

Drogues à iridoïdes

Dr. Amal HELALI

Université Abou Bekr Belkaïd

Faculté de Médecine

Département de Pharmacie

E-mail : **amal.helali@univ-tlemcen.dz¹**

1.0 Décembre 2025

Table des matières

Objectifs	3
Introduction	4
I - Généralités sur les iridoïdes	5
1. Définition.....	5
2. État naturel et répartition.....	5
3. Structure chimique et classification	5
3.1. - Iridoïdes hétérosidiques.....	5
3.2. - Iridoïdes non hétérosidiques	6
3.3. - Séco-iridoïdes	6
4. Biogénèse	7
5. Extraction – Caractérisation	7
5.1. Extraction	7
5.2. Caractérisation.....	7
6. Propriétés pharmacologiques.....	8
7. Emplois.....	8
II - Drogues à iridoïdes	9
1. Harpagophyton : <i>Harpagophytum procubens</i> (Burch).	
Pedaliaceae.....	9
1.1. Drogue.....	9
1.2. Composition chimique	10
1.3. Essais.....	10
1.4. Propriétés pharmacologiques et emplois.....	10
2. Valériane officinale : <i>Valeriana officinalis</i> L.	
Valerianaceae.....	11
2.1. Drogue.....	11
2.2. Composition chimique	11
2.3. Essais.....	12
2.4. Propriétés pharmacologiques et emplois.....	12
3. Gentiane jaune : <i>Gentiana lutea</i> .	
Gentianaceae.....	13
3.1. Drogue.....	13
3.2. Composition chimique	14
3.3. Essais.....	14
3.4. Propriétés pharmacologiques et emplois.....	14

Objectifs

À l'issue du cours, l'étudiant sera capable de :

1. **Décrire** les iridoïdes, les séco-iridoïdes et les valépotriates.
2. **Reconnaître** les principales drogues à iridoïdes (harpagophyton, valériane, gentiane) et de relier leurs constituants à leurs emplois thérapeutiques et pharmaceutiques.

Introduction

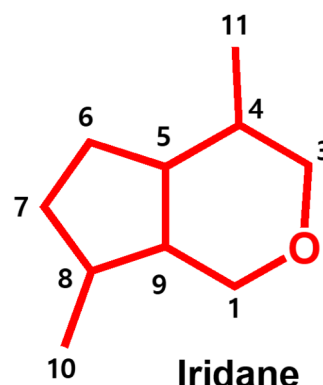
Les iridoïdes sont des métabolites secondaires appartenant à la grande famille des monoterpènes. Caractérisés par leur squelette cyclopentapyranique, ils sont largement répandus chez les plantes médicinales, notamment dans les familles des Gentianaceae, Valerianaceae et Pedaliaceae.

Bien que leur rôle thérapeutique soit plus restreint que celui d'autres composés naturels, ils présentent des propriétés pharmacologiques intéressantes (anti-inflammatoires, analgésiques, hypotensives, stimulantes digestives) et se retrouvent dans plusieurs drogues majeures de la pharmacopée (harpagophyton, valériane, gentiane).

I Généralités sur les iridoïdes

1. Définition

Les iridoïdes sont des composés naturels appartenant à la classe des monoterpènes. Ils sont caractérisés par un squelette **bicyclique** de type **cyclopentapyranique**, appelé **iridane**. Sont également inclus dans ce groupe, les séco-iridoïdes caractérisés par rupture de la liaison entre les carbones 7 et 8 du noyau cyclopentanique.



2. État naturel et répartition

À l'exception de quelques composés isolés chez les **insectes** (comme l'iridomyrmécine), les iridoïdes sont **exclusivement** présents chez les **plantes à fleurs** (Angiospermes), plus précisément les **dicotylédones gamopétales**. Les principales familles végétales contenant des iridoïdes sont : Oléacées, Valérianacées, Gentianacées, Loganiacées, Caprifoliacées, Rubiacées, Lamiacées, Scrofulariacées.

