

Les formes pharmaceutiques

Claire CHAPUIS

Pharmacien

CHU de Grenoble

Objectifs généraux :

L'étudiant doit :

- Connaitre les différentes voies d'administration et comprendre le choix de la forme pharmaceutique ;
- Comprendre la notion d'osmolarité des solutions injectables et les conséquences ;
- Connaître la définition de la DCI.

Objectifs opérationnels :

- Nommer les différentes voies d'administration des médicaments
- Expliquer la différence entre voie entérale et voie parentérale
- Identifier les formes galéniques pour chaque voie d'administration
- Citer les avantages et les inconvénients des différentes formes pharmaceutiques
- Citer les autres voies systémiques et locales
- Énoncer les différentes origines des médicaments

Plan du cours

- Définitions
- Choix de la forme pharmaceutique
- Formes orales
 - Solides
 - Liquides
- Formes pour voie parentérale
- Autres formes pour voies systémiques
 - Sublinguale
 - Rectale
 - Transdermique
- Formes locales
 - Oculaire
 - Vaginale
 - Pulmonaire
 - Cutanée

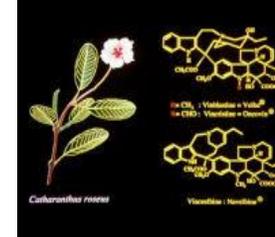
Définition

- **Forme galénique = forme pharmaceutique**
Forme sous laquelle sont associés principes actifs et excipients pour constituer un médicament
- Claude Galien, médecin grec
- **Médicament** = PA(s) + excipient(s) + conditionnement
- **AMM**: étude de composition, de forme et de présentation



Définition (2)

- **PA:** substance douée de propriétés pharmacologiques et à la base de l'effet thérapeutique



- **Excipient:** sans action pharmacologique mais nécessaire à la fabrication, administration ou conservation (ex: solvant pour une préparation injectable)
- **Conditionnement:** destiné à contenir le médicament et à le protéger de l'environnement extérieur (flacon, pilulier, « blister »,...)



