

Formes pharmaceutiques de la voie orale

I. Généralités

1. Caractéristiques de la voie orale

▪ Bouche

Circulation **sublinguale** importante : vascularisation très importante (médicament en cas d'urgence)
Villosités

▪ Estomac

Surface d'absorption faible : $0,11 \text{ m}^2$
pH acide : 1,2 (suc gastrique)

▪ Intestin grêle

Surface d'absorption importante : 300 m^2 (grâce aux microvillosités)
pH neutre : 7 à 7,4

▪ Colon

Faible surface : $0,3 \text{ m}^2$
Absorption des formes à libération prolongée

2. Les formes galéniques de la voie orale

Les formes liquides

Avantages

- Homogènes : répartition du PA homogène dans l'espace
- Facilement administrables
- Généralement bien tolérées (notamment par les enfants)
- Pas de problème de délitement ou de dissolution dans le tractus gastro-intestinal (TGI)

Inconvénients

- Instabilité, contamination microbienne (solvant : eau ou sirop)
- Conditionnement lourd et fragile (verre)

Les formes solides

- Formes dites sèches
- Petit volume
- Stabilité accrue : longue conservation
- Dose précise par unité

II. Formes galéniques liquides

1. Caractéristiques

Nature des formes liquides

- Solution **Monophasique** (= PA dissous dans le solvant)
- Emulsion **Biphasique** (= dispersion de 2 liquides non miscibles)
- Suspension **Biphasique** (= dispersion liquide/solide non solubles)

Utilisation

- Prêt à l'emploi
- A reconstituer à partir de poudres, de granulés...
- A diluer à partir de préparations liquides concentrées

Conditionnement

- Unidose (ampoule) ou multidose (flacon)

Administration

- En fonction de la précision demandée par la nature du PA : cuillère à café (5ml), cuillère à soupe (15ml), compte goutte, seringue...

2. Les sirops (forme titrée fractionnable)

Définition (Pharmacopée Européenne)

Préparations aqueuses de saveur sucrée et de consistance visqueuse

Composition

- Eau
- Saccharose (environ 65%, minimum 45% masse/masse) densité proche de 1,32
- Un ou plusieurs PA
- Excipients : conservateurs, colorants...

Conservation

Altération liée à la concentration en sucre

- Faible : contamination microbienne
- Forte : cristallisation du saccharose



3. Émulsions

Définition

- Préparations généralement liquides, destinées à être administrées telles quelles ou à être utilisées comme excipient
- Dispersion d'un liquide sous forme de globules dans un autre liquide non miscible

Classification

- Emulsion de type huile dans eau : Huile/Eau (H/E) ou Lipophile/Hydrophile (L/H)

Composition

- Eau
- Huile
- Agent émulsionnant (tensioactif) : stabilisation de la dispersion (pas de déphasage)
- PA
- Excipients : conservateurs, colorants...

4. Suspensions

Définition

Préparations généralement liquides constituées par un ou plusieurs **solides** dispersés sous forme de **fines particules** dans un milieu de dispersion (phase dispersante ou externe ou continue).

Cas des PA peu solubles dans l'eau

Composition

- PA sous forme solide
- Excipients : conservateurs, colorants, édulcorants...

Conservation

- Si sédimentation : mention « agiter avant emploi »

TRES UTILISEES EN PHARMACIE

III. Formes galéniques solides

1. Les poudres

Définition

Préparations constituées par des particules **solides, libres, sèches** et plus ou moins fines. Les poudres contiennent un ou plusieurs PA additionnés ou non d'excipients, de matières colorantes autorisées et d'aromatisants.

Origine

- Végétale ou animale
- Substance chimique naturelle ou synthétique

Catégories

- Poudre simple : constituée d'une seule substance
- Poudre composée : mélange de plusieurs poudres simples

Conditionnement

- Sachet par exemple

2. Les granulés

Définition

Préparations constituées de **grains solides et secs**, formant chacun un **agrégat** (procédé permettant l'agrégation des poudres) de particules de poudre d'une solidité suffisante pour permettre les diverses manipulations.

Utilisation

- A croquer
- A dissoudre ou désagréger dans de l'eau avant administration

3. Les capsules

Définition

Préparations de consistance solide, constituées d'une enveloppe **dure (gélules) ou molle (capsules)**, de forme et de capacité variable, contenant généralement une dose unitaire de PA.

Principe

Altération de la paroi de la capsule par les sucs digestifs : libération du contenu

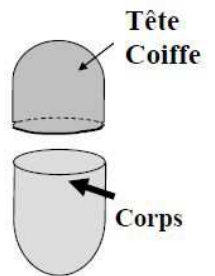
Cas des capsules gastro-résistantes : protection contre sucs gastriques

a) Capsules dures (= gélules)

Définition

Constituées d'une enveloppe dure formée de 2 parties cylindriques (corps et coiffe) ouvertes à une extrémité et dont le fond est hémisphérique.

La poudre est placée dans le corps par arasage puis la coiffe est emboîtée sur le corps.



Composition

- **Enveloppe** :
 - Gélatine (dérivée du cholestérol) seule, colorant
 - Faible teneur en eau (15%)
- **Contenu** : PA et excipients sous forme solide (poudre, granulés)



b) Capsules molles

Définition

Capsules dont l'enveloppe est molle et en une seule partie

Caractéristiques - composition

Enveloppe :

Composition : gélatine + glycérine ou sorbitol, colorant

Plus épaisse que celle des gélules

Formée, remplie et fermée **au cours du même cycle de fabrication**

Forme variable : ronde, allongée...



Contenu : PA et excipients à l'état liquide ou pâteux

4. Les comprimés

Définition

Préparations de consistance **solide**, contenant une **unité de prise** d'un ou plusieurs PA. Ils sont obtenus en agglomérant par **compression** un volume constant de particules.

Caractéristiques

- A avaler, à croquer, à dissoudre ou à désagréger dans de l'eau avant la prise
- Libère le PA à différents étages du TGI
- Forme variable (cylindrique, bâtonnet...)
- Certains sont **sécables** : séparation du comprimé en deux
- ⇒ **Possibilité de libération modifiée (jeu des excipients)**



- **Forme à libération accélérée**

Comprimés effervescents

Désintégration rapide du comprimé qui permettra une dissolution plus rapide

Excipients

- Acide organique (acide citrique, fumarique...)
- Base (bicarbonate de Na, K)
- ⇒ Génération de CO₂

Comprimés dispersibles

Meilleure dispersion des constituants dans un verre d'eau

Comprimés orodispersibles

Dispersion des constituants dans la cavité buccale

- **Forme à libération ralentie (prolongée)**

Objectif

Prolonger la phase d'absorption du PA et donc l'effet thérapeutique

Libération à vitesse et à concentration constante (permet qu'une seule prise du comprimé)

Formes à libération répétée

- Comprimés multicouches
- Comprimés à noyaux : la couche périphérique est libérée en première

Formes matricielles

- **Inertes** : matrices non dégradables (on joue avec la porosité, taille des pores, qui vont ralentir la libération du PA en dehors de la matrice)
- **Hydrophiles** : matrices formant un maillage, formation d'hydrogel
- **Lipidiques** : mécanisme d'érosion, matrice attaquée par les lipases

- **Forme à libération retardée**

Libération retardée dans le TGI : formes gastro-résistantes (enrobage par un polymère insoluble en milieu acide et entérosoluble)

Remarque : peut être appliqué aux gélules