



# Theme SANTE Chimie

Activité1 :

## L'ASPIRINE



### A HISTOIRE DE L'ASPIRINE

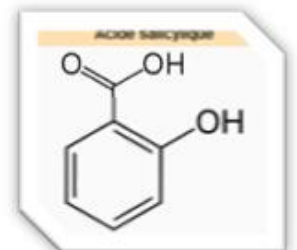
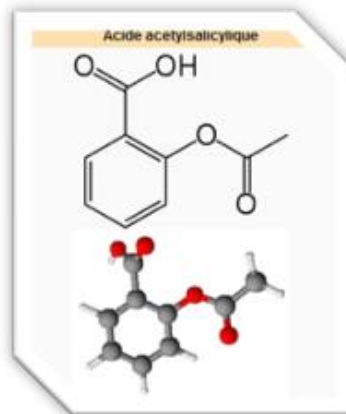
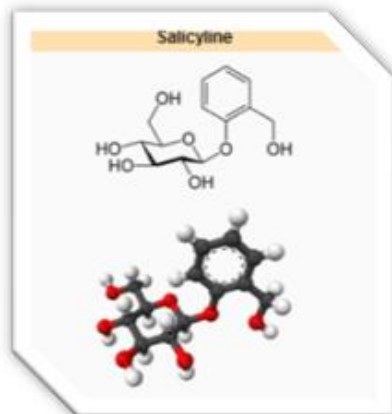
L'écorce de saule est connue depuis l'Antiquité pour ses vertus curatives. On a retrouvé la trace de décoction de feuilles de saule dans un papyrus égyptien datant de 1550 av. J.-C. Hippocrate (460–377 av. J.-C.), médecin grec, conseillait déjà une préparation à partir de l'écorce du saule blanc pour soulager les douleurs et les fièvres. Les Romains connaissaient aussi ses propriétés, le nom latin du saule est salix. L'utilisation empirique des feuilles et de l'écorce de saule pour soigner fièvres et douleurs se poursuit jusqu'au XIXe siècle.

En 1763, Edward Stone présente un mémoire devant la Royal Medicine Society sur l'utilisation thérapeutique de l'écorce du saule blanc contre la fièvre. En 1829, Pierre-Joseph Leroux, un pharmacien français, après avoir fait bouillir de la poudre d'écorce de saule blanc dans de l'eau, tente de concentrer sa préparation ; il en résulte des cristaux solubles qu'il baptise salicyline (de salix).

En 1835, Karl Löwig montre que l'acide spirique, extrait de la reine-des-prés, est chimiquement identique à l'acide salicylique, synthétisé en laboratoire. On utilise cette préparation pour faire tomber la fièvre, soulager les douleurs et les rhumatismes articulaires, mais elle provoque des brûlures d'estomac.

Le 1er février 1899, la compagnie Bayer lança sur le marché un nouveau produit, l'acide acétylsalicylique, appelé Aspirin, qui possédait des propriétés comparable à l'acide salicylique sans présenter la même agressivité à l'égard des muqueuses stomacales. L'acide acétylsalicylique est obtenu en laboratoire par acétylation de l'acide salicylique.

Finalement, le brevet et la marque de l'aspirine sont déposés par la société Bayer en 1899, sous la dénomination « Aspirin ». La préparation arrive en France en 1908 et est commercialisée par la Société chimique des usines du Rhône. Cependant, après la Première Guerre mondiale, le Traité de Versailles stipule que la marque et le procédé de fabrication tombent dans le domaine public. L'aspirine demeure aujourd'hui encore l'un des médicaments le plus consommé au monde, environ 40 000 tonnes par an dont 2000 tonnes en France !



#### Analyse du texte

##### 1- Ecorce de saule

- Dans quel but thérapeutique utilisait-on, depuis au moins 3000 ans des préparations à base d'écorces ou de feuille de saule ?
- Ces préparations étaient souvent des décoctions. Que veut dire ce mot ? A quoi sert chimiquement ce genre de préparation ?
- Quelle est le « principe actif » de cette préparation ?

##### 2- Acide salicylique

- Cette substance est-elle une substance présente dans la nature ou fabriquée par synthèse ?
- Quelles sont les propriétés thérapeutiques et les inconvénients de cette substance ?

