

L'aspirine, un médicament universel

Pour arriver à la formule de l'aspirine, ce médicament bien connu, il a fallu du temps et la contribution de nombreux chimistes.

L'aspirine est le médicament le plus consommé au monde, avec une production annuelle de plusieurs dizaines de milliers de tonnes, soit des milliards de petits comprimés blancs !

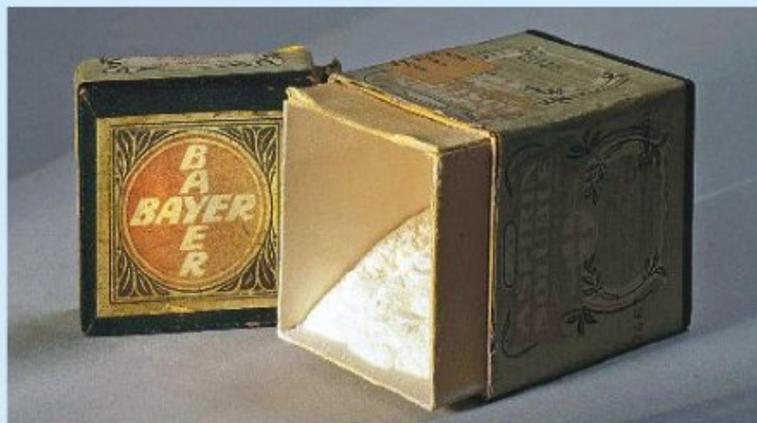


Fig. 1 Boîte d'aspirine datant de 1900.

Au ^v siècle avant notre ère, Hippocrate, célèbre médecin grec, utilise des décoctions de feuilles de saule pour combattre fièvres et douleurs. Cette utilisation empirique du saule pour soulager est déjà connue bien avant lui.

À partir du ^{xix} siècle, les progrès de la chimie permettent d'identifier les principes actifs, c'est-à-dire les molécules responsables des propriétés thérapeutiques des médicaments. Ainsi, en 1829, Leroux, un pharmacien français, isole le principe actif de l'écorce de saule, dont il connaissait les effets fébrifuges : la salicine (le nom latin du saule est *salix*), et en fait tester les effets sur des malades. La salicine est par la suite

extraite d'une fleur, la reine des prés (*Spiraea ulmaria* en latin), mais d'autres plantes en contiennent aussi. Une des difficultés rencontrées pour isoler la salicine réside dans le fait qu'elle est présente en très faible quantité dans ces végétaux.

Dans les années qui suivent, afin d'améliorer le remède, plusieurs chimistes (dont l'Allemand Kolbe en 1860) transforment la salicine en acide salicylique, qui est plus efficace contre les douleurs et les fièvres. Mais pour se rendre indépendants des sources naturelles, ils se tournent vers des méthodes de synthèse.

C'est en 1897 qu'Hoffmann, chimiste chez Bayer, met au point un nouveau procédé et fabrique, à partir de l'acide salicylique, l'acide acétylsalicylique (Fig. 2), à la fois plus actif et surtout moins irritant pour l'estomac. En réalité, dès 1853, le Français Charles Gerhardt avait réussi cette synthèse sans que son travail ne soit exploité !

En 1899, cet acide acétylsalicylique est lancé sur le marché sous le nom commercial d'Aspirin par la firme allemande (Fig. 1). Après la Première Guerre mondiale, les droits sont saisis et la marque tombe dans le domaine public.

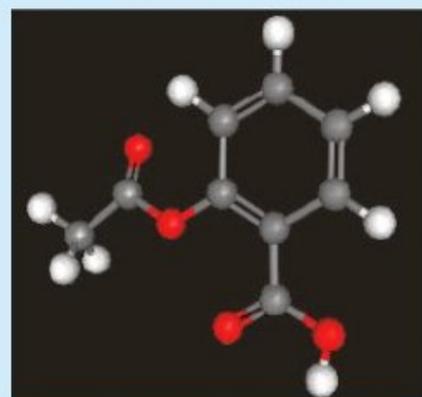
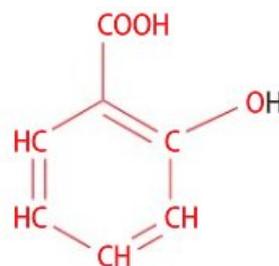


Fig. 2 La molécule d'acide acétylsalicylique. ▶

Pistes de réflexion

1. Rechercher ce que signifie « fébrifuge ».
2. Pourquoi est-il difficile d'isoler la salicine ?
3. Quelle différence y a-t-il du point de vue de l'origine entre la salicine d'une part et l'acide salicylique d'autre part ?
4. Citer une des raisons qui justifie l'essor de la chimie de synthèse.
5. Dans la formule de l'acide salicylique, le groupe d'atomes responsable de l'activité pharmacologique est en rouge. En s'aidant du modèle de la figure 2 et de la formule de l'acide salicylique, donner la formule de la molécule d'acide acétylsalicylique.
6. Quel est, au plan médical, l'avantage de passer de l'acide salicylique à l'aspirine ?
7. On peut attribuer les propriétés thérapeutiques voisines de ces deux molécules – acide salicylique et aspirine – au fait qu'elles possèdent le même groupe d'atomes : celui qui est en rouge. Quelle est la modification de la formule du médicament apportée par le procédé de Hoffmann ?



molécule de l'acide salicylique

L'aspirine est vendue sous différentes appellations, par exemple : Asprine du Rhône 500 et Aspirine Ph8

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 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.

- 1° Quelles sont les deux catégories d'espèces chimiques présentes dans un comprimé ?
- 2° Identifier le principe actif sur les étiquettes chimiques présentes dans un comprimé.
- 3° Qu'est-ce qu'un excipient ? Préciser son rôle
- 4° Dans quel cas ne faut-il pas consommer de l'aspirine ?
- 5° Rechercher la signification des initiales " q.s.p. " qui figurent dans l'excipient de l'aspirine pH8.