

Les Formes Galéniques

O'SHUN

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 **pulvéraentes**, 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 **cryodessication**
- Contiennent des excipients

Il faut bien vérifier leur 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)
- Utilise pour les substances peu solubles dans l'eau et les liquides biologiques

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

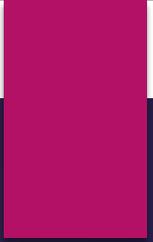
Voie orale : préparations liquides

- ▶ 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 **saveur 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

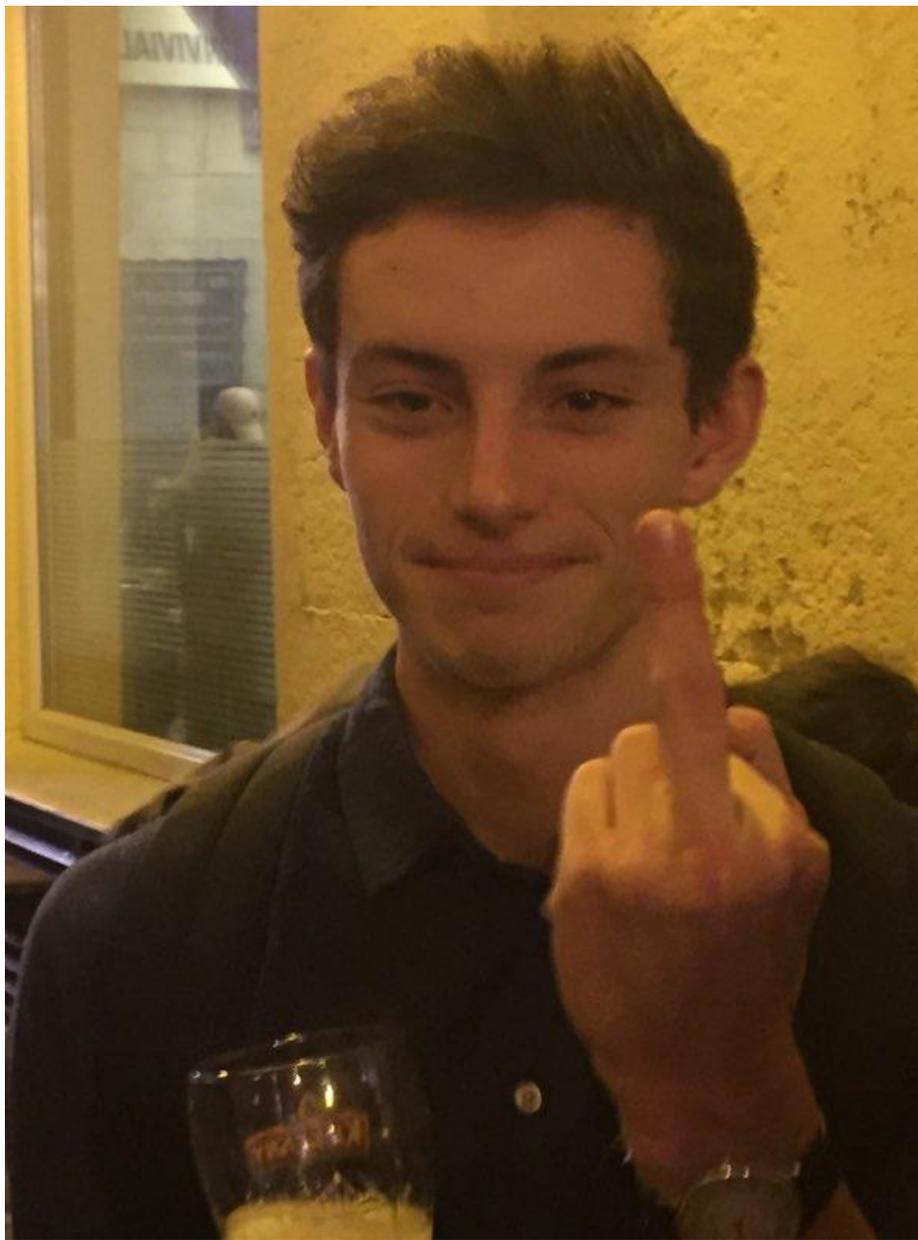
- ▶ Action **locale** ou **systémique**
- ▶ Possibilité de l'utiliser à des fins **diagnostiques**
- ▶ Différents contrôles et catégories

Exemple du suppositoire

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



**Parcequ'on adore les dentaires,
et surtout vos tuteurs d'UE13
et d'UE4 !**



Et on dit FUCKKKKK le concours !



**Votre appart a besoin d'un coup de propre ?
Appelez Vava au 06-82.....**

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