Conditionnement primaire



Conditionnement secondaire

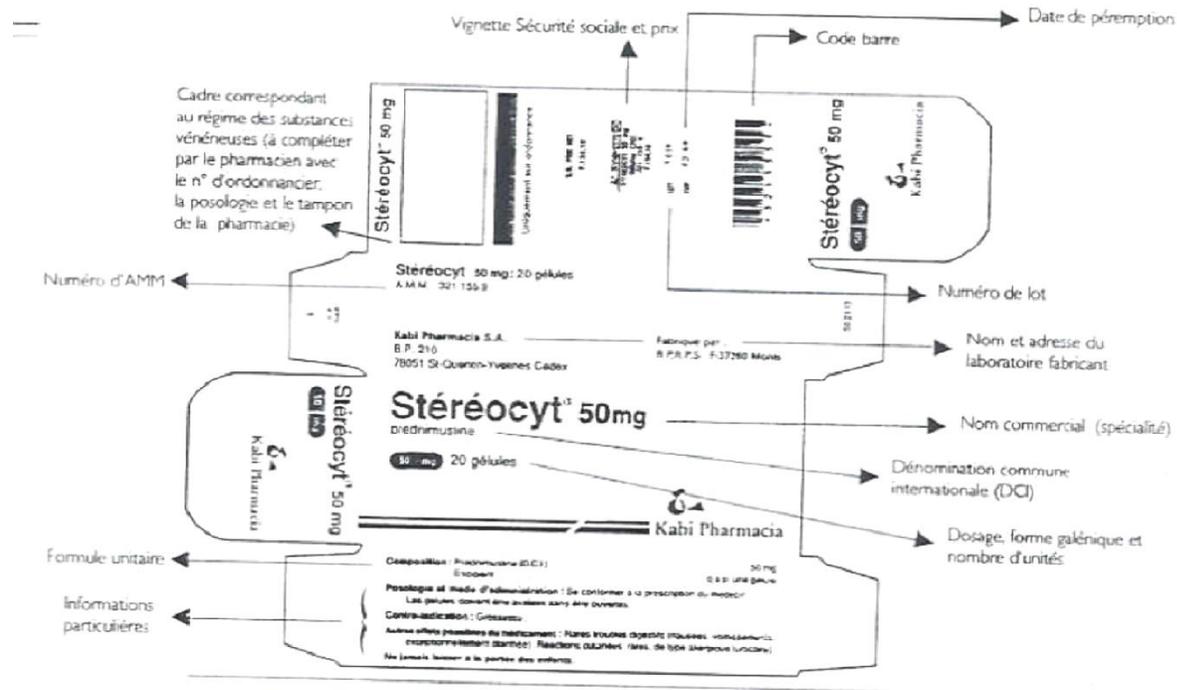


Schéma 1.4 Exemple d'emballage et d'étiquetage d'une spécialité pharmaceutique

Choix de la forme pharmaceutique

Il dépend de:

- **l'action recherchée** (locale/systemique)
- de la **rapidité d'action** (immédiate ou pas)
- de la **durée d'action** (courte/longue)
- de la **nature du PA**
(soluble/compressible/sensible aux UV...)
- du **patient** (enfant / adulte/ inconscient/
physiopathologie)
- de la **stratégie thérapeutique**
(dose unique / traitement chronique...)

Les formes orales (1)

- **AVANTAGES**
 - facilité d'administration
 - traitements ambulatoires
 - production industrielle facile
- **INCONVENIENTS**
 - passage par le système digestif: variabilité
 - réservé au patient conscient
 - délai d'action variable

Les formes orales (2) solides

- **Comprimés (tablets)**

- Nus (écrasables)
- Enrobés = recouverts de plusieurs couches de substances diverses
 - prise, action ou conservation améliorée(e)
 - ne pas écraser
- Sécables = fente pour fractionner
 - adaptation de la posologie à chaque patient
- A croquer
- A sucer
 - action locale, garder le + longtemps possible dans la bouche



Les formes orales (3) solides

- **Gélules**

- capsule à enveloppe dure
- contient une poudre ou des granules
- Parfois, possibilité d'ouvrir (SNG, mélange aliments...)



- **Capsules molles**

- Produit liquide ou pâteux



- **Forme à libération modifiée**

- Accélérée (effervescent, « lyocs »)
- Ralentie : **LP**, lib. répétée (double noyau)
- Retardée (enrobage gastro-résistant)



Modification de la vitesse de libération du PA (1)



1) Forme à libération accélérée:

absorption + rapide et + intense du PA

- **Comprimé effervescent:** se désagrège dans l'eau en dégageant du gaz carbonique

Attention à la teneur en sodium!

- « **Lyoc** »: lyophilisat oral ou comprimé dispersible obtenu par lyophilisation

- par voie orale après dissolution dans l'eau
- par voie sublinguale

ex: SPASFON LYOC®

- **Oro dispersibles**

Ex: SOLUPRED ®

Modification de la vitesse de libération du PA (2)

2) Forme à libération ralentie:

durée d'absorption + longue → durée d'action prolongée
→ réduction du nombre de prises

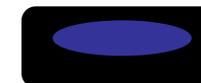
- à libération répétée: comprimés à double noyau
- à libération prolongée (LP ou LA): libération contrôlée du PA dans le temps
Ex: SKENAN LP ®



3) Forme à libération retardée (formes « retard »):

absorption du PA retardée

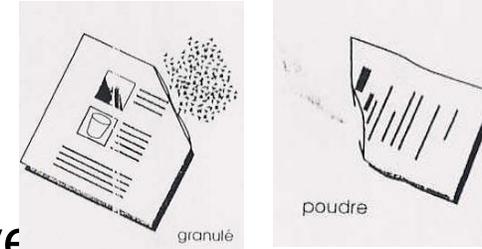
- comprimé gastro-résistant: ne libère son contenu qu'en milieu intestinal
Ex: MOPRAL ®



Les formes orales (4) liquides

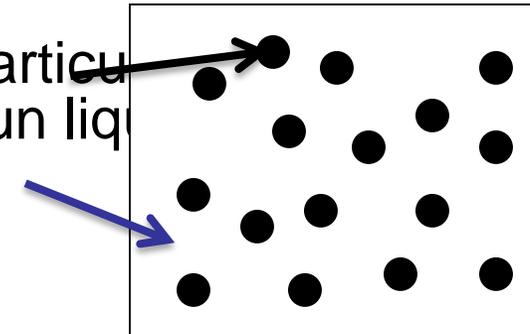
- **Sachets**

- Granulés ou poudre à dissoudre
- Absorption rapide mais précision moyenne.....



