

Objectifs :

- Analyser la formulation d'un médicament à partir de la lecture de son étiquette.
- Pratiquer une démarche expérimentale pour montrer qu'une espèce active interagit avec le milieu dans lequel elle se trouve (nature du solvant, pH).

Document 1 : 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

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™

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.

Analgésique, 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.

DOLIPRANE 500 mg

Composition

Paracétamol : 500 mg

Excipient : lactose, amidon pré-gélatinisé, amidon de blé, talc, carboxyméthylamidon, stéarate de magnésium pour un comprimé.

Antalgique, antipyrétique.

Mode d'administration

Les comprimés sont à avaler tels quels avec une boisson (eau, lait ou jus de fruit).

Contre indications : allergie au paracétamol maladie grave du foie,

DAFALGAN 500 mg

Composition

Paracétamol : 500 mg

Excipient : stéarate de magnésium, gélatine, azorubine (E122), dioxyde de titane (E171), q.s.p. une gélule.

Antalgique, antipyrétique.

Mode d'administration

Gélules à avaler sans les ouvrir avec une boisson (eau, lait ou jus de fruit).

Contre indications : allergie au paracétamol, maladie grave du foie.

1. Etude documentaire.

- 1) Identifier les substances actives sur les étiquettes de médicaments proposées
- 2) a) Quel est le rôle d'un excipient.
b) Identifier 3 types d'excipients différents sur les étiquettes de médicaments proposées
- 3) Quels sont les dangers liés à l'absorption d'aspirine à forte dose ?
- 4) a) Donnez la définition d'un médicament générique
b) Quand les médicaments génériques sont ils produits ?
c) Donnez la définition d'un médicament princeps
d) Que doit on faire pour mettre un médicament générique sur le marché ?
e) Combien de types de génériques existe-t-il ? Donnez leur nom ?
f) A votre avis un médicament générique est il exactement pareil qu'un médicament générique ?

Rq : Aidez vous du COURS S09- Formulation d'un médicament

2. Mise en évidence d'un excipient.

Expérience :

- Broyer soigneusement 1/2 comprimé d'**Aspirine du Rhône 500** dans un mortier.
- Mettre soigneusement la poudre dans un bécher.
- Rincer le mortier avec environ 10 mL d'éthanol (**prélevée avec une éprouvette graduée**) et rajouter tout dans le bécher
- Mélanger l'ensemble à l'aide d'un agitateur en verre
- Filtrer à l'aide du support dans un autre bécher.
- Rincer le bécher à l'éthanol au dessus du filtre.

Attendre la fin de la filtration puis :

- Verser quelques gouttes d'eau iodée sur le solide recueilli dans le filtre (Rajouter directement quelques gouttes sur le papier filtre)
- Verser quelques gouttes d'eau iodée dans le filtrat.

Rq : L'eau iodée devient noire en présence d'amidon

- 1) Quelle est la substance identifiée dans l'excipient ?
- 2) Pourquoi a-t-on dissous le cachet d'aspirine dans l'alcool et pas dans l'eau ?

3. Quelle est la solubilité de l'aspirine dans l'organisme ?

Expérience :

- Préparer trois petits bécher (étiquetés A, B, C) contenant respectivement :
25 mL de solution d'acide chlorhydrique ($\text{H}_3\text{O}^+_{(\text{aq})} + \text{Cl}^-_{(\text{aq})}$) à $0,1 \text{ mol.L}^{-1}$, (**prélevée avec une éprouvette graduée**)
25 mL de solution d'hydroxyde de sodium ($\text{Na}^+_{(\text{aq})} + \text{HO}^-_{(\text{aq})}$) à $0,1 \text{ mol.L}^{-1}$, (**prélevée avec une éprouvette graduée**)
et 25 mL d'eau distillée (**prélevée avec une éprouvette graduée**)

- 1) Mesurer le pH de la solution du bécher (A), du bécher (B) et du bécher (C) et noter la valeur sur votre rapport

RQ : Pensez à bien rincer et sécher la sonde pH-métrique

Expérience :

- Dans le bécher A, verser la poudre correspondant à 1/3 de comprimé d'**Aspirine du Rhône 500** qui a été soigneusement broyé dans un mortier.

→ Agiter la solution du bécher A à l'aide d'un agitateur magnétique.

→ Refaites la manipulation avec les béchers B et C

Rq : Pensez à bien rincer le barreau aimanté

2) La dissolution de l'aspirine dépend-elle du pH du milieu ?

3) Dans quel milieu (acide, basique ou neutre) est elle le plus soluble ?

4) a) Quel est le pH de l'estomac ?

b) L'aspirine se dissout elle bien dans l'estomac ?

c) Justifier le mode d'administration et les contre-indications de l'Aspirine du Rhône.

Rem : Aidez vous des étiquettes et des documents 2 et 3.

4. Pourquoi d'autres formulations de l'aspirine ? L'aspirine dite "soluble".

Expérience :

→ Mettre 1/2 comprimé d'**Aspirine UPSA tamponnée** effervescente dans un bécher contenant 25 mL d'eau distillée.

→ Agiter la solution à l'aide d'un agitateur magnétique.

a) Mesurer le pH de la solution obtenue et noter la valeur sur votre rapport

→ Ajouter 25 mL d'eau distillée. (**Prélevée avec une éprouvette graduée**)

→ Agiter la solution à l'aide d'un agitateur magnétique.

b) Mesurer à nouveau le pH de la solution et noter la valeur sur votre rapport

c) L'ajout d'un volume important d'eau distillée a-t-elle fait varier de façon sensible le pH ?

d) Quelle définition pouvez vous donner de « **tamponnée** » ?

e) Quelle est l'espèce chimique responsable de l'effervescence observée ?

f) Quelle est la nature des bulles ?

Rq : Aidez vous du document 2

g) Dans certains cas, on prescrit le paracétamol à la place de l'aspirine. Quels sont les avantages et les inconvénients liés à l'absorption de paracétamol à la place de l'aspirine ?

Rq : Aidez vous des étiquettes