'organisme (*pharmacocinétique*), La possibilité, lors de l'utilisation thérapeutique de l'une de ces molécules et La possibilité d'une **synthèse chimique**.

## 2. Qu'est-ce qu'un médicament ?

- on entend par médicament toute **substance ou composé présenté comme possédant des propriétés curatives ou préventives** à l'égard des maladies humaines ou animales, ainsi que tout **produit pouvant être administré à l'hôpital ou à l'animal** en vue d'établir un diagnostic **ou restaurer, corriger ou modifier leurs fonctions organiques**.
- Le Médicament est un **produit complexe** dont la **partie active** ou principe actif ou encore "drogue" sera aménagée à l'aide **d'excipients** ou substances auxiliaires pour lui permettre une efficacité optimale. L'excipient, bien que souvent défini comme inerte, va parfois avoir un rôle prépondérant : c'est tout l'art de la galénique.

Le code de la santé définit les spécialités pharmaceutiques comme « **tout médicament préparé à l'avance, présenté sous un conditionnement particulier et caractérisé par une dénomination spéciale**. Aucune spécialité ne peut être débitée à titre gracieux ou onéreux si elle n'a pas reçu auparavant une **Autorisation de Mise sur le Marché** délivrée par le Ministère de la Santé.

## 3. Développement d'un médicament

**Le développement débute par la synthèse** de nouvelles structures chimiques. Les substances aux structures plus complexes peuvent être **extraites de plantes** (glycosides cardiaques), de **tissus animaux** (héparine), de **cultures de microorganismes** (pénicilline) ou de **cellules humaines** (urokinase) ou encore obtenues par recombinaison génétique (insuline humaine). Par ailleurs, il est d'autant plus facile de trouver une molécule nouvelle que l'on connaît la relation entre structure et activité.

- a- L'investigation préclinique** fournit des informations sur les propriétés des nouvelles substances. Le premier tri peut être effectué à l'aide *d'études pharmacologiques et biochimiques* ou encore d'expériences réalisées sur des **cellules en culture**, des tissus ou des organes isolés. Comme ces modèles ne peuvent jamais reproduire les événements complexes qui se déroulent dans un organisme vivant, les médicaments potentiels devront être **testés chez l'animal**. L'étude chez l'animal indique d'abord si l'effet recherché a bien lieu et s'il existe des effets toxiques. Les *études de toxicité* permettent de mettre en évidence la toxicité aiguë ou à long terme, les effets mutagènes, cancérogènes

et les éventuelles anomalies du développement (effet tératogène). Il faut aussi tester chez l'animal les voies d'administration, la distribution et l'élimination des diverses molécules (*pharmacocinétique*).

**b- L'étude clinique** débute par :

- ✓ **Phase 1** où l'on détermine chez des **volontaires sains** si les propriétés observées chez l'animal se manifestent également chez l'homme, et où l'on établit la relation entre **l'effet et les doses**.
- ✓ **Phase 2** le médicament éventuel est, pour la première fois, **testé** contre la **maladie** pour laquelle il est prévu chez un groupe de **patients sélectionnés**. Si la substance montre une efficacité réelle et peu d'effets secondaires
- ✓ **phase 3** l'action thérapeutique de la nouvelle substance est comparée chez un groupe de **patients plus important**, à celle du médicament de référence.

La **décision de mise sur le marché** est prise après **une demande officielle** du laboratoire, par un organisme public (en Allemagne, la commission pour la santé). Le demandeur doit justifier, à l'aide de ses résultats expérimentaux, que les **critères d'efficacité et d'innocuité** sont remplis et que les formes galéniques répondent aux normes de qualité.