- **Suspensions buvables**

- Dispersion du PA solide, en fines particules insolubles (phase dispersée) dans un liquide (phase dispersante)
- **Toujours agiter avant emploi !**



- **Solutions buvables / gouttes buvables**

- Dissolution/dilution du PA dans un solvant aqueux (notamment alcool)
- ≠ bains de bouche!

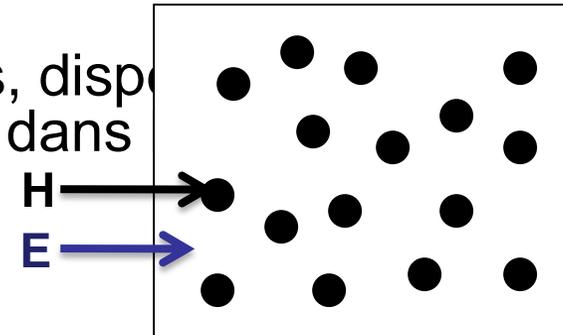
Les formes orales (5) liquides

- **Emulsions**

- mélange stable de 2 liquides non miscibles : eau et huile

- 2 types d'émulsions:

- huile/eau (H/E)= les + courantes, disp de très fines gouttelettes d'huile dans
- eau/huile (E/H)



- **Sirops**

- forte quantité de sucre (minimum 45%) et le PA
- pédiatrie +++
- attention aux sujets diabétiques

La voie parentérale (1)

- Préparations **stériles** destinées à être injectées, perfusées ou implantées : voies **intraveineuse** (IV), **intramusculaire** (IM), **sous-cutanée** (SC)...
- **Stérilisation:**
 - chaleur (ex: autoclaves, 120°C);
 - rayonnements (ex: gamma);
 - produits chimiques (ex: oxyde d'éthylène);
 - filtration

Répartition aseptique (1)



Répartition aseptique (2)



La voie parentérale (2)

- **Avantages**

- Rapidité d'action (IV)
- PA directement dans la circulation sanguine (IV)
→ biodisponibilité 100%
- Patients inconscients ou récalcitrants
- Volumes importants possibles (IV)

