

Département de pharmacie

Laboratoire de pharmacognosie

PHENOLS ET ACIDES PHENOLS

Plan :

I-Généralités

II-Propriétés physicochimique, extraction, caractérisation et dosage

III-Intérêt pharmacologique, emploi

IV-Différents types de drogues

I-Généralités :

Le terme d'acide-phénol peut s'appliquer à tous les composés organiques possédant au moins une fonction carboxylique et un hydroxyle phénolique. La pratique courante en phytochimie conduit à réserver l'emploi de cette dénomination aux seuls dérivés des acides benzoïque et cinnamique.

A-Phénols simples : (catéchol) sont rares dans la nature.

B-Acides phénols dérivés de l'acide benzoïque

C-Acides phénols dérivés de l'acide cinnamique

II-Propriétés physicochimique, extraction, caractérisation et dosage :

A-Propriétés physicochimique :

A-1-Solubilité :

- Ø Les phénols sont solubles dans les solvants organiques polaires,
- Ø Ils sont solubles dans les solutions des bases fortes(NaOH) et de carbonate de Na sous forme de phénates.
- Ø Les acides-phénols sont solubilisés par les hydrogénocarbonates
- Ø Les formes hétérosidiques sont solubles dans l'eau.

A-2-Stabilité :

- Ø Tous ces composés sont instables.
- Ø Tous les phénols sont facilement oxydables surtout en milieu alcalin.
- Ø Isomérisation en milieu acide ou alcalin ou sous l'influence des rayons UV.
- Ø Elles présentent des propriétés réductrices surtout marqués chez les polyphénols, en particulier en position ortho (liqueur de Fehling, nitrate d'argent ammoniacal)

B-Extraction :

L'extraction de ces composés, conduite de préférence sur du matériel frais, est généralement obtenue à l'aide d'un alcool ou, avec une solution hydro-alcoolique.

Compte tenu de la fragilité de ces molécules il est recommandé de travailler

- Ø sous atmosphère inerte,
- Ø éviter les pH excessifs
- Ø concentrer les solutions extractives à basse température (30 °C).

Une réextraction de la solution aqueuse par (les solvants non miscibles de polarité croissante permet de séparer les formes libres, les esters, puis les hétérosides.

Séparation : chromatographie.

C- Caractérisation :**C-1-Réactions colorés :**

Avec les réactifs généraux des phénols.

- Ø FeCl₃ : coloration violette.
- Ø Condensation avec les amines diazotés :
- Ø Aldéhyde en milieu acide (vanilline, anisaldéhyde)
- Ø 2,6 dichloroquinone chlorimide en milieu alcalin
- Ø Réactif plus spécifique : 2,4 dinitrohydrazine pour les aldéhydes.

C-2-Méthodes analytiques : CCM, HPLC.

D-Dosage : HPLC

III-Intérêt pharmacologique, emploi :

- Ø Antiseptique
- Ø Anti-inflammatoire
- Ø Antiallergique
- Ø Employer sous forme (poudre, extraits, teinture)

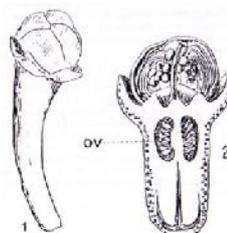
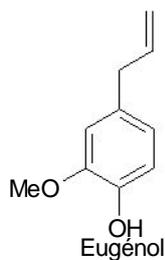
IV-Différents types de drogues :**A-LES PHENOLS LIBRES :**

Ils sont abondants dans les huiles essentielles.

A-1-CLOU DE GIROFLE : *Eugenia caryophyllus* (C. Spreng.) Bull. et Harr

Myrtaceae

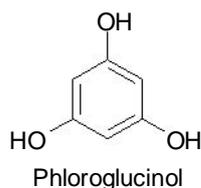
Eugénol :



Emploi : antiseptique, antalgique (odontologie)

A-2-FOUGÈRE MALE: *Aspidium filix-mas* Sw; Polypodiaceae

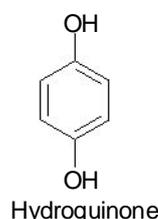
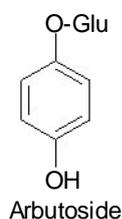
Filicine: mélange de dérivés de la phloroglucinol

Drogue : rhizomes.**Emploi :** filicine est un ténifuge**A-3-BUSSEROLE :** *Arctostaphylos uva-ursi* (L.) Spreng., Ericaceae.

Un petit arbrisseau des régions montagneuses

Drogue : la feuille séchée, entière ou fragmentée,

Les principes actifs : sont des hétérosides phénoliques, représentés par l'arbutine (= arbutoside, 6-10%) et la méthyl-arbutine. Par hydrolyse arbutoside libère un diphenol qui s'oxyde immédiatement en hydroquinone.