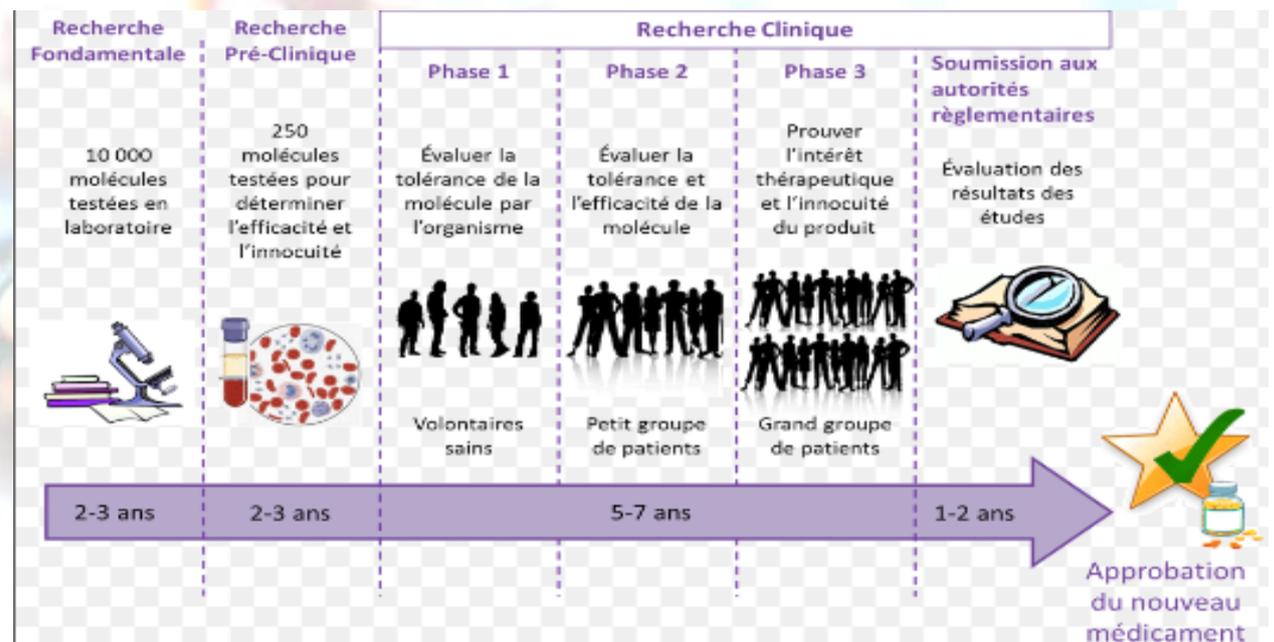


Figure2 : développement de médicament

#### 4. Dénomination des médicaments

Chaque médicament fait l'objet d'une dénomination ; On peut distinguer :

- ✓ **Dénomination scientifique** : Elle correspond à la nomenclature chimique (nom chimique) du composé. Elle est élaborée en tenant compte des règles

de nomenclature très strictes édictées par l'IUPAC (International Union of Pure and Applied Chemistry). Elle présente l'avantage d'être univoque, mais à l'inconvénient d'être compliquée, longue à écrire et à lire et difficile à retenir

Exemple: Acide Acétyl Salicylique, Sodium 3,3- diméthyle 7- oxo 6 - phényl acétamido 4 - thia-azabicyclo 3,2 heptane 2 carbocyclate.

- ✓ **Dénomination Commune Internationale (DCI) :** Elle correspond au nom attribué à la molécule mère, nom simple, pratique à l'emploi et utilisable partout dans le monde, il est proposée par l'OMS (Organisation Mondiale de la Santé). Exemple:
  - L'ASPIRINE est la DCI de l'Acide Acétyl Salicylique.
  - La PENICILLINE est la DCI de Sodium 3,3- diméthyle 7- oxo 6 - phényl acétamido 4 - thia-azabicyclo 3,2 heptane 2 carbocyclate
- ✓ **Dénomination spéciale :** Elle est choisie et enregistrée par le fabricant pour commercialiser son médicament, c'est le nom marque ou le Nom déposé (ND).