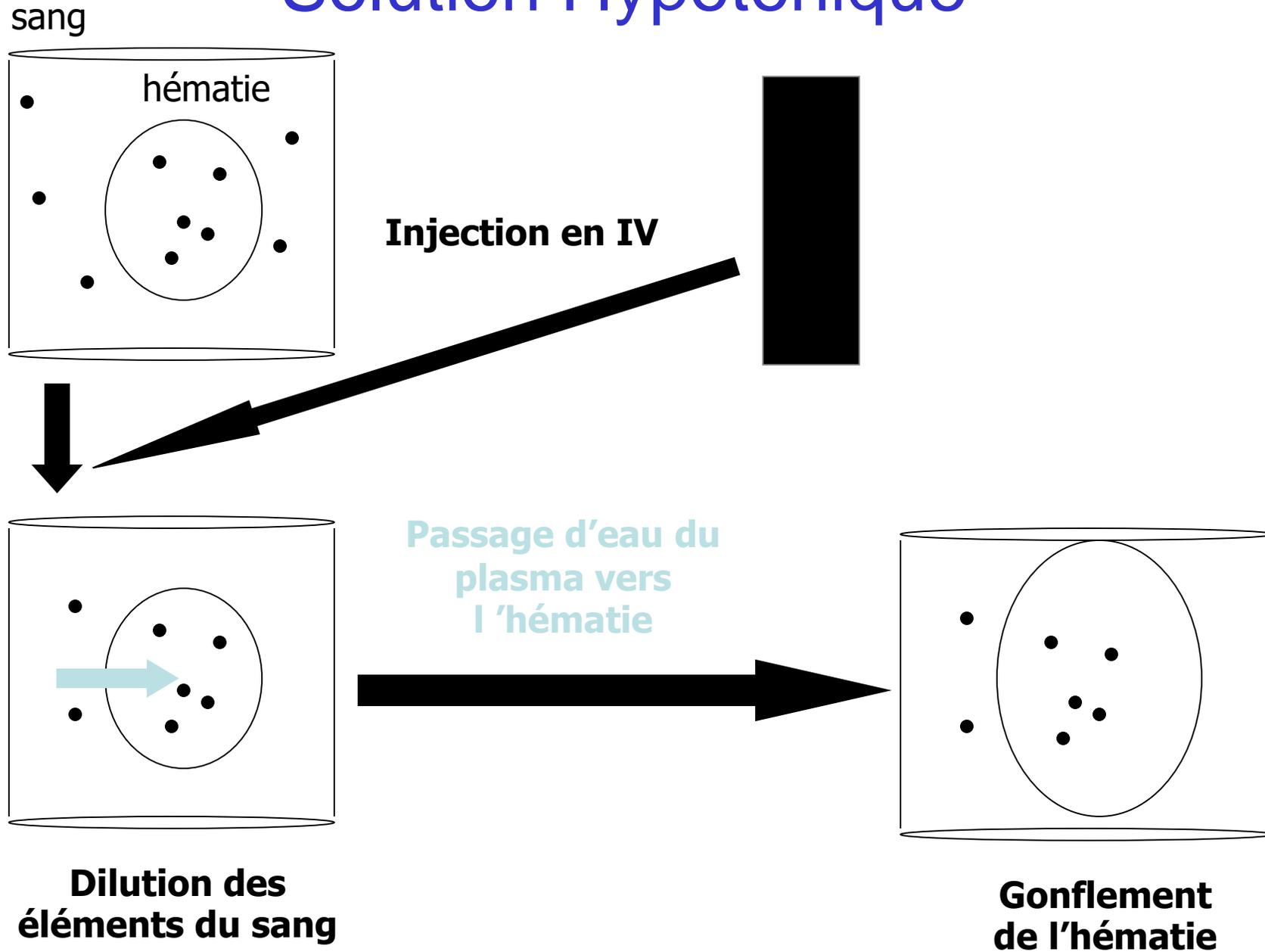
- **Inconvénients**

- Geste médical (certaines voies)
- Risque infectieux et de lésion vasculaire
- +/- douleur
- Fabrication plus coûteuse

La voie parentérale (3)

- Caractéristiques des solutions pour usage parentéral
 - **Stériles**
 - **Apyrogènes** (ex: pas d'endotoxines)
 - **Limpides** = pas de particules en suspension
 - **Neutres** = pH voisin de celui du sang (7,4)
 - **Isotoniques** = même pression osmotique que le sang (NaCl 0,9% ou G 5%)
 - solution non isotonique par voie SC ou IM possible
 - **solution hypotonique par voie IV à proscrire**
 - solution hypertonique par voie IV possible (volume limité, débit lent)
- Préparations
 - Solution, émulsion (IV uniquement), suspension(sauf IV)
 - Poudre pour reconstitution → solution ou suspension

