

# **HETEROSIDES ANTHRACENIQUES**

**Dr Serigne Ibra Mb DIENG**

**Laboratoire de Pharmacognosie**

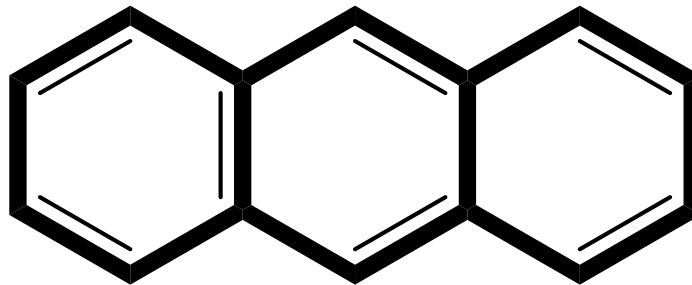
**L3P**

# INTRODUCTION

## ■ Définition

- Anthracénosides : substances phénoliques hétérosidiques
- Génines : dérivées de l'**anthracène** à **différent degré**

**d'oxydation**



**ANTHRACENE**

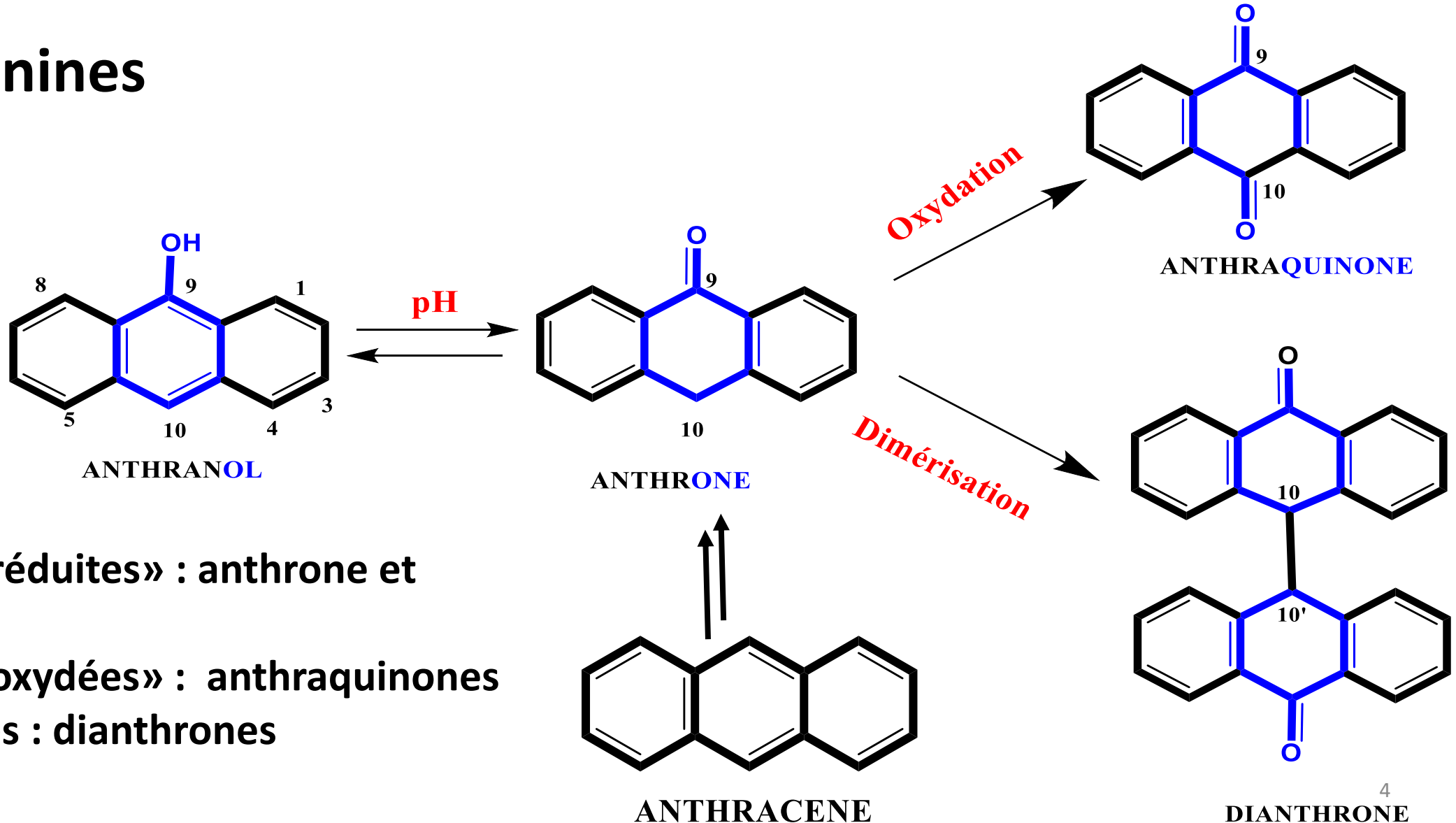
# INTRODUCTION

## ■ Intérêt

- Thérapeutique : **constipation** (laxatif ou purgatif)
- Préventive : crise hémorroïdaire, déshydratation

