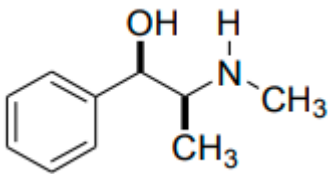
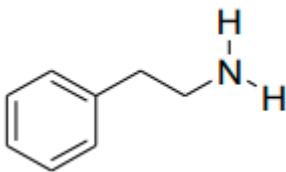


L'une des premières plantes médicinales référencées dans les archives historiques est le Ma Huang, un arbuste originaire de Chine. Lorsque les tiges séchées du Ma Huang sont trempées dans de l'eau chaude, l'extrait qui en résulte contient des niveaux thérapeutiques d'éphédrine (1). Les premiers Chinois ont noté la capacité du Ma Huang à soulager les symptômes du rhume. L'effet du Ma Huang est attribuable à l'éphédrine, qui est un vasoconstricteur et un stimulant.



(1) l'éphédrine isolée de Ma Huang

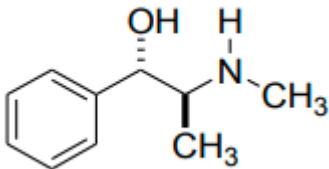
Les composés qui (1) sont extraits de sources naturelles, (2) contiennent un atome d'azote basique, et (3) ont un degré de complexité structurale sont appelés alcaloïdes. L'éphédrine fait partie d'une grande classe de molécules appelées phénéthylamines. Le composé parent de cette classe est la phénéthylamine (2). Tous les composés de cette classe contiennent des groupes phényle et amino liés par un lien à deux carbones. Dans le cas des phénéthylamines, ces trois éléments structuraux (phényle, amino, et tether) définissent le pharmacophore de la classe. Un pharmacophore est la fonctionnalité minimale pour que les composés soient biologiquement actifs. Comprendre quelles parties d'une molécule sont cruciales pour l'activité est un concept important en chimie médicinale.



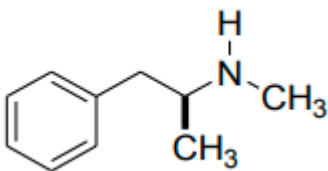
(2) Phénéthylamine (un neurotransmetteur)

Deux autres membres de la classe des phénéthylamines sont la pseudoéphédrine (3) et la méthamphétamine (4). La pseudoéphédrine est un diastéréoisomère de l'éphédrine et est un ingrédient commun dans les médicaments utilisés contre le rhume en vente libre. La marque populaire de médicaments contre le rhume Sudafed tire en partie son nom de la pseudoéphédrine. La disponibilité de la pseudoéphédrine dans les pharmacies en fait une

matière première de choix pour la production illégale de méthamphétamine. La méthamphétamine, souvent appelée simplement « meth », est un stimulant puissant qui crée une dépendance.



(3) décongestionnant à base de pseudoéphédrine



(4) stimulant à la méthamphétamine

Les propriétés stimulantes des phénéthylamines font de ces molécules d'excellents candidats pour les médicaments de régime et de fitness. En effet, un certain nombre de médicaments diététiques sont construits à partir de dérivés de la phénéthylamine. Deux La phentermine (5) et la fenfluramine (6) en sont des exemples. À la fin des années 1990, certains médecins ont commencé à en prescrivant conjointement la phentermine et la fenfluramine. La co-utilisation des deux médicaments a été appelée « fen-phen ». Le fen-phen était un médicament diététique très puissant et a rapidement gagné en popularité dans les communautés de nutrition. Malheureusement, certains patients prenant du fen-phen ont subi des dommages aux valves cardiaques, certains ont même décédé à cause de problèmes cardiaques.

Notion des effets secondaires

Les effets non désirés d'un médicament sont appelés effets indésirables ou effets secondaires. La gravité des effets indésirables peut varier de grave, y compris les lésions d'organes majeurs ou la mort, à légère, comme la somnolence ou la sécheresse de la bouche. Notez que les effets indésirables et les événements indésirables ne sont pas identiques. Un événement indésirable est tout événement observé au cours d'un essai

clinique. Un effet indésirable est un effet qui est statistiquement lié à l'utilisation du médicament. Par exemple, si un patient éprouve des maux de tête au cours d'un essai clinique, il s'agit d'un événement indésirable. Si des maux de tête étaient observés chez d'autres sujets d'essai à un taux statistiquement supérieur à celui du groupe de contrôle, alors le mal de tête serait classé comme un effet indésirable. Un effet secondaire est tout effet supplémentaire du médicament. Les effets secondaires peuvent comprendre des effets indésirables mais aussi des effets bénéfiques.

La co-administration de phentermine et de fenfluramine n'était pas une indication approuvée ou testée de ces médicaments. La pratique consistant à prescrire des médicaments de manière non approuvée est appelée « utilisation non conforme ». Cette utilisation est courante et souvent très bénéfique pour les patients, mais cette pratique comporte des risques accrus. Les premières recherches sur le fen-phen se sont concentrées sur l'utilisation non conforme à l'étiquette, l'idée étant que la combinaison des médicaments était à l'origine de l'effet indésirable. Des recherches ultérieures ont révélé que certains patients prenant de la fenfluramine seule développaient également des problèmes de valvules cardiaques. Même 15 ans après la découverte des problèmes du fen-phen, des poursuites judiciaires continuent encore d'être intentées contre le fabricant du fen-phen. La classe de médicaments à base de phénéthylamine comprend des composés ayant un certain nombre d'effets puissants. L'histoire de cette classe remonte à 5 000 ans, à la Chine ancienne et à la plante Ma Huang.