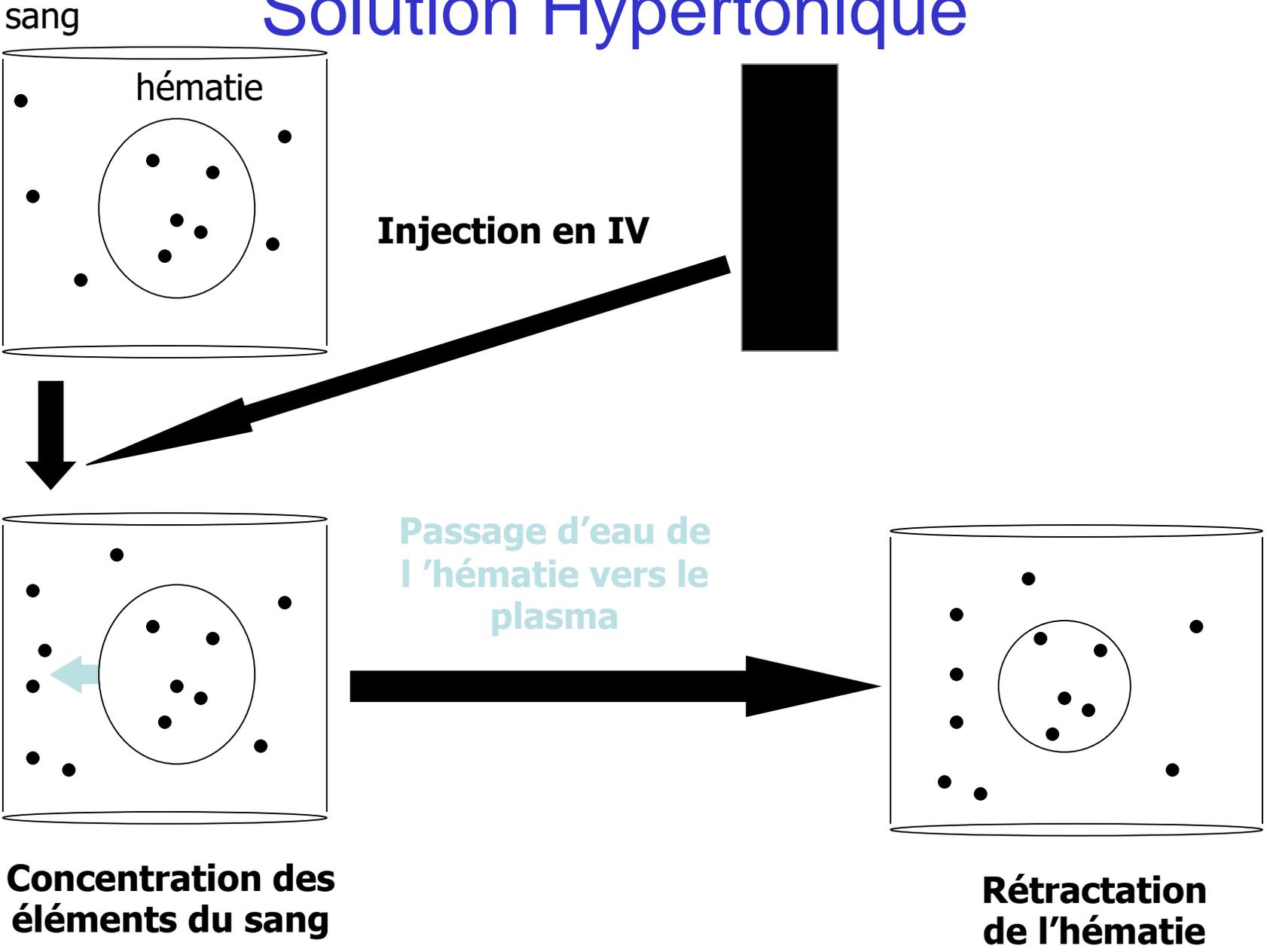
Solution Hypotonique





!! Éclatement de l'hématie !!

Solution Hypertonique



La voie parentérale (4)

- Conditionnement
 - Ampoules 2 pointes ou bouteilles
 - Flacon en verre
 - Poche plastique
 - Seringue pré-remplie, cartouches



La voie parentérale (5)

- **Formes à action prolongée**
 - Émulsions
 - Suspensions
 - Microsphères (ex: SOMATULINE®)
 - Vecteurs: liposomes (ex: AMBISOME®)
 - Systèmes implantables:
 - Implants (ex: hormones sexuelles IMPLANON ®)
 - Pompes et réservoirs

Autres voies systémiques (1)