**Emploi :** traitement des infections des voies urinaires.**B-LES ACIDES PHENOLS :**

	R2	R3	R4	R5	
Benzoïque	H	H	H	H	Cinnamique
Salicylique	OH	H	H	H	<i>o</i> -coumarique
?-OH benzoïque	H	H	OH	H	?-coumarique
Gentisique	OH	H	H	OH	
Protocatéchique	H	OH	OH	H	Caféique
Vanillique	H	OCH ₃	OH	H	Férulique
Gallique	H	OH	OH	OH	
syringique	H	OCH ₃	OH	OCH ₃	Sinapique

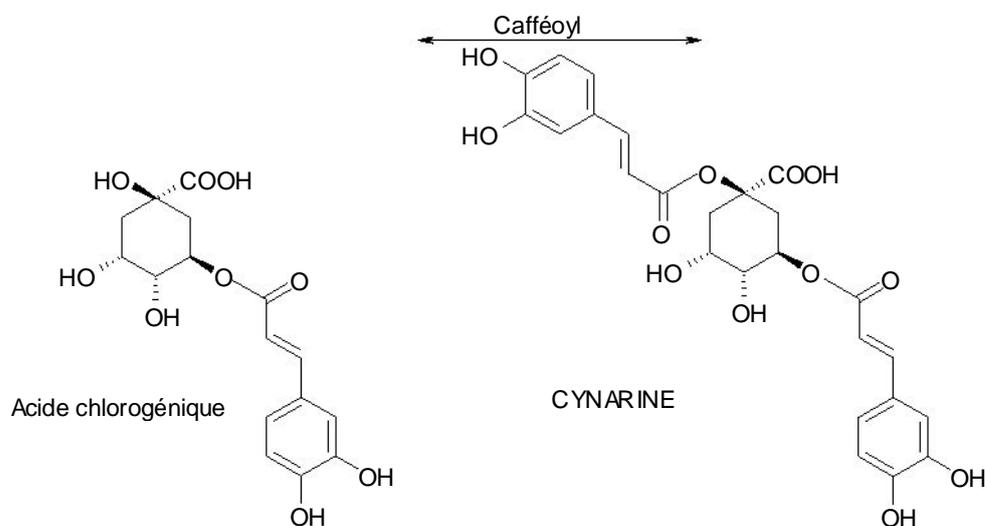
B-1-DERIVES DE L'ACIDE CAFÉÏQUE :**B-1-a-ARTICHAUT :** *Cynara scolymus L., Asteraceae*

L'artichaut est un grand arbre herbacée vivace



Drogue : « feuille radicale, entière ou réduite en fragments de taille variable, et séchée »

Composition chimique : des esters de l'acide caféique (1%) : acide 5caféylquinique (= acide chlorogénique) et acide 1,5-dicaféylquinique (= cynarine), présents dans la drogue fraîche.



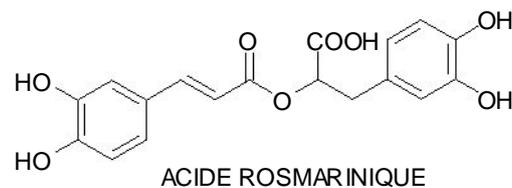
Emploi : cholérétiques.

B-1-b-ROMARIN : *Rosmarinus officinalis L., Lamiaceae*

Arbrisseau touffu possède des feuilles sessiles, persistantes, opposées, linéaires.

Drogue : sommité fleurie séchée.

Composition chimique : acides-phénols : des dérivés caféiques : acides caféique, chlorogénique et rosmarinique.



Emplois :

Troubles digestifs

Facilite les fonctions d'élimination urinaire et digestive

Cholérétique ou cholagogue.



B-2-DERIVES DE L'ACIDE SALICYLIQUE :**B-2-a-ULMAIRE (REINE DES PRÉS) *Filipendula ulmaria* (L.) Maxim.,**

Rosaceae

Plante herbacée vivace lieux humides

Droque : sommité fleurie et fleurs séchées**Récolte et séchage :**

-cueillette des sommités fleuries (juillet-août).

Pays de l'est et centre de l'Europe.

-séchage rapide.

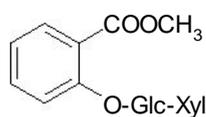
Composition chimique :

Huile essentielle : aldéhyde salicylate + salicylate de méthyle.

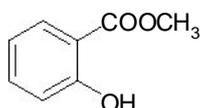
Hétérosides de flavonols, Tannins : 10 à 20% .

Hétérosides d'acides-phénols (monotropitoses) + aldéhyde salicylique.

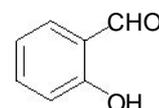
Hétérosides salicylés livrent par hydrolyse du salicylate de méthyle.



monotropitose



méthyle salicylate



aldéhyde salicylate

Activités/emploi :Voie orale :

-états fébriles/grippaux

-antalgiques (céphalées, douleurs dentaires)

-anti-inflammatoire

Voie orale et topique :

-traitement symptomatique des manifestations articulaires douloureuses mineures

-faciliter les fonctions d'élimination urinaire et digestive.

Salicylate de méthyle :

- analgésique ;
- anti-inflammatoire non stéroïdien ;
- antipyrétique ;
- cholérétique
- hypolipémiant.

B-2-b-SAULES : *Salix alba* L, Salicaceae.

Sont des arbres dioïques communs dans les zones humides de toute l'Europe.

