

LES FORMES GALÉNIQUES

INTRODUCTION

- Les excipients : **INACTIFS** pharmacologiquement
- Constitution du médicament : **forme galénique** (SA et excipients) et **conditionnement** (primaire ou secondaire)
- Choix de la forme galénique dépend de la voie d'administration, de l'effet thérapeutique attendu, du patient, et des propriétés physico-chimiques de la SA.

VOIE D'ADMINISTRATION ENTÉRALE

- Voie Orale : la plus utilisée (**60%** des médicaments)

Différentes formes dans cette voie :

- forme orales sèches (elles même divisées en formes sèches pulvérentes et compactes)
 - préparation liquide
 - préparations buccales
-
- Voie Rectale

VOIE ORALE

FORMES ORALES SÈCHES

VOIE ORALE : FORMES ORALES SÈCHES

Dans les formes sèches **pulvérautes**, on trouve les poudres et les granulés.

❖ Les poudres

SA et excipients (diluants, lubrifiants, édulcorant, aromatisant)

❖ Les granulés

- Grains solide secs formant chacun un **agrégat de particules de poudre**

Différentes catégories de granulés : libération modifiée, effervescents, enrobés, gastro-résistants.

VOIE ORALE : FORMES ORALES SÈCHES

Conditionnement primaire des poudres et granulés

- **Unidose**
 - le plus répandu
 - facilité de prise
 - sécurité de dose et de prise (pas de contamination)
 - meilleure conservation
- **Multidose :**
 - utilisable pour plusieurs prises
 - nécessite un dispositif de dosage

Les poudres et les granulés peuvent être compactés en comprimés ou mis en gélules.

VOIE ORALE : FORMES ORALES SÈCHES

Dans les formes sèches **compactes**, on trouve les comprimés :

- Solides
- 1 unité de prise d'une ou plusieurs SA
- Obtenus par **compression** d'un volume constant de particules ou de grains, ou par **cryodessiccation**
- Contiennent des excipients

Il faut bien vérifier leurs résistance mécanique (effritement)

Ils peuvent posséder une ligne de cassure

Différents types de libération : retardée, séquentielle ou prolongée.



VOIE ORALE : FORMES ORALES SÈCHES

- Il existe un contrôle galénique stricte basé sur différents critères :
 - Uniformité de masse
 - Uniformité de teneur
 - Temps de désagrégation
 - Test de dissolution
 - Test de sécabilité
 - Friabilité des non enrobés
 - Résistance à la rupture (dureté)
- Catégories de comprimés :
 - Enrobés (< 30 min à 37°C)
 - Non enrobés (< 15 min à 37°C)
 - Effervescents (< 5 min à 25°C)
 - Gastro-résistants
 - Libération modifiée

VOIE ORALE : FORMES ORALES SÈCHES

- Avantages

- Dosage précis
- Grande quantité dans un volume réduit
- Possibilité d'administrer des substances peu solubles dans l'eau
- Prix de revient peu élevé
- Enrobage possible

- Inconvénients

- **Irritants**
- Impossible pour les substances liquides
- Réalisation complexes

VOIE ORALE : FORMES ORALES SÈCHES

- **Les capsules**

Elles contiennent une dose **unitaire** de SA, elles se dégradent dans le sucs gastrique et ce sont des préparations solides. Temps de désagrégation : **30 min à 37°C**.

Il en existe de 2 types :

- ❖ Gélule

- Enveloppe **dure**
- Contenu solide



- ❖ Capsule Molle

- Enveloppe **molle**
- Contenu liquide ou solide (rare)

VOIE ORALE : FORMES ORALES SÈCHES

- Avantages

- Préparations officinales ou hospitalières
- Réalisation aisée et manuelle
- Utilisation simple
- Utilisée pour les essais cliniques
- Utiles pour les médicaments issus de plantes

- Inconvénients

- Pas d'adaptation de la posologie
- Risque **d'adhésion**

VOIE ORALE

PRÉPARATIONS LIQUIDES

VOIE ORALE : PRÉPARATIONS LIQUIDES

- Solutions, émulsions (risque de séparation de phase) ou suspensions (risque de sédimentation)
- Conditionnement primaire est soit :
 - **Unidose** : ampoule en verre brun (SA photosensible)
 - **Multidose** : flacon (en verre) et dispositif d'administration

Exemple du sirop

Préparation aqueuse de consistance visqueuse et de **savoir sucrée** (attention ne contient pas forcément du sucre).

Concentration en saccharose doit être **> 45%** masse/masse, si on est au dessus de **65%**, il n'y a pas besoin de conservateurs.

VOIE ORALE

PRÉPARATIONS BUCCALES

VOIE ORALE : PRÉPARATIONS BUCCALES

- **Les préparations buccales** sont liquide, semi-solide ou solide, elles ont une action **locale** ou **systémique**.