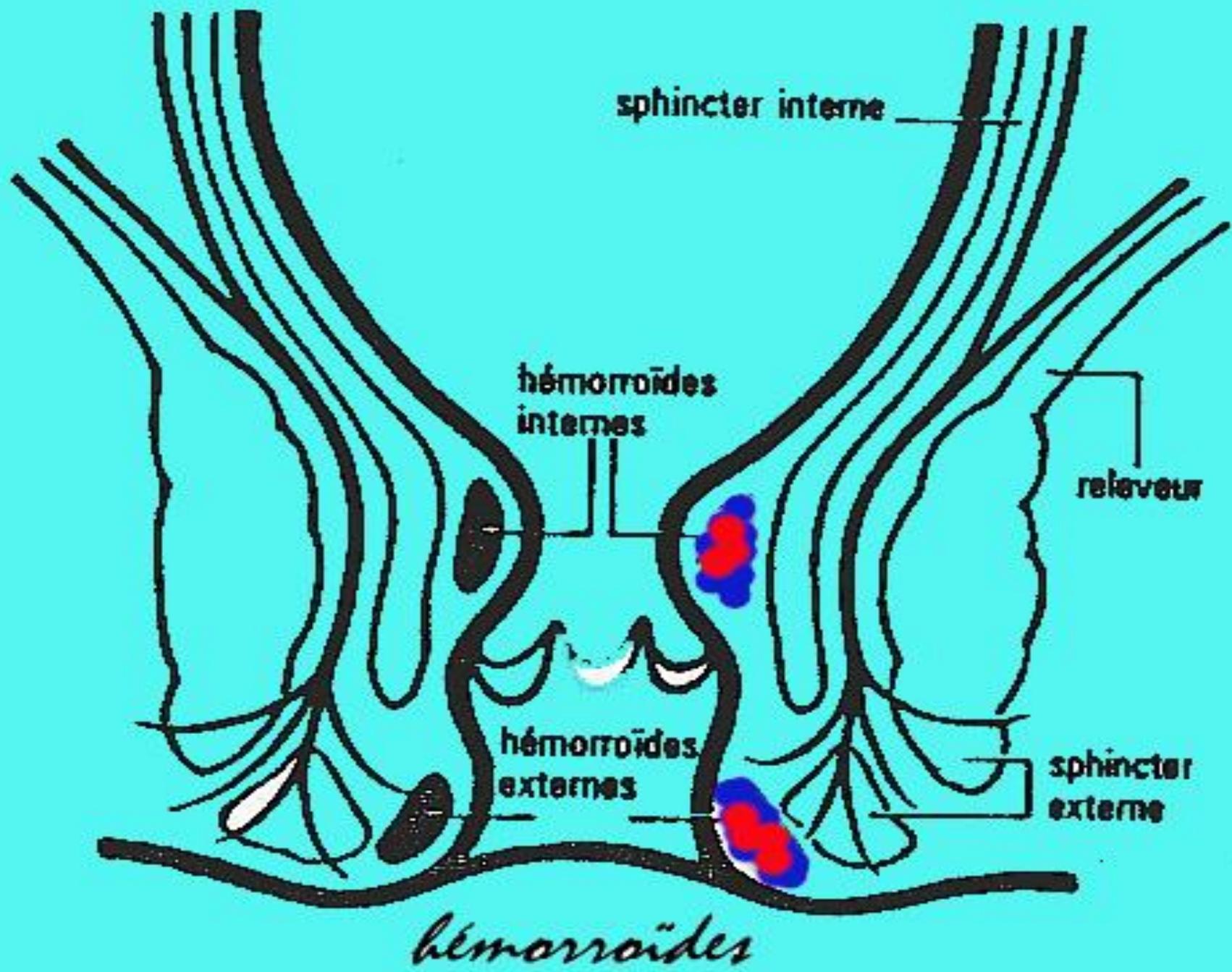
- **Voie sublinguale**

- Comprimés, granules ou solutions
- Laisser le + plus longtemps possible sous la langue



- **Voie rectale**

- **Suppositoires** : fondent à 37°C pour une action locale ou générale
- Autres formes à usage rectal : usage local surtout
Lavement, mousse rectale, pommade rectale, solution à usage rectal

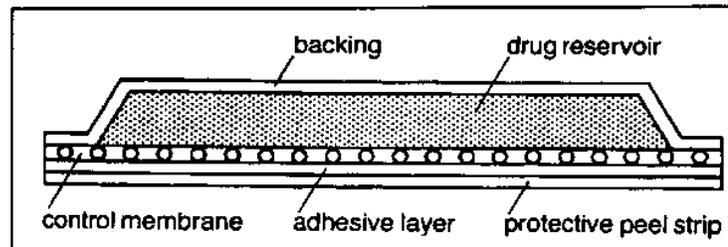


Autres voies systémiques (2)

- **Voie transdermique**

- Dispositifs transdermiques (**patches**) »

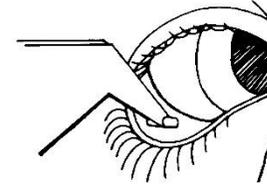
- petit réservoir fixé sur la peau
- membrane en contact avec la surface cutanée
→ libère progressivement le PA dans la circulation générale



