

FORMES À LIBÉRATION MODIFIÉES

▶ Libération accélérée

Concerne surtout la **voie orale**.

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

- **Modification du pH** pour augmenter la vitesse de dissolution de la SA
- **Comprimés effervescents**
- **Lyophilisat** (se remet rapidement en solution)
- **Comprimé imprimé en 3D** se dissout très vite

Désagrégation de la forme pharmaceutique plus rapide grâce au:

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

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

FORMES À LIBÉRATION MODIFIÉES

► Libération différée (=retardée)

Diminuer la vitesse de dissolution de la SA:

Suspension d'insuline pour voie parentérale

Excipients contrôlant la libération de la SA pour formes parentérales:

Solvant huileux pour une forme injectable IM.

Excipients contrôlant la libération de la SA pour formes orales (et parentérales):

- Par diffusion contrôlée
- Par libération pulsée (formes coloniques)

FORMES À LIBÉRATION MODIFIÉES

► Libération prolongée

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

Système OROS : réservoir de SA + compartiment polymérique sans SA

FORMES À LIBÉRATION MODIFIÉES

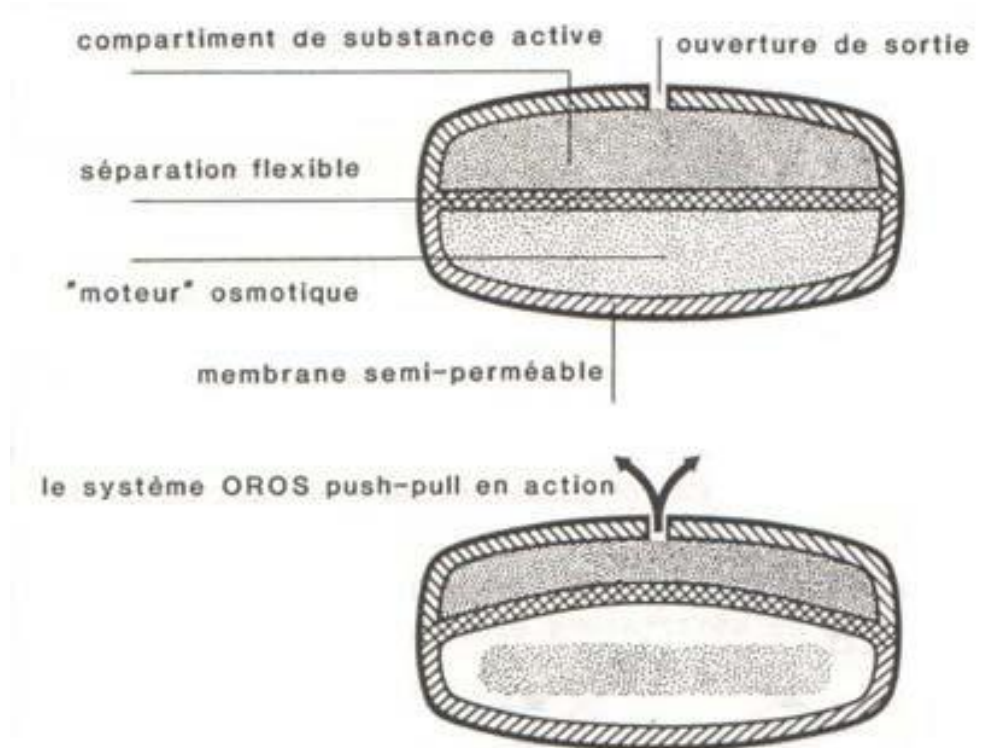
► Système OROS (Oral Osmotic System)

Basé sur la pression osmotique.

Les comprimés sont constitués d'un noyau à deux compartiments (un **compartiment avec le principe actif** + un compartiment faisant office de « **moteur osmotique** »).

Le noyau est entouré d'une **membrane semi-perméable** percée d'un **orifice**.

La **pénétration d'eau dans le noyau** génère une pression osmotique permettant l'expulsion du principe actif à travers l'orifice de **sortie à vitesse constante**.



FORMES À LIBÉRATION MODIFIÉE

► Exemples libération prolongée

- Insert ophtalmique
- Dispositif transdermique
- Microgranules →



Microgranules dispersées ou dans gélules

FORMES À LIBÉRATION MODIFIÉES

► Libération différée / Libération prolongée

La forme la plus utilisée est 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**
- **Son dosage dans le produit fini**

FORMES À LIBÉRATION MODULÉES

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 μm)** : microsphères, microcapsules, liposomes.
- **Nanoparticules (10-100 nm)** : nanosphères, nanocapsules, liposomes.

Inconvénient : coût élevé

FORMES À LIBÉRATION MODULÉES

Vectorisation

1. On place notre **SA dans un liposome** (bicouche lipidique) = vecteur de récepteurs cellulaire sous forme de nano ou micro particule
2. Fixation d'un **anticorps spécifique** sur le vecteur, permet l'accrochage sur la membrane de la **cellule cible** (= ciblage)
3. Le SA est **libéré** lorsque le vecteur se **fixe** à la cible

RÉCAP' INTÉRÊTS

Formes LP (Libération Prolongée)	Vecteurs
<ul style="list-style-type: none">• Diminution du nombre de prises: meilleure observance	<ul style="list-style-type: none">• Toxicité plus faible (moins d'effets secondaires) et efficacité thérapeutique supérieure car l'action est ciblée
<ul style="list-style-type: none">• Concentration plasmatique constante: pas d'effet toxique	<ul style="list-style-type: none">• Protection de la SA entre administration et site d'action (liposome)