# I- STRUCTURE

## I.1-Génines



- «Formes réduites» : anthrone et anthranol
- «Formes oxydées» : anthraquinones
- Sennidines : dianthrones

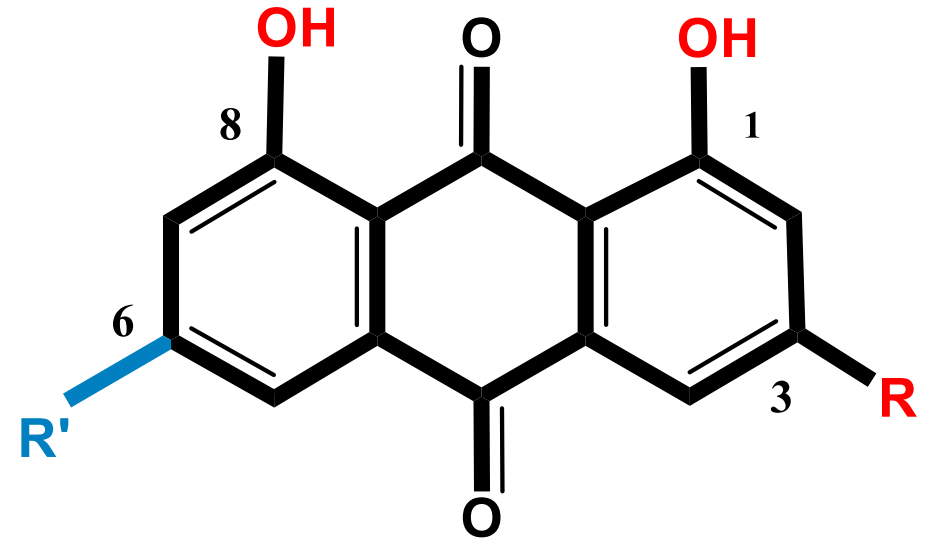
# I- STRUCTURE

## I.1-Génines

### ■ Éléments constants

- 2 OH en  $C_1$  et  $C_8$
- 1 substituant carboné en  $C_3$

### ■ Éléments éventuels : OH ou $OCH_3$ en $C_6$

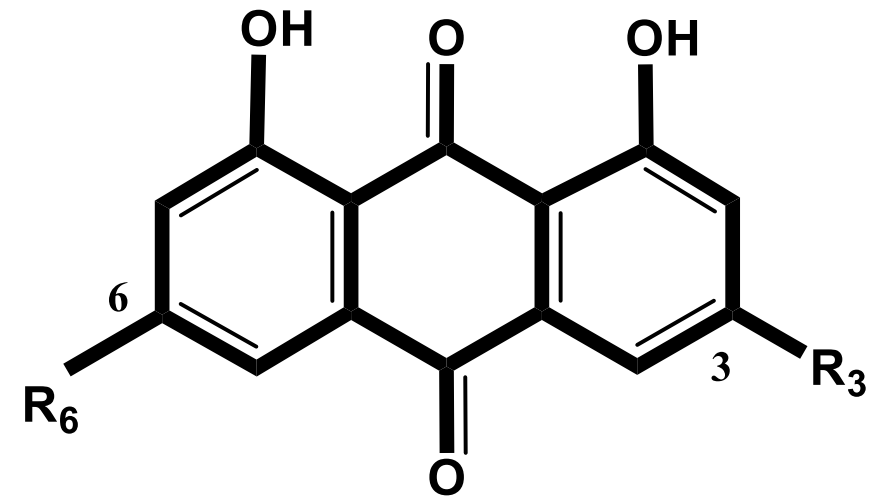


# I- STRUCTURE

## I.1-Génines

### ■ Exemples de génines anthraquinones

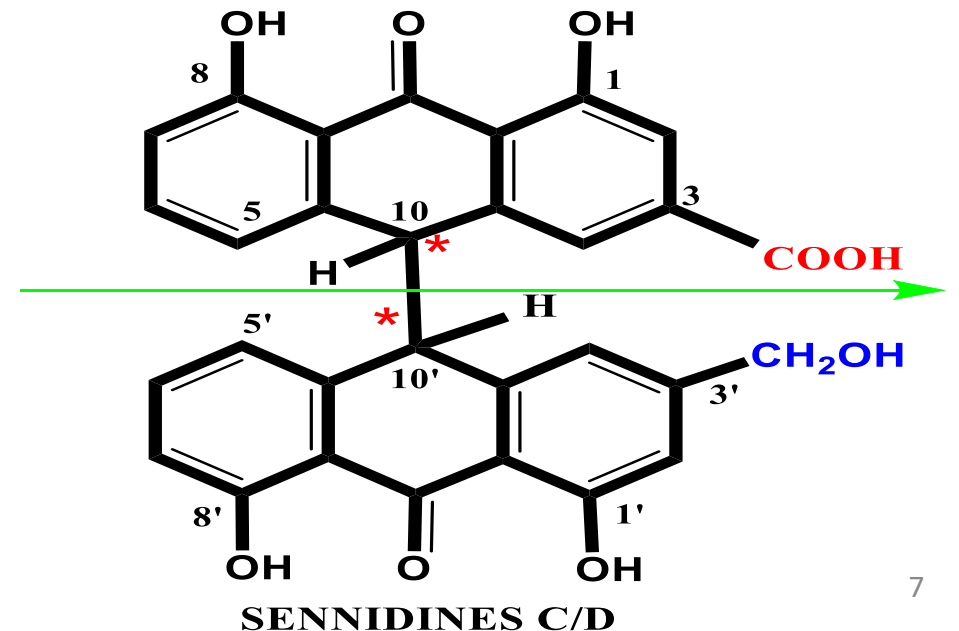