3. Structure chimique et classification

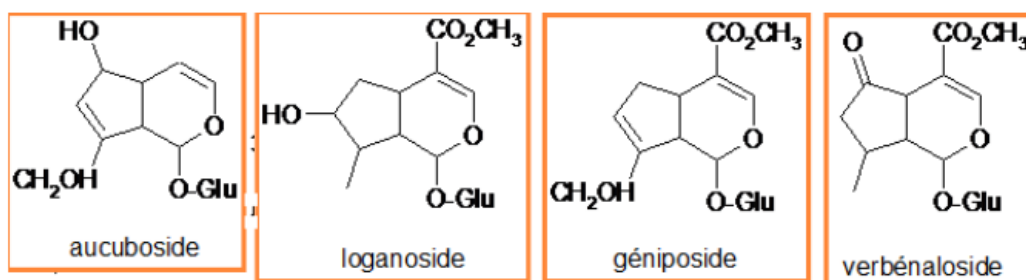
Chez les végétaux, les variations structurales des iridoïdes sont nombreuses (≈ 500 structures connues), on distingue :

3.1. - Iridoïdes hétérosidiques

les plus fréquents (≈ 300)

- La partie osidique est généralement constituée du glucose, rarement d'oligosaccharides
- La liaison hétérosidique s'établit en C1 de la génine. À l'exception de l'ébuloside des Caprifoliacées, où le glucose est lié à l'hydroxyméthyle en C11.

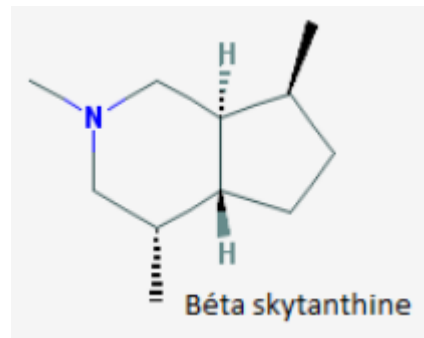
Des variations structurales peuvent exister : méthyle en C8 peut être hydrox-méthylé (aucuboside) ou époxydé. Une insaturation en 7 peut également exister (aucuboside, géniposide) ou hydrogénée (loganoside) et il y a possibilité d'oxydation du C6 (aucuboside, verbénaloside).



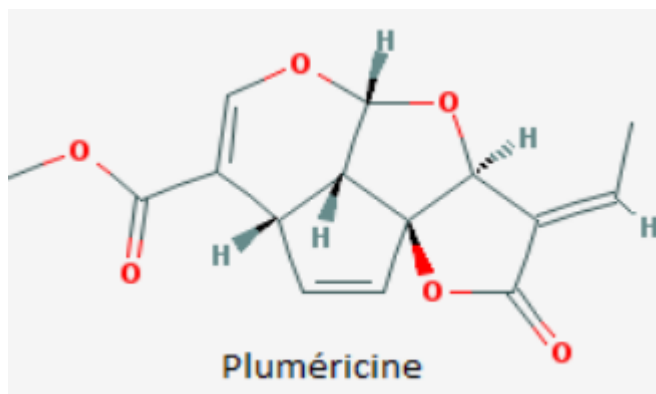
3.2. - Iridoïdes non hétérosidiques

Moins fréquents (≈ 100), peuvent être :

