



Université Ziane Achour-Djelfa

Faculté des Sciences exactes et informatique

Département de Chimie

Cours adressé aux étudiants de 3^{ème} Année Licence Chimie

Option : Chimie Organique

Module : Chimie Organique Thérapeutique

Chapitre V : Les anti- inflammatoires non stéroïdiens

Enseignant : Dr. Bensatal Ahmed

E.mail.matmatidz@gmail.com

Introduction

Les anti-inflammatoires non stéroïdiens (AINS) sont un type de médicament utilisé dans le traitement de l'arthrite pour soulager la douleur et l'inflammation (rougeur ou chaleur).

V.1. CLASSIFICATIONS DES AINS

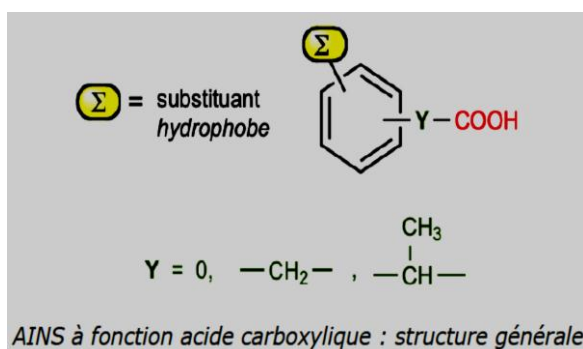
Classification chimique

Deux catégories de substances peuvent être définies :

1. d'une part, les composés à caractère acide,
2. d'autre part, les composés non acides.

1. AINS à caractère acide

Molécules possédant une fonction acide carboxylique, il s'agit de la majorité des anti-inflammatoires disponibles sur le marché.

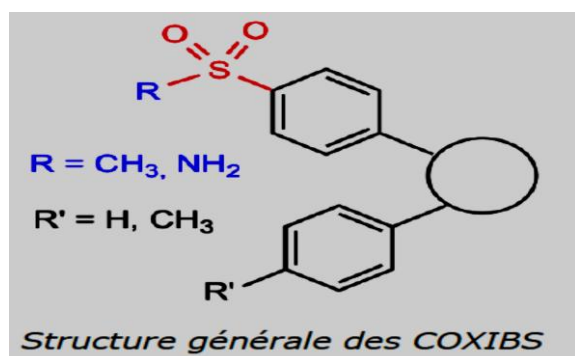


La nature du motif de jonction "Y" situé entre le système cyclique et le groupe acide permet de définir trois sous-familles d'AINS :

- Dérivés salicylés et anthraniliques
- Dérivés arylacétiques
- Dérivés arylpropioniques

2. AINS non acides

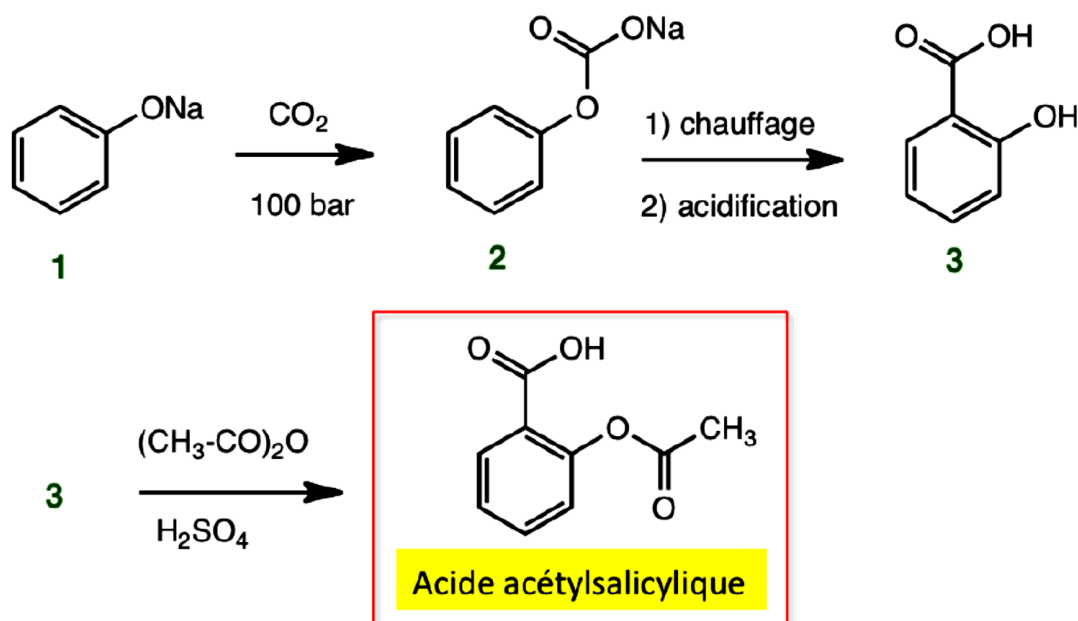
La famille des COXIBS est caractérisée par une fonction sulfone (SO_2) portant un motif NH_2 ou CH_3