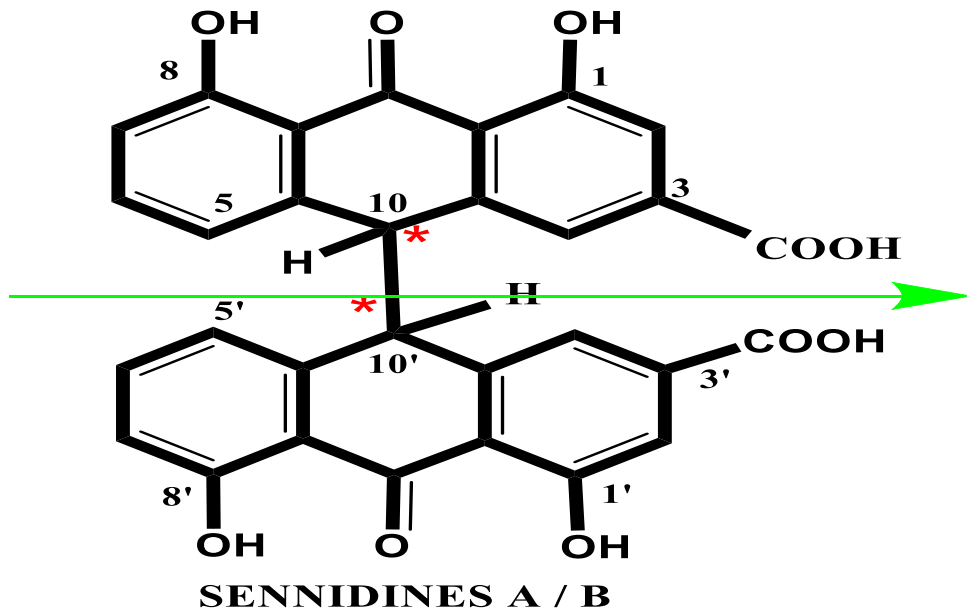
	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>
chrysophanol (cascara)	CH <sub>3</sub>	H
émmodol (bourdaine)	CH <sub>3</sub>	OH
aloe-émmodol (cascara, sénés)	CH <sub>2</sub> OH	H
rhéine (sénés)	COOH	H
physcion (rhubarbe)	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>



# I- STRUCTURE

## I.1-Génines

- Exemples de génines **dianthrones**
  - **Homodianthrones** (Sennidines A et B)
  - **Hétérodianthrones** (sennidines C et D)