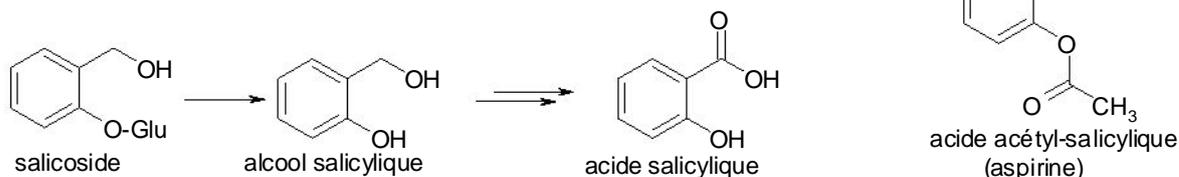
Drogue : écorce de tronc.

Récolte : écorce des jeunes branches de 2 ou 3 ans, récoltée au printemps.

**Composition chimique :**

-Proanthocyanidols et flavonoïdes

-1 à 11% de glucosides de phénols et acides phénols : hétéroside de l'alcool salicylique (salicoside).

**Emploi :**

Les écorces sont traditionnellement utilisées par voie orale dans :

- les états fébriles (grippaux)
- antalgique (céphalées, douleurs dentaires) et, par voie orale aussi bien qu'en usage local,
- douleureuses articulaires mineures.

C-DROGUES A BENZOATES ET CINNAMATES : BAUMES :

Un baume est « une oléorésine naturelle particulière caractérisée par la présence de constituants benzoïques et/ou cinnamiques ».

C-1-BAUMIER DU PEROU : *Myroxylon balsamum* (L.)Harms Fabaceae.

Est un arbre spontané Amérique centrale.

Lorsque le tronc est battu et écorcé puis, dans un deuxième temps, brûlé à l'aide d'une torche, il sécrète un exsudat pathologique, le baume. Traditionnellement,

l'exsudation est recueillie avec des chiffons qui sont ensuite immergés dans l'eau bouillante : le baume, insoluble, est récupéré par décantation (densité relative = 1,135-1,170).

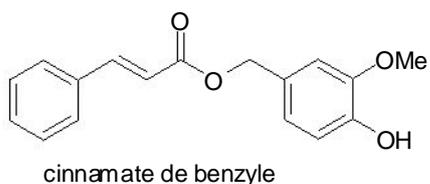
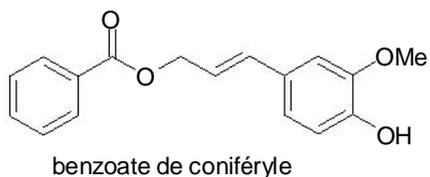
C'est un liquide sirupeux brun foncé à odeur forte et vanillée ; il ne s'épaissit pas à l'air,

Composition chimique :

-6-8 % d'acides benzoïque et cinnamique libres

-50 à 60 % de « cinnaméine », mélange de benzoate et de cinnamate de benzyle, de cinnamate de cinnamyle.

-des alcools, vanilline et une fraction résineuse.



Emploi :

Le baume de tolu est utilisé, uniquement en usage externe, pour ses propriétés antiseptiques et cicatrisantes (**Tulle gras Lumière®**)

C-2-BAUMIER DE TOLU, *Myroxylon balsamum* (L.) Harms = *M. toluiferum* H. B. & K., Fabaceae



L'espèce productrice est un grand arbre qui croît spontanément en Colombie et au Venezuela.

La drogue : est obtenue par incision profonde du tronc de l'arbre.

Chimiquement, le baume de Tolu est un mélange d'acides libres (acide benzoïque, 6-8 % et plus, acide cinnamique, 10-15 %) et de benzoate de benzyle.

Emploi :

Antiseptique et expectorant,

C-3-BENJOIN DE LAOS : *Styrax tonkinensis* Craib Styracaceae

Arbre spontané au Laos, en Thaïlande et dans le nord du Vietnam.

Drogue : ou benjoin du Laos,

-obtenue par incision du tronc,

-se présente en masses de taille variable, opaques, friables,

-couleur blanc jaunâtre à rougeâtre et à odeur de vanille.

Composition chimique :

-60-80 % de benzoate de coniféryle,

-10 à 20% d'acide benzoïque libre,

-cinnamate de benzyle, de la vanilline, des triterpènes.

Emploi :

-antiseptiques des voies respiratoires(sous forme de teinture en inhalation).

-en parfumerie, cosmétologie et agroalimentaire.



C-4-BENJOIN DE SUMATRA : *Styrax benzoin* Dyrand. et *Styrax paralleloneurus* Perkins, Styracaceae.

Espèces spontanées en Malaisie et en Indonésie,
Cultivées à Sumatra et exportées à partir de
Singapour.

Drogue : résine balsamique se présente en larmes et en
fragments irréguliers englobés dans une matrice
résineuse translucide, brun-rouge.

Composition chimique :

-(20 % et plus) d'acides benzoïque et cinnamique libres, l'acide cinnamique
(80%)

-esters (benzoates, cinnamates)

-triterpènes, vanilline.

Emploi : Industrie autres que l'industrie alimentaire.

