

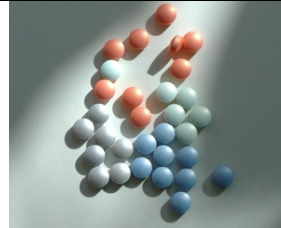


Les comprimés

Voie Orale



Définition



- Les **comprimés** sont des préparations solides contenant une unité de prise d'une ou plusieurs substances actives. Ils sont obtenus:
 - en agglomérant par **compression** un volume constant de particules
 - ou par cryodessiccation (= **lyophilisation**).
- Cylindre droit avec faces plates ou convexes et bords biseautés, barres de cassures, un sigle ou une autre marque; peut être enrobé.

Composition

- Les particules (poudre ou grain) sont constituées d'une substance(s) active(s) ± excipients:
 - diluant(s): 20-90%,
 - liant(s): 5-10%,
 - désagrégant(s) ou délitant(s): 5-10%,
 - agent(s) d'écoulement: 0.5-1%,
 - lubrifiant(s): 1-5%,
 - composés pouvant modifier le comportement de la préparation dans le tube digestif: variable,
 - colorants, aromatisants: ~1%.

Production et contrôle des comprimés

- Les comprimés sont généralement fabriqués par **compression** d'un volume constant de particules ou d'agrégats obtenus par des méthodes de **granulation**: granulation humide, granulation sèche, compression directe.
- Résistance mécanique suffisante pour ne pas s'effriter ou se briser lors de manipulations ou d'étapes de production ultérieures.



- Sécabilité des comprimés: masse des $\frac{1}{2}$ comprimés ou dosage



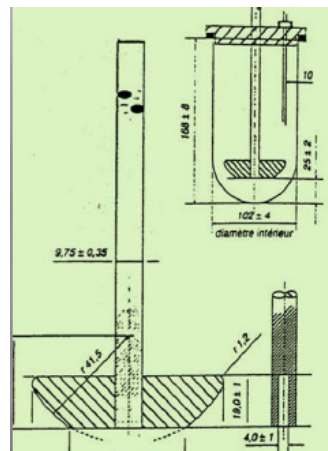
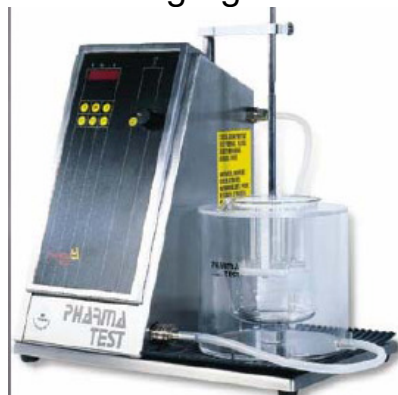
- Mesure de la friabilité des comprimés non enrobés



- Mesure de la résistance à la rupture des comprimés = dureté des comprimés

Essais sur les comprimés

- Uniformité de masse ou uniformité de teneur
- Dissolution pour démontrer que la libération de la ou des substances actives est satisfaisante,
- Et/ou désagrégation:

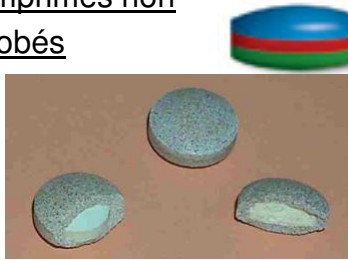






Catégories de comprimés Voie Orale

- Comprimés non enrobés,
 - Comprimés enrobés,
 - Comprimés effervescents,
 - Comprimés solubles,
 - Comprimés dispersibles,
 - Comprimés orodispersibles,
 - Comprimés gastro-résistants,
 - Comprimés à libération modifiée,
 - Comprimés à utiliser dans la cavité buccale,
 - Lyophilisats oraux.
- Ils sont avalés ou croqués, d'autres sont dissous ou désagrégés dans de l'eau avant administration, certains, enfin, doivent séjourner dans la bouche pour y libérer la substance active.

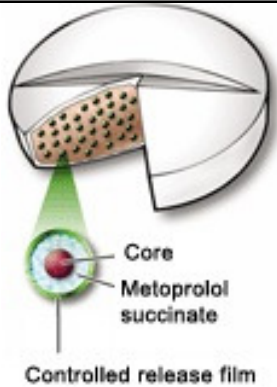
- Comprimés non enrobés


- Comprimés enrobés (ex: pelliculés)

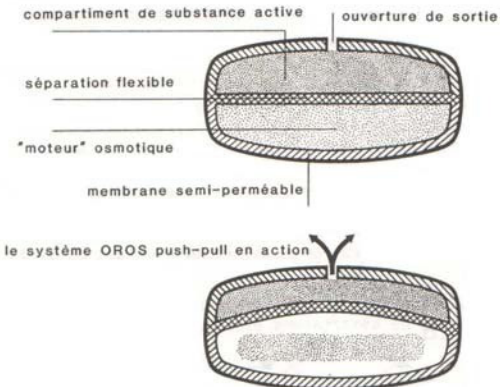

- Comprimés effervescents:
désagrégation <5 min à 25°C


- Comprimés gastro-résistants:
pas de désagrégation au moins 1 h dans HCl 0,1 M et désagrégation à pH 6,8.


exemples de comprimés à libération prolongée, retardée ou séquentielle



Core
Metoprolol succinate
Controlled release film



compartiment de substance active ouverture de sortie
séparation flexible
moteur osmotique
membrane semi-perméable
le système OROS push-pull en action



Avantages de la forme Comprimés

- Dosage par unité de prise précis
- Substances actives en milieu sec et concentré → favorable à la conservation
- Administration de substances peu ou insolubles dans eau
- Administration d'une grande quantité de substances actives dans un volume réduit
- Emploi facile
- Fabrication industrielle à grande échelle → prix de revient peu élevé
- Enrobage pour masquer saveur désagréable.

Inconvénients forme Comprimé

- Potentiellement irritants pour la muqueuse du tractus gastro-intestinal
- Compression de substances actives liquides impossible
- Mise au point délicate.

Les capsules voie orale



Définition



- Les capsules sont des préparations solides constituées d'une enveloppe dure préfabriquée (=gélules) ou molle, de forme et de capacité variables, contenant généralement une dose unitaire de substance(s) active(s).
- Les capsules se désagrègent dans le suc gastrique

- L'enveloppe est à base de gélatine le plus souvent (ou HydroxyPropylMéthylCellulose pour les gélules) ± de glycérol ou de sorbitol. Des agents tensioactifs, des opacifiants, des conservateurs antimicrobiens, des édulcorants, des colorants et des aromatisants peuvent également être ajoutés.
- Contenu des capsules peut être solide, liquide ou de consistance pâteuse