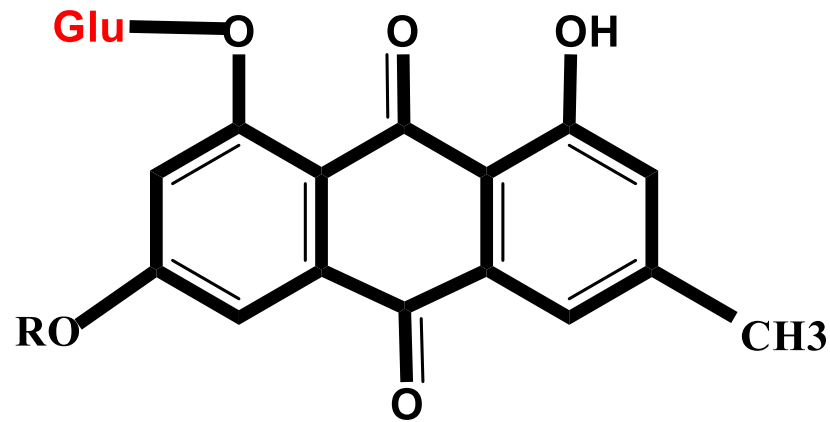


# I- STRUCTURE

## I.2- Hétérosides

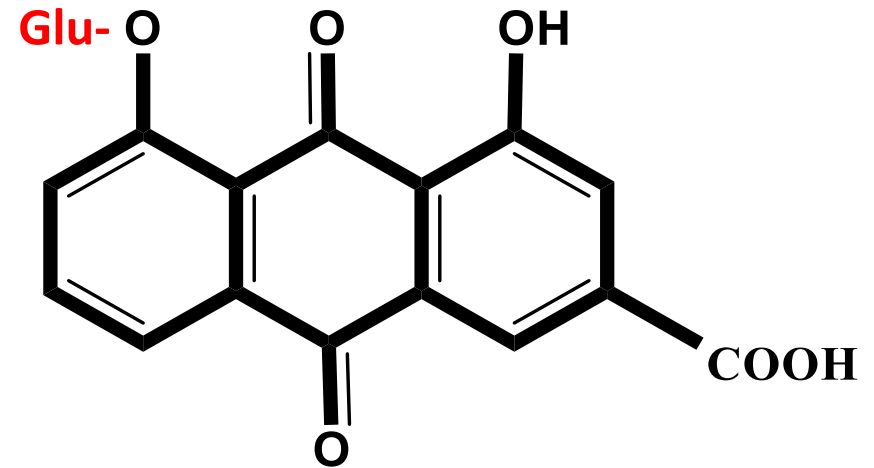
- Oses : glucose, rhamnose, apiose plus rarement
- **Un** ou **deux oses**
- Liaison génine – ose(s) :
  - **O-hétérosides** : OH phénolique en C8 ou C6 ou C1
  - **C-hétérosides** : carbone C10 des anthrones