##### 3- Aspirine

- Quelle est le « principe actif » de l'aspirine ?
- Cette substance est-elle une substance que l'on trouve dans la nature ?
- Quel est l'intérêt thérapeutique de cette substance par rapport aux deux précédentes ?
- Pourrait-on continuer d'utiliser l'écorce de saule si on produisait l'aspirine à partir de substances naturelle comme l'écorce de saule ?
- Sachant que dans le nom A/spir/in la terminaison in n'a pas de signification particulière, proposer une justification du nom donné à ce médicament

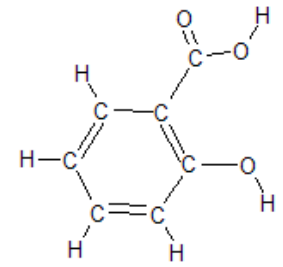
**PRINCIPE ACTIF :** MOLECULE ENTRANT DANS LA COMPOSITION D'UN MEDICAMENT ET LUI CONFERANT SES PROPRIETES THERAPEUTIQUES. UN MEDICAMENT CONTIENT UN OU PLUSIEURS PRINCIPES ACTIFS INCORPORES DANS UN EXCIPIENT.

## B La molécule d'aspirine

### 1- Formules de molécules

La **formule topologique** est une représentation moléculaire utilisée en chimie organique. Dans un souci de simplification, les chimistes ont pris l'habitude de représenter de cette façon les molécules. Les atomes de carbone et d'hydrogène ne sont pas représentés sauf s'il sont sur une fonction chimique.

- La **formule développée** complète ci-contre montre tous les atomes d'une molécule. Identifier cette molécule parmi les 3 formules topologiques de la page précédente.
- Combien de liaisons un atome de carbone engage-t-il toujours avec les atomes voisins ? même question pour l'hydrogène et l'oxygène.
- Trouver la **formule brute** de cette molécule ( sous la forme  $C_xH_yO_z$ )
- Ecrire la formule développée de l'aspirine ainsi que sa formule brute.



### 2- Fonctions chimiques

- L'acide salicylique et l'aspirine possèdent toutes les deux une « **fonction acide** », Identifier cette fonction chimique sur les deux molécules.
- L'acide acétique présent dans le vinaigre est aussi un acide. Sachant qu'il possède seulement 2 carbones, trouver sa formule développée, topologique et brute.
- La molécule d'aspirine possède aussi **une fonction ESTER** non présente dans l'acide salicylique. Identifier cette fonction chimique. Où retrouve-t-on l'indication de cette fonction chimique dans le nom de l'aspirine : acide acétyl salicylique.
- Sachant que dans le nom A/spir/in la terminaison in n'a pas de signification particulière, proposer une justification du nom donné à ce médicament

## C La formulation de l'aspirine

Voici 4 formulations différentes de l'aspirine vendue en pharmacie.

- Un comprimé d'aspirine contient-il uniquement de l'acide acétylsalicylique ? Que contiennent-ils d'autre ?
- A quoi servent donc les excipients ? Pourquoi sont-ils différents dans chaque cas ?
- Quelles sont les propriétés thérapeutiques indiquées ?
- Que signifie aspirine 500 et aspegic 1000 ?
- Quelle est la quantité d'aspirine dans chacun des 4 comprimés ?

### quelques étiquettes.

#### 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 UPSA

tamponnée effervescente VITAMINEE C

##### Composition

Acide acétylsalicylique : 0,330 g  
Acide ascorbique : 0,200 g  
Excipient : glycine, acide citrique, bicarbonate de sodium, benzoate de sodium. q.s.p. un comprimé effervescent sécable de 3,501 g  
Antalgique, antipyrétique, anti-inflammatoire à dose élevée, antiagrégant plaquettaire.

##### Mode d'administration

Boire immédiatement après dissolution complète du comprimé effervescent dans un verre d'eau sucrée ou non, lait, ou jus de fruit.

**Précautions d'emploi** : celles de l'aspirine.

#### ASPIRINE pH8<sup>TM</sup>

##### 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.  
Analgesique, 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).

**Précautions d'emploi** : celles de l'aspirine.

#### ASPEGIC 1000 mg

##### Composition

Acétylsalicylate de DL lysine : 1800 mg (quantité correspondante en acide acétylsalicylique: 1000 mg)  
Excipient : glycine, arôme mandarine, glycyrrhizinate d'ammonium pour un sachet.  
Antalgique, antipyrétique, anti-inflammatoire à dose élevée, antiagrégant plaquettaire.

##### Mode d'administration

Boire immédiatement après dissolution complète dans un grand verre d'eau, lait, soda ou jus de fruit.

**Précautions d'emploi** : celles de l'aspirine.