V.2. PRINCIPALES FAMILLES D'AINS

V.2. a. DERIVES SALICYLES : ASPIRINE (acide acétylsalicylique)

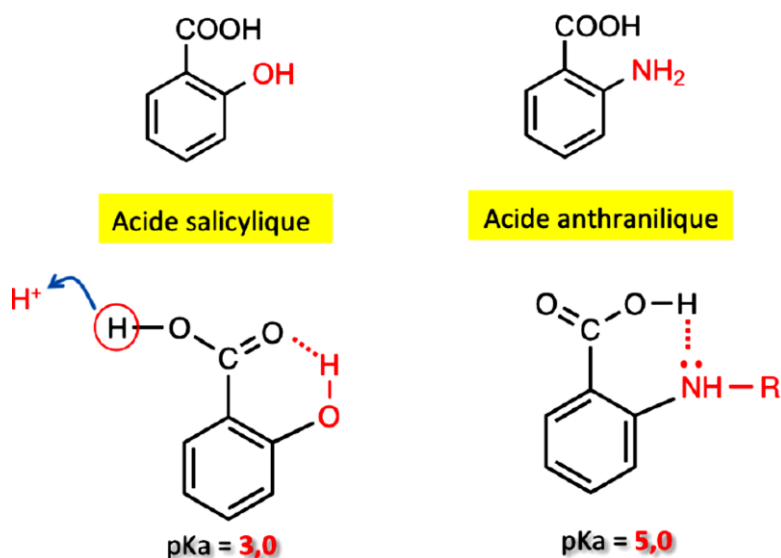
L'ASPIRINE est une molécule assez lipophile ($\log P = 1,19$), ce qui explique sa faible solubilité dans l'eau (à pH neutre, environ 3 g/L, à température ambiante). L'acidité de l'aspirine ($pK_a = 3,5$) se situe à un niveau intermédiaire entre celle de l'acide benzoïque ($pK_a = 4,2$) et celle de l'acide salicylique ($pK_a = 3,0$).