# I- STRUCTURE

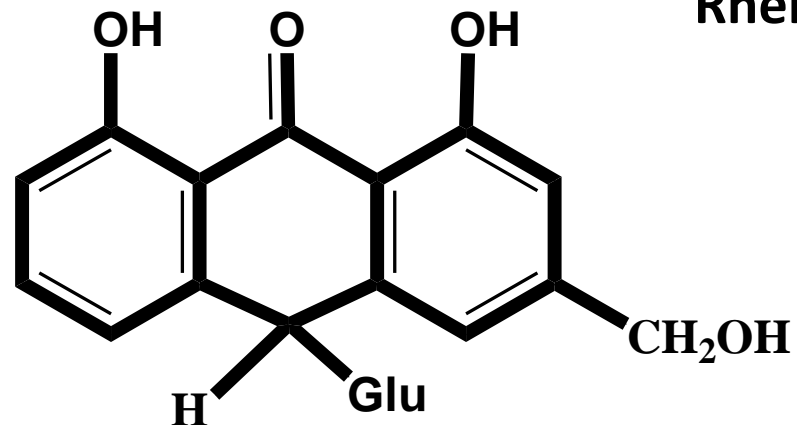


**Glucofranguloside A:** R=Rhamnose

**Glucofranguloside B:** R=Apiose

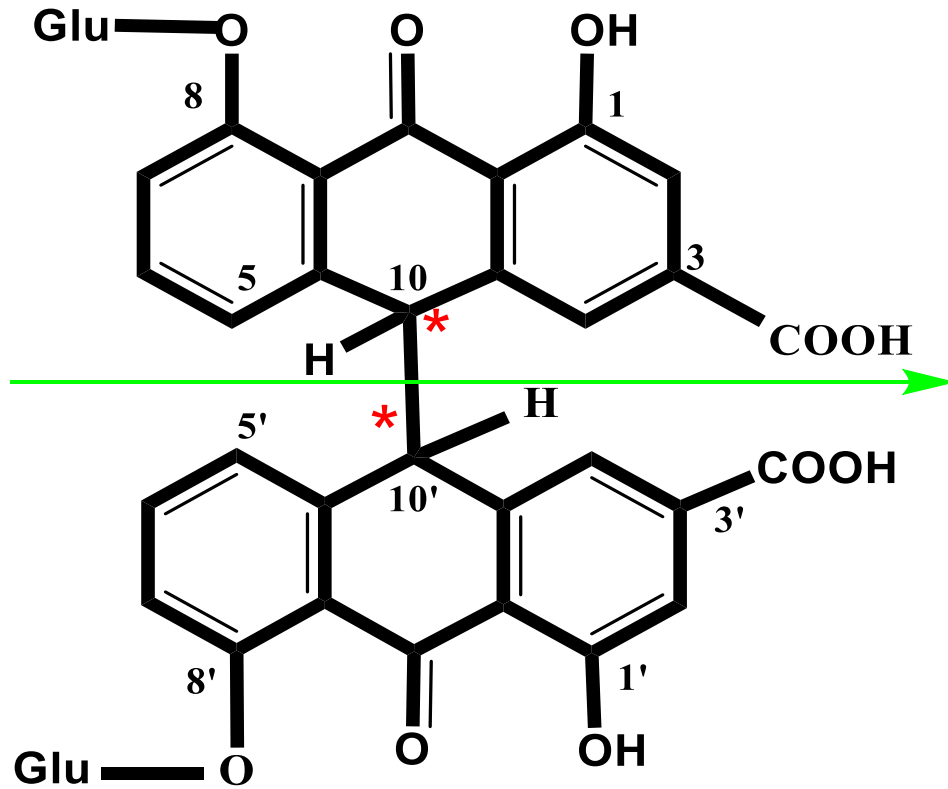


**Rhéine - 8 - glucoside**

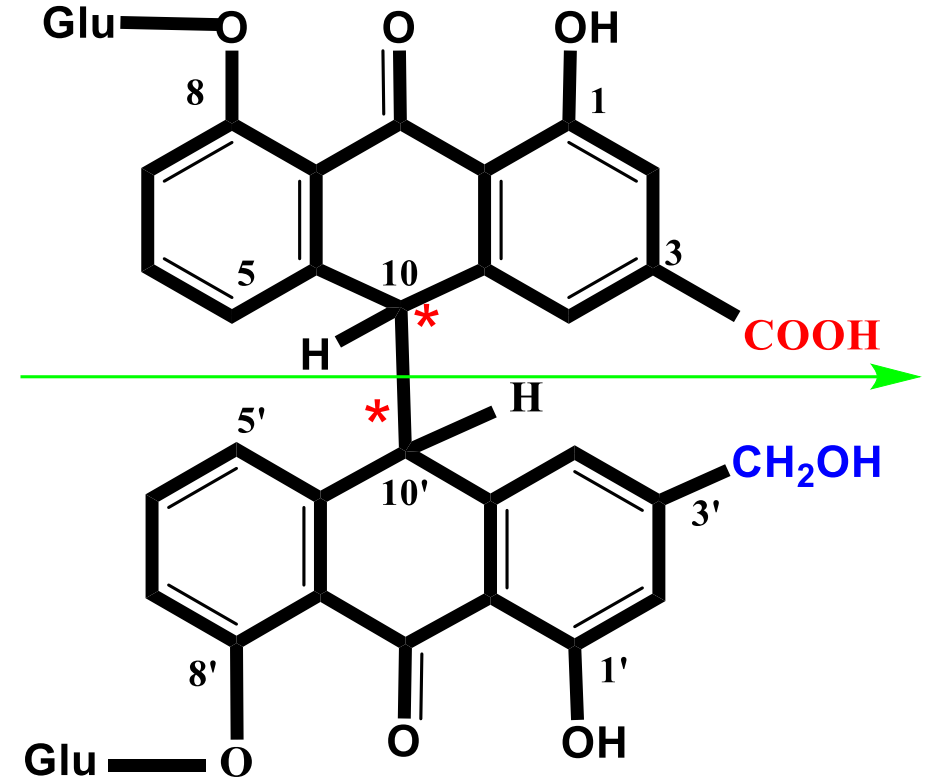


**ALOÏNE**

# I- STRUCTURE



SENNOSIDES A ET B



SENNOSIDES C ET D

# II-PROPRIETES PHYSICO-CHIMIQUES

- Composés rouge-orangé
  - **Hétérosides** : solubles dans l'eau, solvants hydro-alcooliques
  - **Génines** : insolubles dans l'eau, soluble dans les solvants organiques et les alcools
- NB** : **Génines carboxyliques** solubles en solution aqueuse de bicarbonate de sodium

