



# Galénique (fin)

## I. FORMES A LIBERATION MODIFIEE

### A. LIBERATION ACCELEREE

Concerne surtout la **voie orale**.

**Dissolution plus rapide** de la forme pharmaceutique grâce à la formulation :

- modification du pH pour augmenter la vitesse de dissolution
- comprimés effervescents (se désagrègent dans l'eau en moins de 5 min)
- lyophilisat (se remet rapidement en solution)
- comprimé imprimé en 3D se dissout très vite
- comprimés orodispersibles (délitant spécifique, désagrégation par salive)

**Désagrégation plus rapide** de la forme pharmaceutique grâce au :

- Délitant spécifique = désagrégation flash avec la salive (comprimé orodispersible)

On aboutit à une solution plus rapidement pour accélérer l'absorption.

### B. LIBERATION DIFFEREE (= RETARDEE)

**On ralentit la vitesse de dissolution** de la SA (on utilise des suspensions, solutions moins solubles / *exemple suspension d'insuline pour voie parentérale*).

Pour cela on prend des excipients contrôlant la libération de la SA :

- pour les formes parentérales : solvant huileux injectable en IM
- pour les formes orales : diffusion contrôlée ou libération pulsée

### C. LIBERATION PROLONGEE :

**Le PA est libéré en continu.**

- **Formes enrobées** : membrane entourant une forme à libération immédiate. *La membrane devient poreuse en fonction du pH ou du temps dans l'organisme. Plus elle est poreuse plus le PA est libéré.*

- **Formes matricielles** : contiennent des polymères hydrophiles, minéraux ou lipidiques, c'est une matrice contenant le PA.

- **Système Oros** : réservoir de SA + compartiment polymérique sans SA dans lequel l'eau rentre pour pousser le PA hors de son réservoir par pression osmotique.

La forme la plus utilisée et la forme à libération prolongée.

L'intérêt de ces formes est de diminuer le nombre de prise.

On contrôle : la dissolution du PA dans le temps et son dosage dans le produit fini.

## II. FORMES A LIBERATION MODULEE (VECTORISATION)

Elles sont administrées par **voie parentérale**.

**La distribution est strictement ciblée sur le site d'action** (organe, cellule).

**Impérativement stérile.**

Vectorisation de la SA grâce à :

- **Microparticules** (10-100  $\mu\text{m}$ ) : microsphères, microcapsules, liposomes.
- **Nanoparticules** (10-100 nm) : nanosphères, nanocapsules, liposomes.

Système de vectorisation :

- on place notre SA dans un liposome (bicouche lipidique) = vecteur de récepteurs cellulaires  
- fixation d'un anticorps spécifique sur le vecteur, permettant de reconnaître une cellule cible

- la SA est protégée entre l'administration et le site d'action

- gain en effet thérapeutique avec une moindre toxicité.

*Surtout utilisé en cancérologie :*

*On place notre SA sous forme de micro ou nano particule dans un liposome. Elle ne peut alors pas agir tant qu'elle n'est pas libérée.*

*Le liposome hydrosoluble circule dans le sang à la recherche d'antigène complémentaire de ses anticorps. Lorsqu'il reconnaît un Ag sur une cellule cancéreuse, il s'y fixe, le PA est alors libéré et la cellule est détruite.*

Cette méthode a l'avantage de ne pas détruire les autres cellules se répliquant rapidement (leucocytes...) puisque **l'action est ciblée**.

**L'inconvénient est le coût.**

On contrôle :

- la dissolution de la SA en fonction du temps
- le dosage (pourcentage de SA encapsulée)
- la stérilité.

Formes LP (Libération Prolongée)	Vecteurs
• Diminution du nombre de prises: meilleure <b>observance</b>	• <b>Toxicité plus faible</b> (moins d'effets secondaires) et <b>efficacité thérapeutique</b> supérieure car l'action est ciblée
• Concentration plasmatique constante: <b>pas d'effet toxique</b>	• <b>Protection de la SA</b> entre administration et site d'action (liposome)