

CHAPITRE 14

THÈME 3 : FAIRE DES CHOIX AUTONOMES ET
RESPONSABLES

De la molécule au médicament

1 La chimie du médicament

1.1 Définition

On nomme médicament toute substance aux propriétés préventives ou curatives de maladies humaines ou animales, mais aussi tout produit servant à établir un diagnostic ou à restaurer, corriger ou modifier les fonctions organiques.

Son but est d'éliminer les agents pathogènes ou de rétablir les systèmes biologiques perturbés.

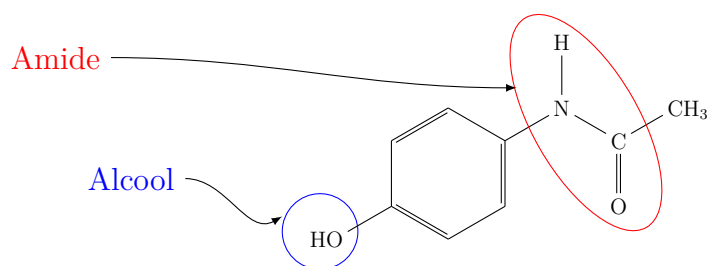
1.2 Composition des médicaments

Un médicament comporte :

- un ou plusieurs principes actifs : il s'agit de molécules possédant des fonctions caractéristiques (acide carboxylique, amine, amide ...) lui conférant un effet thérapeutique.
- des excipients : Ils servent d'enrobage (comprimé, sirop, pommade ...) et rendent les médicaments plus acceptables (goût, odeur, ...)

Exemple : Le doliprane

- principe actif : paracétamol (Cette molécule possède une fonction alcool et une fonction amide)



- excipients : povidone, amidon prégélatinisé, sodium carboxyméthylamidon, talc, magnésium stéarate

1.3 L'origine des médicaments

Les substances actives sont le plus souvent des petites structures chimiques. Depuis l'Antiquité, les hommes les trouvent dans la nature, extraites du monde végétal (quinquina, coca ...), du monde animal (venin des serpents ...) ou de micro-organismes. Au XIXe siècle, la chimie les a isolées et synthétisées (la morphine de l'opium, l'acide salicylique de l'écorce de saule, par exemple). Au XXe siècle, les chimistes ont créé des banques de produits chimiques qu'ils ont testés sur des cibles biologiques et ont pu en découvrir de nouveaux.

Ainsi, certains médicaments ont une origine naturelle (aspirine) et d'autres ont une origine artificielle (paracétamol)

Exemple : La salicyline et la molécule d'aspirine

La salicyline est un anti-inflammatoire produit dans l'écorce de saule blanc. Une fois consommé, cette molécule, dérivée du D-glucose, est transformée dans le corps en acide salicylique. L'acide salicylique a une structure chimique très proche de l'aspirine (acide acétylsalicylique) et en a les mêmes effets sur l'organisme.

Néanmoins, l'acide salicylique a des effets secondaires indésirables (allergies, ulcère de l'estomac ...) contrairement à l'aspirine qui conservait les mêmes propriétés thérapeutiques que l'acide salicylique sans les effets secondaires.

Ainsi, la molécule d'acide salicylique, dont l'origine est naturelle, a permis de synthétiser la molécule d'acide acétylsalicylique dont l'origine est artificielle.