# II-PROPRIETES PHYSICO-CHIMIQUES

## ■ Réactions d'Hydrolyse et d'oxydation

- **O-hétérosides** : hydrolyse en milieu acide (HCl)
- **C-hétérosides** : hydrolyse par  $\text{FeCl}_3$  en milieu acide
- **Formes dimériques** : En milieu neutre,  $\text{FeCl}_3$  oxyde les dianthrone en anthraquinone

# III – ESSAIS

## III.1-Caractérisation

- **Génines anthraquinoniques libres : Réaction de BORNTRAGER**
  - Spécifique aux **anthraquinones libres**
    - En présence d'alcalin (KOH, NH<sub>3</sub>)
    - Groupements phénoliques déprotonés en phénates
    - **Coloration rouge**

# III – ESSAIS

## III.1- Caractérisation

- **Génines anthroniques**

- **Bleu de nitrotétrazolium ou p-nitroso-diméthyl-aniline**
- **Formation d'azométhine colorée en Gris-Bleu**

# III – ESSAIS

## III.1- Caractérisation

### ▪ CCM

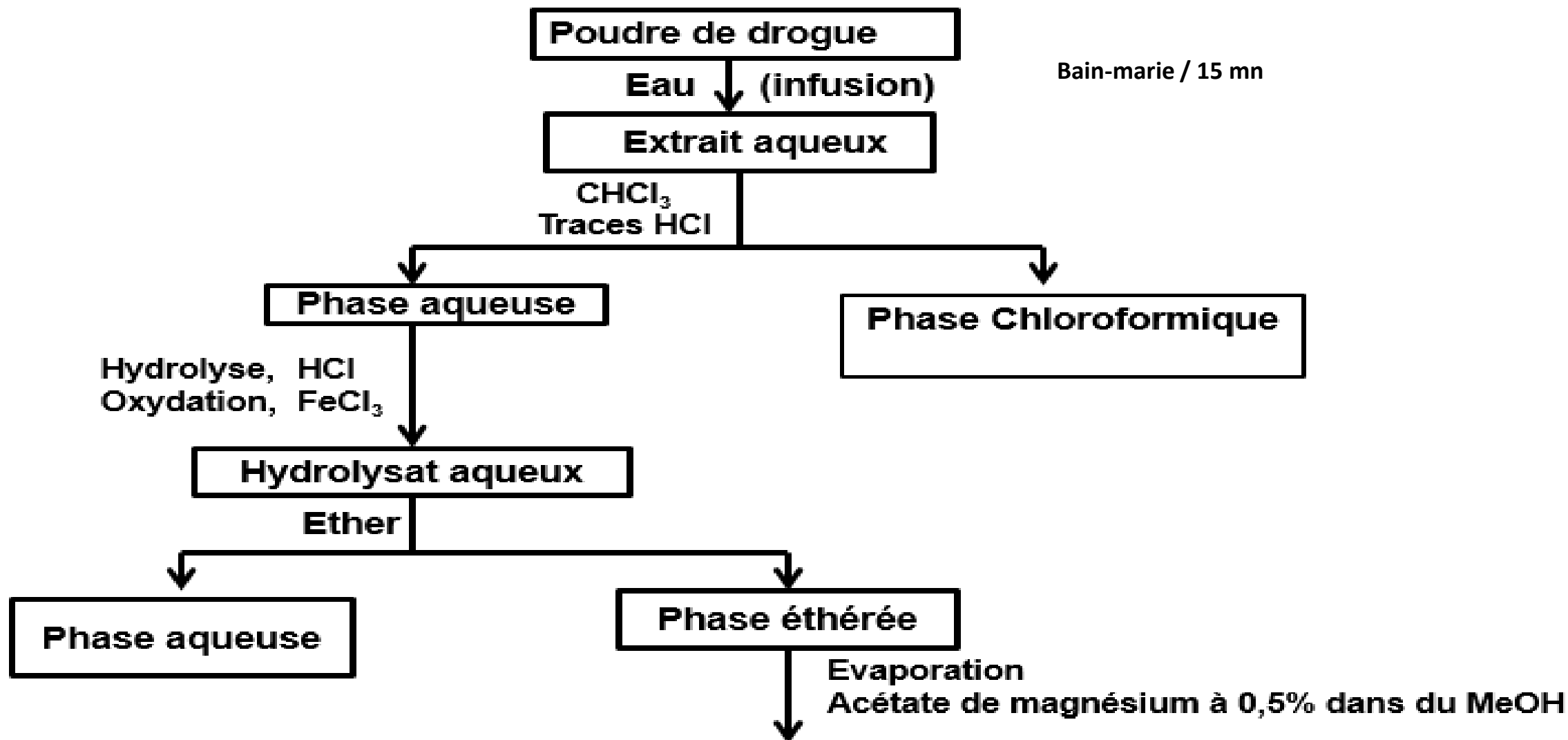
- UV : Tâches fluorescentes
- Révélation : avec la potasse (R° Bornträger)
- Témoins