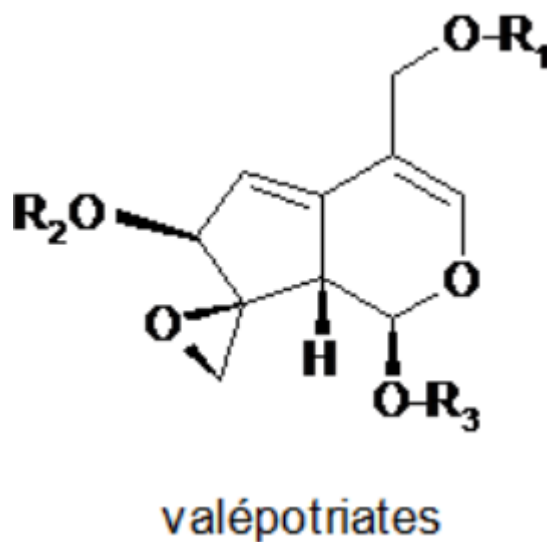
a) Alcaloïdiques



b) Polycycliques



c) Esters +++

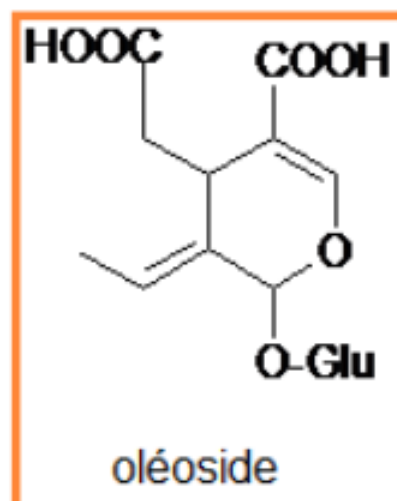
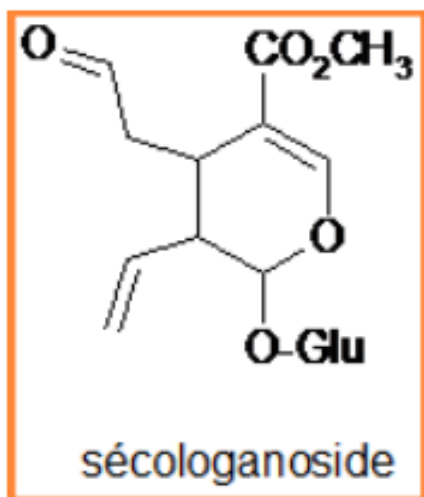


3.3. - Séco-iridoïdes

Caractérisés par la rupture de la liaison 7,8 du noyau cyclopentanique.

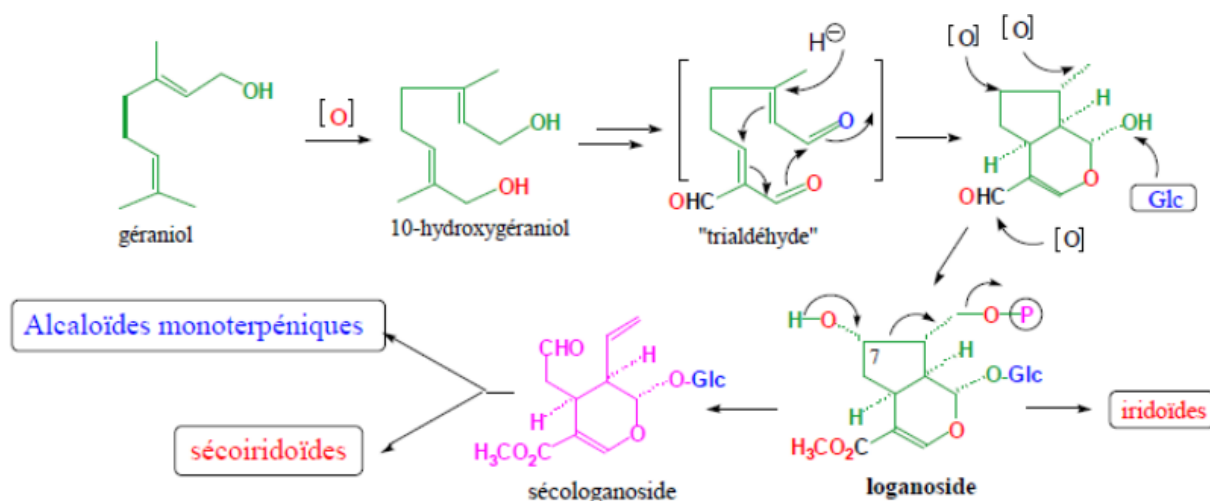
En majorité sous forme d'hétérosides (les sécoiridoïdes non hétérosidiques sont exceptionnels) avec des variations structurales :

- Un groupe vinyle en C9 (sécologanoside)
- Un groupe éthyldiène (oléoside)



4. Biogénèse

La biosynthèse commence par l'oxydation du **géraniol** jusqu'au trialdéhyde, qui se cyclise en **iridodial**. Celui-ci, après glucosylation et oxydation, donne le **loganoside**, précurseur des iridoïdes. L'ouverture du cycle donne le **sécologanoside**, précurseur des séco-iridoïdes et des alcaloïdes indolomonoterpéniques



5. Extraction – Caractérisation

5.1. Extraction

L'extraction est réalisée à l'aide de solvants polaires, généralement des alcools de titre variable. Une première séparation peut être obtenue par réextraction du résidu extractif dissous dans l'eau, en utilisant des solvants non miscibles de polarité croissante. Le fractionnement et la purification des composés extraits se font ensuite par chromatographie liquide sur colonne, ou encore par HPLC préparative.

5.2. Caractérisation

La détection des iridoïdes et des séco-iridoïdes dans une drogue végétale peut être réalisée à l'aide du réactif de Trim & Hill, une solution de sulfate de cuivre dans de l'acide chlorhydrique dilué, qui provoque la formation d'un précipité brun-noir. En chromatographie sur couche mince (CCM), il n'existe pas de réactifs spécifiques pour leur révélation ; on utilise généralement des révélateurs non spécifiques tels que la vanilline sulfurique ou l'acide chlorhydrique à chaud.

