

Description du médicament

Définition et composition

Notion de forme pharmaceutique

Objectifs

- ⇒ Délivrance d'un PA (molécule responsable de l'activité thérapeutique) à une dose donnée
- ⇒ Favoriser la conservation du PA
- ⇒ Diminuer les effets secondaires
- ⇒ Modifier la durée de l'activité thérapeutique

Concernant la dose

- Forme titrée mais pouvant être fractionnée *selon prescription médicale* (ex. un sirop)
- Forme titrée en dose unitaire (ex. un comprimé)

Notion de formulation

« Réalisation d'une formule dans son libellé ou dans sa préparation »

- ⇒ Matières premières (PA + excipients) + procédé technologique

Critères de choix reposant sur :

- ✓ Une législation et une réglementation
- ✓ Un aspect économique
- ✓ Une activité thérapeutique
- ✓ La composition et le mode de préparation

Composition du médicament

Éléments constitutifs : un ou plusieurs P.A. + excipients, présentés dans un conditionnement

- **Principe actif (= P.A.)** : responsable des propriétés curatives ou préventives
- **Excipients**
 - Substance ou mélange de substances inactives
 - Facilite la préparation et l'emploi
 - Rôle dans la libération du PA
- **Conditionnement**
 - **Conditionnement primaire** : directement en contact avec la forme pharmaceutique (ex : comprimé dans son blister)
 - **Conditionnement secondaire** (boîte) : rôle de protection et d'information
 - Accessoires
 - Notice

Exemple : l'Aspirine

- *Forme pharmaceutique* : comprimé d'Aspirine® à 500 mg
- *P.A.* = acide acétylsalicylique
- *Excipients*
 - Amidon
 - Stéarate de magnésium : lubrifiant facilitant la fabrication du comprimé
- Chaque forme contient 500 mg de P.A. = dose unitaire
Permet l'administration d'une dose précise
- *Conditionnement*
 - Tubes d'aluminium ou blisters
 - Boîte de carton avec notice

Notion de matières premières : *définie à la Pharmacopée*

La Pharmacopée Européenne : ouvrage de référence, mise à jour périodiquement, élaborée par 2 organismes :

- **Commission Européenne de Pharmacopée** : élaboration, décision des méthodes d'analyse, préparation des monographies, délai d'application
- **Comité de Santé Publique** : contrôle général, approbation

Objectifs et moyens de la Pharmacopée

- ⇒ Protection de la santé publique par élaboration de spécifications = garanties fondamentales de sécurité d'emploi
- ⇒ Facilite la circulation des médicaments en Europe
- ⇒ Garantie de qualité à l'exportation

Textes élaborés pour des besoins :

- Règlementaires
- Service de contrôle de qualité
- Fabricants de mat. premières et produits pharmaceutiques

Principes actifs, excipients et conditionnement

Principes actifs

Définition

Responsable des propriétés curatives, préventives à l'égard des maladies humaines ou animales.

Soit :

- Entité chimique définie (ex. Aspirine)
- Mélange d'origine synthétique ou naturelle
- Issu des biotechnologies
- Cas particulier des produits d'origine humaine

Grande variété chimique - état physique

Classification

- **Par fonction**

Diagnostic : substances entrant comme simples composants ou vecteurs dans des produits pour diagnostic sans être par eux-mêmes actifs

Produits destinés à agir sur les fonctions organiques : effets du produit administré soient «seulement supposés »

- **Par origine** : biologique, minérale, synthétique

- **Par nature**

Produits définis : substances chimiques caractérisés par leurs constantes physiques et propriétés chimiques

Produits non définis : mélanges avec des caractéristiques variables

- **Par activité pharmacologique**

Agissant sur le système nerveux central : anesthésiques, hypnotiques, analgésiques, ...

Agissant sur le système cardio-vasculaire : cardiotoniques, hypotenseurs, ...

Excipients

Définition

Matières premières destinées à entrer dans la composition des préparations pharmaceutiques à un **titre différent** de celui des principes actifs.

Elles sont destinées à la **mise en forme** de ces préparations ou à y être incorporées.

Soit :

- Entité chimique définie (ex : eau)
- Mélange d'origine synthétique ou naturelle (ex : amidon)

Rôles des excipients

- ⇒ Faciliter l'administration des médicaments
- ⇒ Améliorer l'efficacité du P.A.
- ⇒ Assurer la stabilité et donc la conservation

Propriété : INERTIE

- **Inertie vis-à-vis du P.A.** : ne doit ni inhiber, ni augmenter l'activité (sauf la cinétique)
Nécessité d'une étude préalable
- **Inertie vis-à-vis du matériau de conditionnement** : problème des excipients liquides ou pâteux (attaque du matériau, absorption sur le matériau)

Caractéristiques

- Caractères physico-chimiques : décrits dans les monographies
- État physique : solide, liquide, gazeux
- Caractères technologiques : adaptation aux conditions de fabrication (ex. rhéologie des poudres), exigences de pureté liées au domaine pharmaceutique

Classification

- ✓ Eaux inscrites à la Pharmacopée
- ✓ Les glycérides et dérivés (ex. les huiles)
- ✓ Surfactifs
- ✓ Hydrocarbures et silicones
- ✓ Sucres et polysaccharides (ex. dérivée des celluloses)
- ✓ Polymères synthétiques
- ✓ Produits minéraux
- ✓ Conservateurs, colorants et aromatisants

Exemple : Eaux inscrites à la Pharmacopée

- **Eau potable** : destinée à l'alimentation humaine, ne porte pas atteinte à la santé
- **Eau purifiée** : « Eau préparée soit par distillation, soit à l'aide d'un échangeur d'ions, soit par tout autre procédé approprié, à partir de l'eau potable »
 - ⇒ Eau déminéralisée
 - ⇒ Utilisée dans toutes formes galéniques exceptées préparations injectables
- **Eau pour préparations injectables** : « Eau destinée à la préparation des médicaments administrés par voie parentérale dont le véhicule est aqueux, à la dissolution ou à la dilution des substances ou des préparations pour administration parentérale au moment de l'emploi »

Matériaux de conditionnement

Conditionnement = emballage composé de différents éléments

Rôles

- **Fonctionnel** : permet de délivrer (ex. seringue), permet d'administrer, efficacité, sécurité
- **Protection** : assure la conservation, évite que le PA rentre en contact direct avec l'extérieur, + éléments extérieurs (bouchage, emballage, etc...)
- **Identification et information**

Propriétés essentielles

- Résistance physique
- Imperméable aux constituants du médicament
- Isoler le médicament des facteurs extérieurs
- Inerte vis-à-vis du contenu
- Innocuité absolue

Comprend aussi les matériaux de préparation, des accessoires : cuillère, pipette, seringues,...

Types de conditionnement

- **Conditionnement primaire** : en contact avec le médicament (blister, tube plastique, métal, ..)
- **Conditionnement secondaire** : emballage carton
- **Unidose** (qu'une seule utilisation), **multidose** (plusieurs utilisations)

- **Le verre**

Type I : Verre neutre borosilicaté

Résistance hydrolytique élevée due à la composition chimique de la masse.
Convient pour les préparations parentérales et non parentérales.

Type II : Verre calco-sodique traité en surface

Résistance hydrolytique élevée due à un traitement de surface approprié.
Convient pour les préparations acides et neutres.

Type III : Verre calco-sodique non traité

Résistance hydrolytique moyenne.
Convient pour les préparations injectables lorsque l'excipient ne comporte pas d'eau et pour les poudres parentérales.

- **Matières plastiques**

- **Elastomères**

- **Métaux**

- **Revêtement et matériaux complexes**