# III – ESSAIS

## III.2- Dosage

### ▪ Dosage physico-chimique

- Principe de la réaction de Bornträger
- Réactif basique : **acétate de magnésium**
- Dosage des **formes combinées totales** (Hétérosides totaux)



- Solution méthanolique (rouge)
- Lire l'absorbance au spectrophotomètre à 515 nm
- Faire une gamme d'étalonnage

Dosage physico-chimique des anthracénosides

# III – ESSAIS

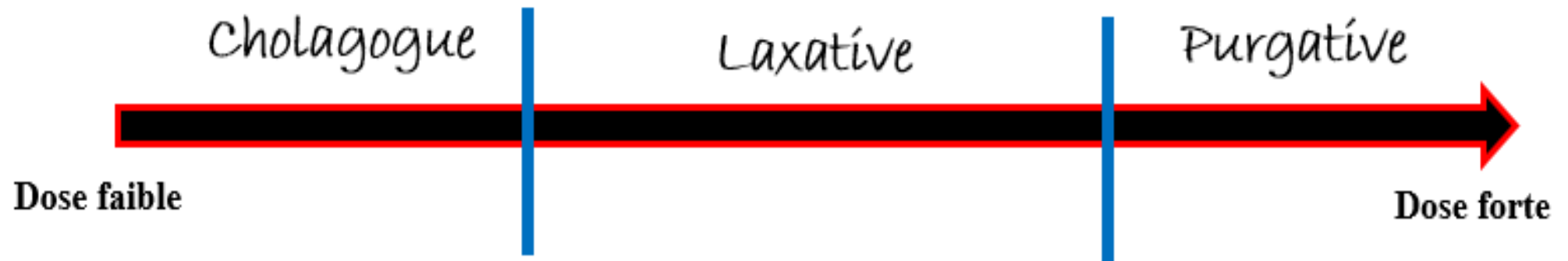
## III.2- Dosage

### ▪ Dosage biologique

- **Méthode de Fairbairn** : Détermine la dose qui fait apparaître chez la souris des selles molles ou fluides.
- **Méthode de Loewe** : mesure la durée du transit intestinal par incorporation dans le bol d'un colorant (carmin)

# IV- PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET EMPLOIS

- Sont des **laxatifs stimulants**
- Activité est modulée suivant la dose



- Activité liée à la structure et à la forme des génines

# IV- PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET EMPLOIS

- **Formes combinées** plus actives que les **génines libres**
- Hydrolyse au niveau du colon / bactéries flore intestinale
  - Génines libérées, réduites (anthrones)
  - Oses : indispensables à leur transport

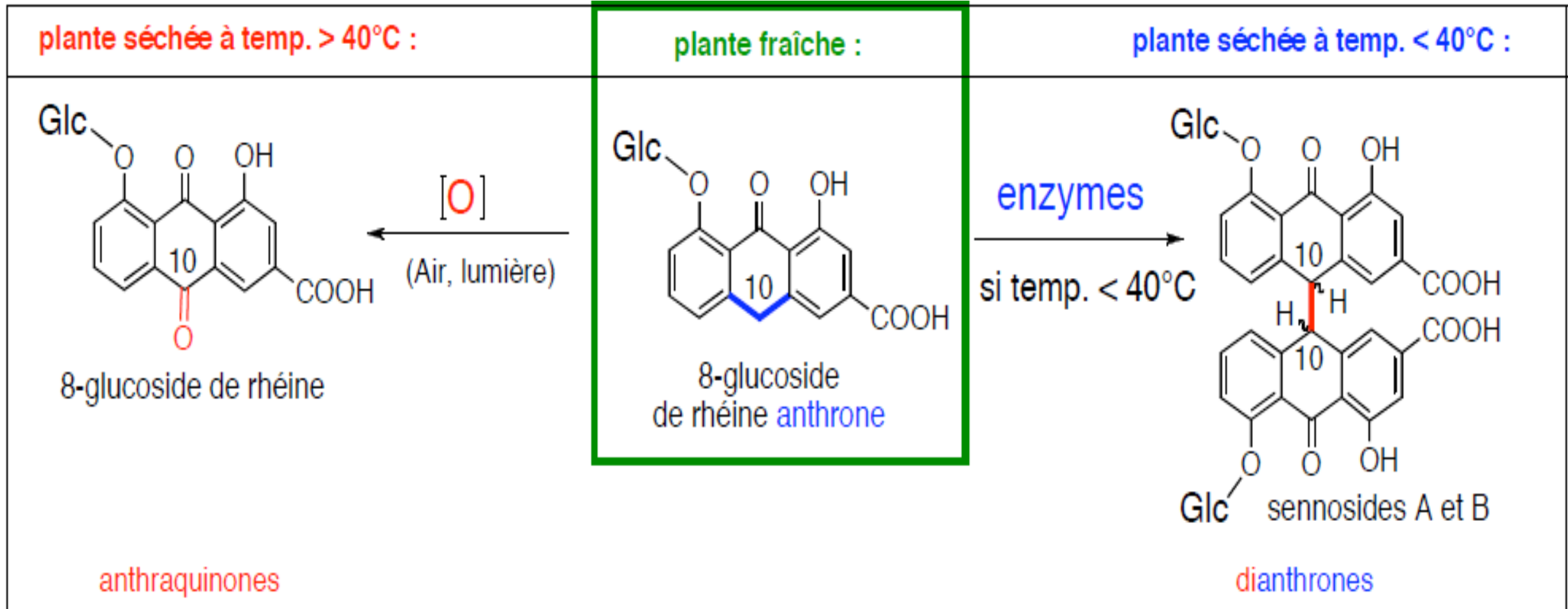
# IV- PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET EMPLOIS