Les voies locales (1)

- **Voie oculaire**

- Collyres (multidoses, unidoses)
- Inserts ophtalmiques
- Pommades, gels ophtalmiques



- **Voie vaginale**

- Ovule
- Crèmes et gels vaginaux

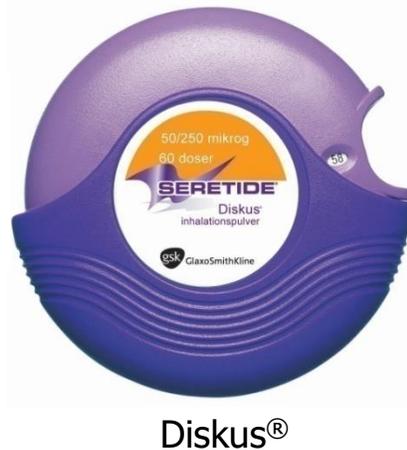
Les voies locales (2)

- **Voies aériennes supérieures et ORL**
 - Bain de bouche
 - Collutoire : forme liquide à appliquer sur la cavité buccale
 - Gargarisme
 - Gouttes auriculaires
 - Gouttes/pommades nasales

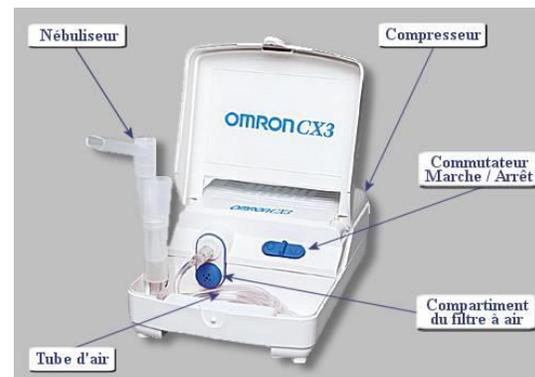
Les voies locales (3)

- Voie **pulmonaire = aérosols** ou poudres
 - fines particules solides ou liquides dispersée dans un gaz
 - Le diamètre des particules conditionne le degré de pénétration dans l'appareil respiratoire
 - Générateur d'aérosol réutilisable ou bombe aérosol
 - Administration par le nez ou la bouche

Aérosol-doseur



Nébuliseur



Gélules pour inhalation

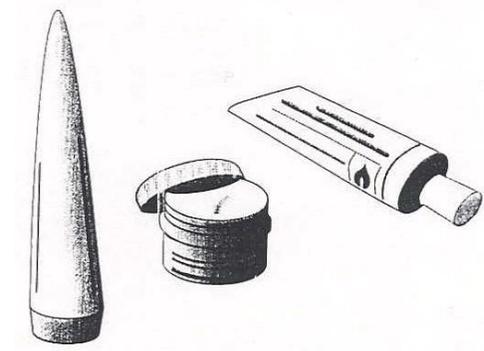


Les voies locales (4)

- Voie **cutanée**

- Crème dermique

- molle, peu grasseuse et peu épaisse
- émulsion H/E ou E/H
- favorise la pénétration dans les tissus cutanés



- Pommade

- molle, onctueuse et épaisse
- application sur la peau ou certaines muqueuses
- phase aqueuse limitée en comparaison des crèmes

- Gel

- Solution et lotion à usage externe

- Autres

- Cérat, cold-cream, glycérolé, liniment, pâte dermique, poudre...

Mentions légales

L'ensemble de ce document relève des législations française et internationale sur le droit d'auteur et la propriété intellectuelle. Tous les droits de reproduction de tout ou partie sont réservés pour les textes ainsi que pour l'ensemble des documents iconographiques, photographiques, vidéos et sonores.

Ce document est interdit à la vente ou à la location. Sa diffusion, duplication, mise à disposition du public (sous quelque forme ou support que ce soit), mise en réseau, partielles ou totales, sont strictement réservées aux Instituts de Formation en Soins Infirmiers de la région Rhône-Alpes.

L'utilisation de ce document est strictement réservée à l'usage privé des étudiants inscrits dans les Instituts de Formation en Soins Infirmiers de la région Rhône-Alpes, et non destinée à une utilisation collective, gratuite ou payante.