6. Propriétés pharmacologiques

À ce jour, les drogues contenant des iridoïdes ne constituent pas une source majeure de principes actifs, mais certaines de ces substances présentent néanmoins des activités pharmacologiques intéressantes. On leur attribue notamment une activité :

- anti-inflammatoire, surtout par voie locale (aucuboside, verbénaloside, loganoside),
- analgésique (harpagoside).
- hypotensive liée à l'inhibition de l'enzyme de conversion de l'angiotensine (oleuropéoside, oléacéine),
- antimicrobienne (pluméricine),
- laxative (géniposide, aspéruloside)
- Ou encore diurétique (catalpol).

7. Emplois

Les drogues à iridoïdes sont surtout utilisées :

- En **phytothérapie** (harpagophyton, olivier, bouillon blanc, plantains, verveine officinale, frêne),
- **Préparation d'extraits** entrant dans des spécialités pharmaceutiques (valériane officinale),
- En **liquoristerie** (gentiane jaune, petite centaurée).

II Drogues à iridoïdes

1. Harpagophyton : *Harpagophytum procubens* (Burch). Pedaliaceae

Espèce xérophile est endémique du sud de l'Afrique, notamment en Namibie et au Botswana. Elle se développe généralement sur des sols riches en oxydes de fer, caractéristiques des savanes semi-désertiques bordant le désert du Kalahari.

La plante

- Plante vivace, à tiges rampantes rayonnantes, à feuilles opposées,
- Grandes fleurs solitaires (4 à 6cm) dont le tube, jaune clair, s'évase en une corolle lobée d'un rouge violacé profond
- Fruit est une capsule ligneuse garnie d'aiguillons terminés par une couronne de crochets courbes et acérés.



Harpagophyton

1.1. Drogue

La drogue est constituée par les racines latérales tubérisées, découpées en rondelles pour faciliter le séchage (90% d'eau).

Caractères de la drogue :

Macroscopiquement, elles se présentent en fragments rétractés, ayant une forme d'éventail ou de rouelles rappelant l'aspect d'un champignon desséché, brun clair, enroulés sur les bords et marqués de stries radiales et concentriques.

Elle peut être grossièrement broyée en cossettes.

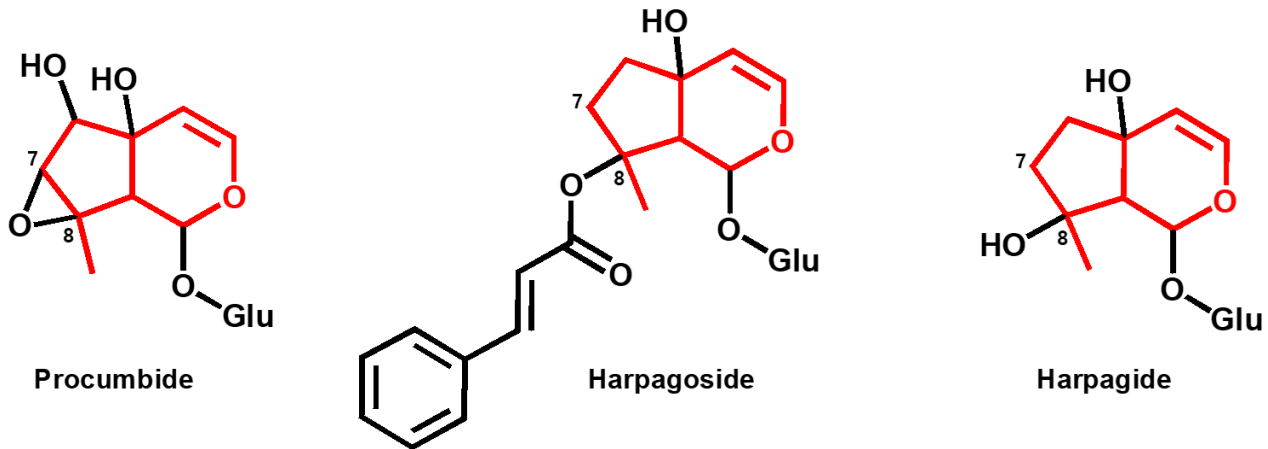
Sa saveur est particulièrement amère.