- Anthrones *in situ* : formes responsables de l'activité
  - Inhibition de **Na<sup>+</sup>-K<sup>+</sup> ATPase**
    - Diminution de résorption d'eau, Na et Cl
    - Augmentation du **péristaltisme colique**
- Temps de latence : **6 -12 h**
- Anthracénosides = ***prodrogues***

# IV- PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET EMPLOIS

- Action des H. d'anthrones monomères est trop marquée
- **Utilisation des drogues à anthrones : après un stockage prolongé ou traitement thermique approprié**
- Différence d'intensité d'activité entre drogues fraîches et séchées

# IV- PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET EMPLOIS



# IV- PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET EMPLOIS

## ■ Effets indésirables

- Colite réactionnelle avec diarrhée
- Douleurs abdominales, nausées, vomissements
- Mélanose recto-colique, altération de la muqueuse du colon
- Troubles hydro-électrolytiques avec hypokaliémie
- Dégradation de l'état général

**Usage avec prudence et courte durée (8-10 jr)!!!!**

# IV- PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET EMPLOIS

- **Emplois des drogues à anthracénosides**
  - Essentiellement contre la **constipation**
    - En nature (tisanes)
    - Forme galénique (poudres, extraits)

# IV- PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES ET EMPLOIS

## ▪ Emplois des drogues à anthracénosides

- Extraction des anthracénosides purs réservé à l'adulte
  - Examen radiologique, coloscopie
  - Intervention chirurgicale ano-rectale
  - Retrouvés dans plusieurs « médicaments anti – obésité »

# VI-PLANTES SOURCES

## VI.1- SENES

- Sous-arbrisseaux à tige ligneuse
  - **Binômes** : *Senna alexandrina*, *S. italica*
  - **Famille** : *Fabaceae*
  - **Drogue** : Folioles et fruits mûrs séchés (2-4%)
  - **Principes actifs** : Sennosides



*Senna italica*

# VI-PLANTES SOURCES

## VI.2-BOURDAINE

- Arbuste originaire d'Europe, pousse sur des terrains frais et humides
  - **Binômes** : : *Rhamnus frangula*
  - **Famille** : *Rhamnaceae*
  - **Drogue** : Ecorces
  - **Principes actifs** : glucofrangulosides et frangulosides

# VI-PLANTES SOURCES

## VI.3- ALOES

- Plantes poussant dans les régions désertiques

- **Binôme** : *Aloe ferox*, plante sauvage

*Aloe vera*, plante cultivée

- **Famille** : *Asphodelaceae*

- **Drogue** : Suc des feuilles,

20% (*Aloe ferox*) ; 30% (*Aloe vera*)

- **Chimie** : Principe actif : aloïne



# VI-PLANTES SOURCES

## VI.4 - RHUBARBE DE CHINE

- Grande plante herbacée vivace
  - **Famille** : *Polygonaceae*
  - **Binôme** : *Rheum officinale*
  - **Drogue** : racine et le rhizome (2 à 4% )
  - **Principes actifs** : hétérosides anthraquinones, sennosides

# CONCLUSION

- Composés très utilisés dans le traitement de la constipation
- Intensité d'action différente en fonction des formes
- Prudence par rapport aux drogues fraîches
- **Attention!!!!** abus est dangereux :
  - Hypokaliémie
  - Mélanose colique