Exemple:

- ASPEGIQUE®, ASPIRINE 500®, CATALGINE® : Ce sont des noms déposés de l'ASPIRINE.
- AMOXIL, CLAMOXYL, EXTENCILLINE, ORACILLINE : ce sont des exemples des ND de la PENICILLINE

**Remarque :** La dénomination spéciale comprend deux appellations:

- **Princeps :** c'est le nom commercial du médicament donné par le laboratoire qui l'a conçu et fabriqué (Princeps : de primus (premier) et capio (prendre), étymologiquement : celui qui est le premier à prendre l'initiative.
- **Générique :** c'est le nom commercial donné aux différentes copies d'un médicament original fabriquées dans d'autres laboratoires que le laboratoire d'origine, après la période d'exclusivité (expiration du brevet du premier laboratoire).

**5. Composition des médicaments :** Le médicament peut être simple (constitué d'un seul élément) ou composé (constitué de plusieurs éléments).

- **Principe actif (PA) :** Le PA est la molécule mère (ou la base) du médicament destinée à l'action pharmacologique souhaitée. C'est la partie du médicament qui lui confère ses propriétés curatives ou préventives. La substance active est le seul principal composant fondamental (obligatoire)

- **Adjuvant** (Ajouter) ou Auxiliaire (Accompagner) : C'est la molécule qui ajoute son action au principe actif pour contribuer à un meilleur effet pharmacologique, cette molécule doit être précisée en parallèle avec le PA. Exemple: Anesthésique local + Vasoconstricteur.
- **Excipient** ou véhicule Excipient : en latin Excipio = Recevoir (qui reçoit la molécule) Véhicule : qui achemine la molécule jusqu'à son point d'absorption Un excipient est une substance (en quantité suffisante) sans action pharmacologique dans le but de donner à la molécule une forme galénique (médicamenteuse) appropriée et doit fournir avec elle un mélange parfaitement homogène.

**Remarque : le Placebo** C'est une appellation donnée à toute préparation dépourvue de PA (principe actif). Le placebo ne contient que l'excipient et possède la même forme que le médicament, il est utilisé surtout pour son action psychologique, on parle « d'effet placebo ». Il ne possède aucun effet pharmacologique réel. Lors des essais cliniques, pour le développement du futur médicament, le placebo est utilisé comme « Témoin », pour vérifier que l'excipient n'a pas d'influence sur les résultats de l'expérimentation.

## 6. Catégories des médicaments

Le mode de classement des médicaments est fort nombreux. Ils peuvent être rangés, selon les modalités de leur préparation, on distingue :

- 6.1. **Les médicaments à préparation extemporanée** : Ils sont préparés à la demande, sur présentation d'une ordonnance, ou au moment, de leur emploi par le praticien. On distingue deux catégories principales :
  - ✓ **Les médicaments officinaux** : Ils ont leur composition parfaitement codifiée dans un ouvrage officiel, le Formulaire National ou "codex", complément de la Pharmacopée Française, celle-ci ne décrivant que les matières premières.
  - ✓ **Les médicaments magistraux** : Dont la composition est choisie par le vétérinaire. Leur formulation répond au souci de mieux adapter la thérapeutique à l'animal malade qui bénéficie d'un médicament « sur mesure ».
- 6.2. **Les médicaments préparés à l'avance**

## 7. Quelques définitions

**Pharmacie galénique** (la Galénique) C'est la science qui s'occupe de la préparation, de la présentation et de la conservation des produits pharmaceutiques, sous formes de médicaments, vendus en officine prêts à l'utilisation et tenus par une réglementation.

**Pharmacocinétique** elle étudie les différentes phases de devenir de la molécule (médicament) dans l'organisme: absorption, distribution, biotransformation et élimination.

**Pharmacodynamique** Elle traite des mécanismes d'action des médicaments et leurs effets biochimiques et physiologiques sur l'organisme vivant.

**Pharmacologie clinique** Elle traite des effets observés directement sur l'état général de l'organisme humain et animal.

**Pharmacovigilance** La pharmacovigilance désigne l'ensemble des techniques d'identification, d'évaluation et de prévention du risque des effets indésirables du médicament mis sur le marché.