- ❖ Action locale

- Préparations gingivales
- Préparations oro-pharyngées
- *Préparations muco-adhésives*

- ❖ Action systémique

- Préparations sublinguales
- *Préparations muco-adhésives*

VOIE RECTALE

VOIE RECTALE

- Action **locale** ou **systemique**
- Possibilité de l'utiliser à des fins **diagnostiques**
- Différents contrôles et catégories

Exemple du suppositoire

Préparation unidose solide, fond à **37°C**. Il s'insère par la partie **plane** !



VOIE D'ADMINISTRATION PARENTÉRALE

- Obligatoirement **stérile**
- Excipients assurent **l'isotonie** au sang et un **pouvoir tampon**
- Homogène et **non** toxique
- Contenant transparent

PRÉPARATIONS INJECTABLES

- Solutions, émulsion ou suspensions
- Eau **ppi**
- Exemptes de particules visibles, contrôle du nombre de particule non visibles
- Si le conditionnement est **unidose**, pas besoin de conservateur
- Jamais de conservateurs pour les voies **intra-rachidienne** et **oculaire**
- BPF : pas d'organismes vivants, pas d'entotoxines bactériennes et de substances pyrogènes, pH entre **3 et 9**, isotonie au plasma.

PRÉPARATIONS POUR PERFUSION

- Solutions ou émulsions (**pas de suspensions**)
- Administrée en **grand** volume
- Exemptes de particules visibles et non visibles
- **Pas** de conservateurs



GELS INJECTABLES ET IMPLANTS

❖ Gels injectables

La **viscosité** est étudiée pour libérer le PA au niveau du site d'injection (ex acide hyaluronique)

❖ Implants

Action **longue** durée (ex anti-cancéreux)

PRÉPARATION CUTANÉES

- Action locale, systémique (transdermique) ou émolliente (hydratation), protectrice (UV)
- Homogènes mais pas forcément stériles
- Les excipients peuvent avoir un effet

PRÉPARATIONS SEMI-SOLIDES (ACTION LOCALE)

- Pommades : **monophases**

Hydrophiles, hydrophobes ou absorbant l'eau

- Crèmes : **multiphases**

Lipophiles ou hydrophiles

- Gels

Lipophiles (rare) ou hydrophiles

- Pâtes

Préparation contenant une forte proportion de poudre (>40%)

- Cataplasme

Excipient **hydrophile** retenant la chaleur

PRÉPARATIONS LIQUIDES ET DISPOSITIFS CUTANÉS (ACTION LOCALE)

- Préparations liquides

Solution, émulsion ou suspension

Homogène

- Dispositifs cutanés

Souples, PA doit être absorbé lentement

Ex : pansement EMLA



DISPOSITIFS TRANSDERMIQUES (ACTION SYSTÉMIQUE)

- Patch, souple
- Sur une peau non lésée
- Substance libérée dans la circulation générale
- Très utilisé en **cancérologie**
- Action prolongée, quantité constante de PA, pas d'EPH, favorise l'observance

PRÉPARATIONS OPHTALMIQUES

- Liquides, semi-solides, solides
- Stériles
- Action locale

COLLYRES, SOLUTIONS POUR LAVAGE OPHTALMIQUE, PRÉPARATIONS SEMI-SOLIDES ET INSERTS

- Collyres

Solutions, émulsions ou suspensions, aqueuse ou huileuse

En récipient **multidose**, conservateur pour avoir une stérilité pendant **4 semaines**

- Solutions pour lavage ophtalmique

Contenance max de **200mL**

- Préparations semi-solides

Homogènes

- Inserts ophtalmiques

Réservoir de SA dans une **matrice** (membrane)

Action **longue** avec une libération progressive

L'implant doit disparaître au bout d'un certain temps

PRÉPARATIONS PULMONAIRES

- En général on recherche une action **locale** mais parfois action systémique.
- Les molécules sont principalement des **corticoïdes** (diminuent l'inflammation) et des **béta2-stimulants** (dilatation des bronches)
- Contrôle de la taille des particules (**<5microns**) et de la contamination particulaire externe.

PRÉPARATIONS LIQUIDES POUR INHALATION

- Nébuliseur
 - Utilisation **passive**
 - Contraignant (port masque)
 - En **continu** ou à valve doseuse
 - Solutions, suspensions ou émulsions
- Inhalateur pressurisé
 - Utilisation **active**
 - Court
 - **Compliqué** pour l'enfant
 - Solutions, suspensions ou émulsions



POUDRES POUR INHALATION

- **Solides**
- Administrées par un inhalateur à poudre unidose ou multidose
- Inspiration poudre active la libération de la poudre

PRÉPARATIONS VAGINALES

- Liquides, semi-solides, solides
- Action locale
- En général hormonale ou antifongique

PRÉPARATIONS AURICULAIRES

- Liquides, semi-solides ou solides
- Unidose ou multidose
- Pas forcément stérile