

FORMULATIONS DE L'ASPIRINE



Pourquoi existe-t-il autant de formes différentes de l'aspirine ?



Document 1

Les médicaments se composent de deux catégories d'espèces chimiques :

- le principe actif, espèce chimique ayant des vertus thérapeutiques
- les excipients, espèces chimiques incorporées au principe actif pour en faciliter l'absorption par l'organisme ou pour une conservation plus durable du médicament

En pharmacie, la composition d'un médicament (principe actif + excipient) s'appelle « formulation ».

Depuis sa première commercialisation en 1899 par la société Allemande BAYER, l'aspirine a connu de nombreuses modifications dans sa formulation de manière à améliorer son action sur l'organisme et à limiter ses effets secondaires. Exemples : aspirine effervescente, aspirine à effet retard . . .

1^{ère} partie : Quelle est la constitution d'un comprimé d'aspirine ?

App

Q1. En vous aidant des documents 1 et 2, indiquer quelle est l'espèce chimique commune à toutes les formes de l'aspirine ? Quelle sont ses vertus thérapeutiques ?

Q2. Qu'est-ce qui différencie les différentes formes de l'aspirine ?

Q3. En vous aidant du document 3, donner plusieurs propriétés physico-chimiques de l'acide acétylsalicylique.

2^{ème} partie : Quel est le rôle de l'excipient dans la formulation de l'aspirine ?

Q4. En vous aidant du document 4, expliquer pourquoi l'aspirine peut avoir des effets secondaires ?

Expérience : Réa

Dans un tube à essais, dissoudre un morceau d'aspirine UPSA effervescente dans de l'eau puis faire de même avec l'aspirine du Rhône. Ajouter quelques gouttes d'acide chlorhydrique de manière à se rapprocher des conditions d'acidité de l'estomac.

Q5. En raisonnant à partir de vos observations, expliquer pourquoi l'une des deux formulations a une action plus rapide et une meilleure tolérance au niveau de l'estomac (vous pourrez vous aider des documents 2 et 4).

Rai

Q6. L'aspirine pH8 est dite à « effet retard ». Qu'entend-t-on par « effet retard » (voir document 2) ?

Q7. Quelle est la spécificité des comprimés dans la formulation « pH8 » ? Pour quelle raison doit-on avaler le comprimé sans le croquer ?

Q8. Imaginer une expérience permettant d'illustrer l'effet retard de la formulation « pH8 ». **Rai**
Réaliser votre expérience après accord du professeur puis faire un compte-rendu détaillé (schémas+ observations). **Com**

Aide : Le pH de l'estomac est d'environ 1, celui de la paroi intestinale d'environ 8.

3ème partie : Comment l'aspirine interagit avec le milieu dans lequel elle se trouve ?

App

L'Aspégic est une formulation de l'aspirine encore différente. Conditionné sous forme de poudre, il contient de l'ion acétylsalicylate qui se transforme en acide acétylsalicylique une fois arrivé dans l'estomac. En vous aidant du document 3, répondre aux questions suivantes :



Q9. Quel intérêt présente une telle formulation ?

Q10. Pourquoi l'ion acétylsalicylate se transforme-t-il en acide acétylsalicylique une fois arrivé dans l'estomac ?

Q11. Que se passe-t-il si de l'acide acétylsalicylique arrive dans l'intestin ?



Avant de quitter la salle :

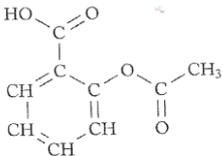
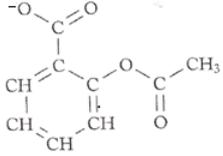
Nettoyez la verrerie et la paille de manière à la laisser telle que vous l'avez trouvée.

Att

Document 2 : Notices de trois formulations différentes de l'aspirine

<u>ASPIRINE DU RHONE 500</u>	<u>ASPIRINE pH8</u>	<u>ASPIRINE UPSA 500mg effervescente</u>
<p>Propriétés thérapeutiques Analgésique, antipyrétique, anti-inflammatoire</p> <p>Composition Acide acétylsalicylique 500 mg Excipients : amidon, gel de silice.</p> <p>Mode d'administration Doit être utilisé de préférence avant ou au cours d'un repas. Absorber les comprimés après les avoir fait désagréger dans un verre d'eau.</p> <p>Caractéristiques de la formulation : Déconseillée en cas d'ulcère à l'estomac.</p>	<p>Propriétés thérapeutiques Analgésique, antipyrétique, anti-inflammatoire</p> <p>Composition Acide acétylsalicylique 500 mg Excipients : amidon, acétophtalate de cellulose, phtalate d'éthyle.</p> <p>Mode d'administration Les comprimés sont à avaler sans croquer avec une boisson (eau, lait ou jus de fruit).</p> <p>Caractéristiques de la formulation : Les comprimés sont enrobés dans une pellicule et l'aspirine est absorbée au niveau de l'intestin.</p>	<p>Propriétés thérapeutiques Analgésique, antipyrétique, anti-inflammatoire</p> <p>Composition Acide acétylsalicylique 500 mg Excipients : Bicarbonate de sodium, acide citrique, lactose, aspartam.</p> <p>Mode d'administration Boire immédiatement après dissolution complète du comprimé effervescent dans un verre d'eau.</p> <p>Caractéristiques de la formulation : Action rapide et meilleure tolérance au niveau de l'estomac.</p>

Document 3 : Propriétés physicochimiques

	Acide acétylsalicylique	Ion acétylsalicylate
Formule		
Apparence physique	Cristaux blancs	
Température de fusion	135°C	
Domaine d'existence	pH < 3,5	pH > 3,5
Solubilité dans l'eau	Faible	Elevée
Solubilité dans les graisses	Elevée	Faible

Document 4 : Effets indésirables de l'aspirine

Pour pouvoir agir sur l'organisme, l'aspirine doit se trouver dans le sang. Pour cela, elle doit traverser les parois de l'estomac. Mais cette traversée n'est pas toujours sans danger : lorsqu'elle se dissout dans les graisses présentes dans la muqueuse de l'estomac, l'aspirine peut rester bloquée dans la paroi stomacale si elle n'est pas sous une forme suffisamment fine¹. Elle exerce alors une action corrosive² sur la muqueuse.

(1) de toutes petites particules d'aspirine permettent un meilleur transfert à travers la paroi stomacale : la durée et la zone de contact aspirine/estomac sont plus petites et les lésions sont moins importantes voire inexistantes.

(2) qui attaque violemment, jusqu'à faire des trous.