1.2. Composition chimique

Phytostérols, Polyphénols (flavonoïdes, acides-phénols, verbascoside).

Iridoïdes (≈2%) principaux PA, dont le constituant majoritaire est l'harpagoside (cinnamate d'harpagide), accompagné de procumbide.



1.3. Essais

Essai botanique :

- La drogue ne doit pas renfermer de fragments de racines primaires (fragments cylindriques bruns, stries longitudinalement).
- L'identification par l'examen microscopique de la poudre (fragments de parenchyme cortical à grandes cellules contenant parfois des inclusions granuleuses brun rouge et des gouttelettes jaunes, vaisseaux à épaississements et trachéides)

Essai physicochimique :

- Recherche de l'amidon (normalement absent),
- Caractérisation des iridoïdes (CCM sur extrait méthanolique)
- Dosage de l'harpagoside (>1,2% par HPCL après extraction par le méthanol).

1.4. Propriétés pharmacologiques et emplois

Traditionnellement, l'harpagophyton est utilisé pour traiter les désordres digestifs, les fièvres et pour soulager les douleurs des parturientes.

- L'extrait aqueux d'harpagophyton montre une activité anti-inflammatoire identique à celle de la phénylbutazone.
- L'utilisation prolongée de préparations d'harpagophyton serait efficace contre d'arthrose.
- L'harpagoside est analgésique.

2. Valériane officinale : *Valeriana officinalis* L. Valerianaceae

Plante largement répandue en Europe, notamment dans les bois humides et le long des cours d'eau. Elle est cultivée à des fins pharmaceutiques en France, en Belgique et en Allemagne. Les différentes sous-espèces présentent des caractéristiques morphologiques très similaires.

La Plante

- Grande herbe vivace par un rhizome plus ou moins stolonifère,
- Tiges creuses et cannelées portant des feuilles en rosette à la base, opposées sur la tige, pennatiséquées.
- Inflorescences cymeuses terminales
- Fleurs zygomorphes, pentamères, blanches ou rosées
- Fruit est un akène exalbuminé portant une aigrette plumeuse (pappus).



Valériane officinale

2.1. Drogue

La drogue est constituée des organes souterrains (rhizome, racines et stolons), soigneusement séchés à une température inférieure à 40°C afin d'éviter leur noircissement. Inodore à l'état frais, elle développe rapidement une odeur désagréable lors de la dessiccation, due à la libération d'acide isovalérique.

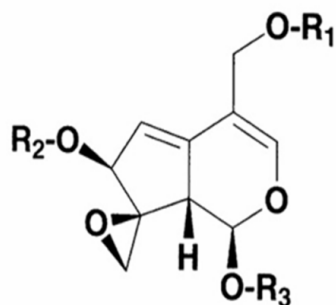


2.2. Composition chimique

La plante contient des **iridoïdes non hétérosidiques** (0,8 à 1,7 %), appelés valépotriates, des esters de triols dérivés de l'iridane, dont les principaux représentants sont le **valtrate** et l'**isovaltrate**. Ces composés se distinguent principalement par la nature des acides aliphatiques (acétique, isovalérique) qui estérifient les groupes hydroxyles en C1, C7 et C11.

On retrouve également :

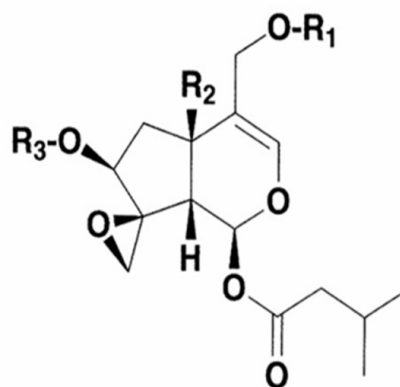
- Des alcaloïdes : actidinine
- Des huiles essentielles
- Des sesquiterpènes : acide valérénique et ses dérivés



$R_1 = \text{Ac}, R_2 = R_3 = \text{isoV}$: *valtrate*

$R_1 = R_3 = \text{isoV}, R_2 = \text{Ac}$: *isovaltrate*

$R_1 = \text{Ac}, R_2 = 3\text{-Ac-isoV}, R_3 = \text{isoV}$: *acévaltrate*



$R_1 = \text{Ac}, R_2 = \text{H}, R_3 = \text{isoV}$: *dihydrovaltrate*

$R_1 = 2\text{-isoV-isoV}, R_2 = \text{OH}, R_3 = \text{Ac}$: *IVHD*

2.3. Essais

Essai botanique : permet d'éliminer les falsifications toujours possibles par d'autres valérianacées (valériane de l'Inde, valériane rouge).