2 Les nouveaux médicaments

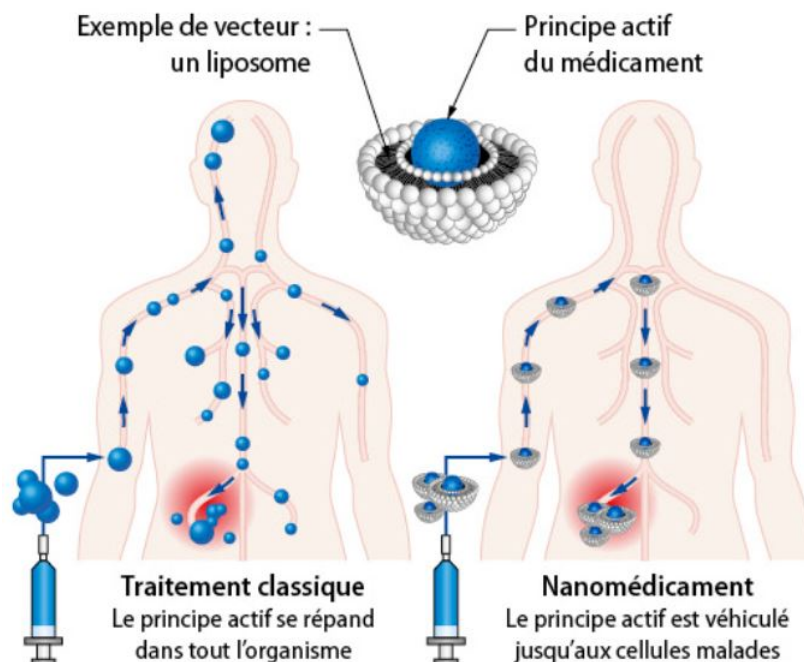
2.1 Les nanomédicaments

Un nanomédicament est composé deux éléments :

- un principe actif (molécule qui va guérir la zone malade)
- un vecteur ("véhicule") de taille nanométrique (milliardième de mètre).

Le vecteur du nanomédicament est capable de transporter la molécule jusqu'à la zone infectée : un gène, une protéine, une cellule, un organe... Ils permettent de traiter directement les cellules infectées sans irradier et endommager les cellules saines autour. En effet, aujourd'hui seule une petite partie des médicaments atteint la zone malade, le reste se perd dans l'organisme. Ils permettent ainsi d'augmenter l'activité thérapeutique et de réduire la toxicité de nombreux médicaments, annulant certains effets secondaires désagréables.

Exemple : Les avantages des nanomédicaments



Les nanomédicaments sont actuellement développés pour soigner les maladies sévères comme le cancer mais la recherche veut aussi s'étendre vers d'autres maladies comme le choléra, le diabète, Alzheimer, la sclérose en plaques ...

2.2 Les médicaments hybrides

Un médicament hybride possède plusieurs groupes caractéristiques, présentant chacun un effet thérapeutique, on les appelle des pharmacophores. Ces médicaments peuvent être produits par l'association de deux principes actifs ou à partir d'une seule molécule dite hybride car elle possède deux pharmacophores.

Les médicaments hybrides présentent des propriétés intéressantes par rapport aux médicaments classiques car ils possèdent plusieurs pharmacophores, ce qui les rend d'autant plus efficaces.

Les médicaments hybrides sont utilisés pour les traitement des cancers avec la polychimiothérapie ou encore la trithérapie anti-VIH.

Un médicament hybride contient le même principe actif que son médicament de référence.

Il ne peut pas être considéré comme un médicament générique car il n'est pas strictement identique au médicament de référence soit dans son indication thérapeutique, soit dans son dosage, soit dans sa forme pharmaceutique (comprimé, gélule, sirop, collyre, crème,...) ou par sa voie d'administration.

Exemple : Médicament hybride

	RILUTEK®	RILUZOLE BIOGARAN®	TEGLUTIK®
Type de médicament	Spécialité de référence	Générique	Hybride
Principe actif	Riluzole	Riluzole	Riluzole
Indication thérapeutique	Sclérose latérale amyotrophique (SLA)	Sclérose latérale amyotrophique (SLA)	Sclérose latérale amyotrophique (SLA)
Forme pharmaceutique	Comprimé pelliculé	Comprimé pelliculé	Suspension buvable
Dosage	50 mg	50 mg	50 mg/10 mL
Voie d'administration	PO	PO	PO
Biodisponibilité	AUC de référence	AUC _{0-∞} compris dans IC _{90%} [80 % ; 125 %]	AUC _{0-∞} = 106,5 % IC _{90%} [96,7 % ; 117,2 %]
	C _{max} de référence	C _{max} compris dans IC _{90%} [80 % ; 125 %]	C _{max} = 122,3 % IC _{90%} [103,3 % ; 144,9 %]

PO : Per Os ; AUC : Area Under the Curve = aire sous la courbe ; IC : Intervalle de Confiance ; C_{max} : pic de concentration plasmatique