Principe de la synthèse de l'aspirine

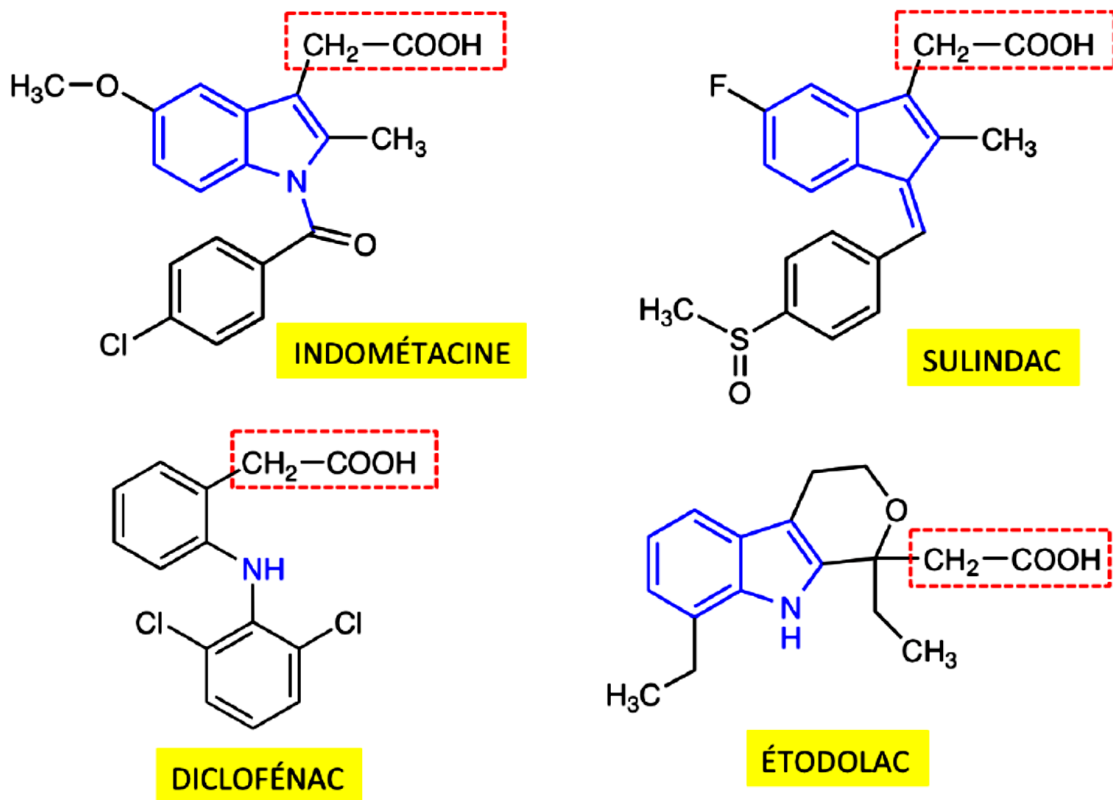
V.2. b. DÉRIVÉS DE L'ACIDE ANTHRANILIQUE

Ce sont également des dérivés *ortho*-substitués de l'acide benzoïque, l'acide salicylique et l'acide anthranilique sont considérés comme biologiquement équivalents : ce sont des motifs bio-isostères.



V.2. c. DÉRIVÉS ARYLACÉTIQUES ET APPARENTÉS

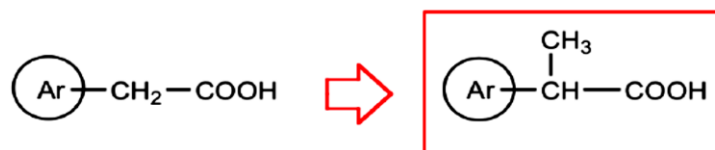
Cette sous-famille correspond aux composés dans lesquels un chaînon CH_2 se trouve intercalé entre le groupement acide et le motif cyclique.



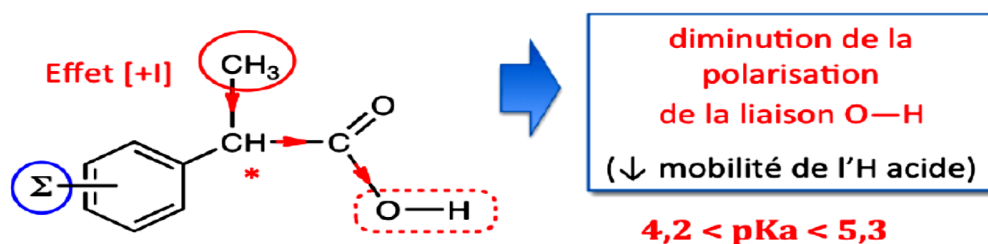
AINS arylacétiques et apparentés : principales molécules

V.2. d. DÉRIVÉS ARYLPROPIONIQUES

Schématiquement, les AINS arylpropioniques peuvent être considérés comme des dérivés arylacétiques dans lesquels l'un des H du groupement CH_2 de la chaîne latérale a été remplacé par un groupe méthyle :



Structure générale des AINS arylpropioniques (ou ramifiés)



AINS arylpropioniques : effet électronique du groupement méthyle