Essai physico-chimique :

- Caractérisation des iridoïdes sur un extrait au dichlorométhane, les valépotriates donnent une coloration bleue en milieu acéto-chlorhydrique.
- CCM du même extrait permet de mettre en évidence les sesquiterpènes et les valépotriates.
- Évaluation de la matière extractible dans l'éthanol dilué (>15%),
- Dosage des cendres sulfuriques (<15%),
- Dosage des cendres insolubles dans l'acide chlorhydrique (<7%),
- Dosage de l'huile essentielle (>5ml/kg).

2.4. Propriétés pharmacologiques et emplois

L'activité tranquillisante modérée de la valériane est liée à la présence conjointe de valépotriates et de sesquiterpènes.

En phytothérapie, elle est utilisée pour soulager les états neurotoniques chez l'adulte et l'enfant, notamment en cas de troubles mineurs du sommeil.

- L'extrait sec est obtenu par lixiviation à l'éthanol à 60°, puis séché par nébulisation à une température inférieure à 50°C.
- Les valépotriates isolés sont également proposés dans la prise en charge des troubles psychosomatiques, de l'anxiété, du stress et des difficultés de concentration.

3. Gentiane jaune : *Gentiana lutea*. Gentianaceae

Espèce fréquente des zones montagneuses européennes, elle pousse généralement entre 1000 et 2500 mètres d'altitude.

La plante

- Grande herbe robuste (1-1,5 m), vivace par une souche,
- Grandes feuilles parallélinerves, opposées-décussées, embarrassantes au sommet de la tige,
- Fleurs jaune d'or groupées en pseudo-verticilles à l'aisselle des feuilles.



Gentiane jaune

3.1. Drogue

Constituée par des racines ridées, dures, robustes, sillonnées longitudinalement, à cassure nette, jaune plus ou moins rougeâtre mais non brune. La saveur est très amère.

La gentiane jaune est cultivée sans difficultés même à basse altitude.

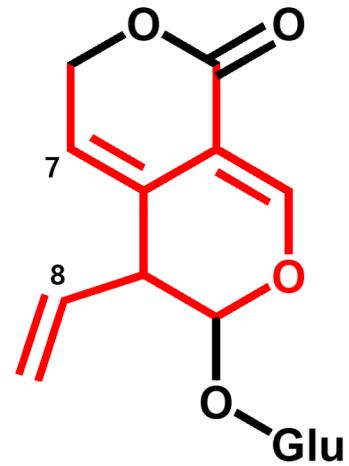
La récolte ne peut intervenir qu'après 7-10 ans.

La majeure partie de la drogue provient encore de l'arrachage de plantes sauvages.



3.2. Composition chimique

- Glucides abondants (pectine, oligosaccharides).
- Xanthones (gentisine) responsable de la coloration jaune,
- Phytostérols, acides-phénols.
- **Séco-iridoïdes** (2-3%) à l'origine de l'amertume (gentiopicroside, amarogentioside, esters du sweroside et de la swertiamarine).



Gentiopicroside

3.3. Essais

Absence du rhizome de vétrate, *Veratrum album*, cette Liliacée très toxique (alcaloïdes), est en effet facilement confondue avec la gentiane (surtout avant la floraison).

- Pour être conforme, la drogue ne doit pas contenir d'autres gentianes (analyse en CCM d'un extrait méthanolique) ;
- L'indice d'amertume est déterminé par rapport à celui de la quinine.
- Matières extractibles par l'eau $\geq 33\%$.

3.4. Propriétés pharmacologiques et emplois

- Les séco-iridoïdes présents dans cette drogue exercent une action stimulante, par voie réflexe, sur la motilité gastrique ainsi que sur les sécrétions salivaires et gastriques.
- En phytothérapie, elle est utilisée comme tonique et apéritif, notamment en cas de douleurs gastriques et d'anorexie, mais reste contre-indiquée en présence d'ulcères gastroduodénaux.
- Dans l'industrie des liqueurs, les racines sont lavées, épluchées, coupées puis empilées et séchées lentement, de manière à permettre une fermentation qui favorise le développement de l'arôme et de la couleur.