

PHARMACOLOGIE GENERALE

Chapitre2 : La pharmacie galénique

[La pharmacie galénique est à la fois « la science et l'art de préparer, conserver et présenter les médicaments ». Son but est de trouver pour chaque substance active la présentation la mieux adaptée au traitement d'une maladie et en favoriser l'acceptation par le patient.

La pharmacie galénique met en forme le médicament et permet de le présenter au malade (et au propriétaire de l'animal) :

D'une manière plus adaptée a son mode d'administration,

Avec la garantie d'un dosage précis,

D'une stabilité satisfaisante,

Et d'une utilisation simple permettant l'observance]

Réalisation et Présentation:

TORCHE S. : s.torche17@gmail.com

Révision et Participation :

BEROUAL K. : beroualk@yahoo.fr

**Institut des Sciences Vétérinaires El Khroub
Université des Frères Mentouri Constantine1**

2020-2021

SOMMAIRE	1
II.1. Objectifs	2
II.2. Historique	2
II.3. Classification	2
II.3.1. Formes galéniques destinées aux voies entérales	2
II.3.1.1. Voie orale	2
II.3.1.2. Voie rectale (anale)	5
II.3.2. Formes galéniques destinées aux voies parentérales	5
II.3.2.1. Formes injectables	5
II.3.2.3. Formes destinées à la voie respiratoire	6
II.3.2.4. Formes destinées à la voie intra-mammaire	6
II.3.2.5. Formes des voies locales	6
II.3.3. Formes spéciales à libération prolongée	9
II.3.3.1. Définition	9
Références bibliographiques	10

II.1. Objectifs

À la fin de ce chapitre l'étudiant sera capable de :

- Identifier les différentes formes pharmaceutiques (ou galéniques) d'un médicament.
- Connaître les différents excipients de chaque forme
- Décrire le conditionnement de chaque forme

II.2. Historique

La pharmacie galénique est à la fois la science et l'art de préparer, conserver et présenter les médicaments.

Le terme de « Galénique » est relatif à "**Claude Galien**", médecin grec qui est considéré comme le père de la pharmacie galénique. Il a séparé la pharmacie en tant que science à part, qui fonctionne en parallèle avec la médecine:

- ✓ 1850 - 1870 : Fondation du premier institut de pharmacologie (Allemagne) ;
- ✓ 1892 -1900 : Apparition des premiers médicaments officinaux (Aspirine 1892 par le laboratoire Bayer) et des premiers laboratoires pharmaceutiques ;
- ✓ 1920 - 1960 : Développement de l'industrie pharmaceutique.

Les formes galéniques sont tous les médicaments de la Pharmacopée actuelle.

La pharmacie galénique offre à la pharmacopée des formes à chaque fois parmi les mieux adaptées à l'usage thérapeutique chez l'homme et l'animal.

Les formes médicamenteuses utilisées en médecine humaine et vétérinaire sont dépendantes et définies par la voie d'administration; on appelle voie d'administration appropriée : toute voie choisie afin de permettre une absorption maximale du principe actif (voir chapitre3).

II.3. Classification

Il existe différentes façons d'aborder les formes pharmaceutiques, nous les classerons ici suivant **leur état physique** (liquide, solide, semi-solide) et **leurs voies d'administration** (entérale et parentérale).

II.3.1. Formes galéniques destinées aux voies entérales

II.3.1.1. Voie orale

Voie orale =digestive= Per os (par la bouche) =PO (par voie orale)= buvable (pour les formes liquides).

NB : On dit voie buccale si l'action est locale au niveau de la bouche

❖ Formes liquides

Ce sont des formes d'action rapide, ne nécessitant pas de dissolution dans le tube digestif.

De nombreux termes sont utilisés :

- *Potion* : ancien terme = remède liquide
- *Sirop* : solution concentrée à base de sucre et d'eau
- *Élixir* : terme ancien = médicament liquide dont l'excipient est un Alcool
- *Mixture* : ancien terme = liquide dense par mélange mixé de plusieurs substances
- *Breuvage* : terme de la médecine vétérinaire = faire boire à l'animal une quantité de liquide contenant un médicament
- *Soluté* : principe actif parfaitement solubilisé dans l'eau = solution aqueuse

=> Les différentes formes liquides :

1. **solution** : c'est un mélange de particules solubles dans un liquide, donne un mélange parfaitement homogène
2. **sirop** : c'est une préparation aqueuse de saveur sucrée (minimum 45%) et de consistance visqueuse
3. **suspension** : forme liquide résultant de la dispersion d'un ou plusieurs PA solides dans une phase liquide, donnant un mélange hétérogène, mais parfaitement homogène après agitation
4. **émulsion** : forme liquide résultant de la dispersion de fines gouttelettes d'une solution (huileuse) dans un autre liquide, donnant un mélange homogène à l'œil nu.
Un agent émulsionnant est souvent ajouté pour stabiliser la préparation. Ex: Emulsion H/E: dispersion de fines gouttelettes d'huile dans l'eau

** Les excipients sont en général :

- ✓ *L'eau* : Stérile, distillée, physiologique
- ✓ *Les alcools* : Solution alcoolique
- ✓ *Les sucres* : Saccharose, Glucose, Fructose, Lactose (en solution sucrée ou en sirop)
- ✓ *Les huiles* : Végétales surtout (Triglycérides à Acides gras saturés et insaturés)

*** **Conditionnement**: les formes liquides se présentent en multidoses (flacons – bouteilles) ou unidoses (ampoules). Toujours conditionnées en verre coloré (jaune, marron).

❖ Formes solides

1. **Cachet** : ancien terme (nomination abandonnée)
2. **Comprimés (Cp)**: objets cylindriques formés par compression d'un mélange de poudre contenant la substance active, un excipient et divers additives. Ils sont unidoses et peuvent être :
 - ✓ Sécables ou multi sécables
 - ✓ Enrobés (pelliculés, dragéifiés)
 - ✓ Cp spéciaux: effervescents, Solubles (Lyophilisats oraux), dispersibles, orodispersibles, à libération modifiée, à libération prolongée (Lp), gastro-résistants à libération entérique

- Cp effervescents** : Ce sont des comprimés non enrobés contenant généralement des substances acides et des carbonates ou bicarbonates qui réagissent rapidement en présence d'eau en libérant du dioxyde de carbone. Ils sont destinés à être dissous ou dispersés dans l'eau avant administration.

Ces formes sont utilisées si le principe actif est peu soluble ou pas soluble, la forme effervescente peut faciliter sa dissolution. L'avantage de cette dissolution permet une absorption rapide et diminue considérablement les risques d'ulcération gastrique.

3. **Gélules ou Capsules** : présentation unidose

Le PA et l'excipient sont protégés par une enveloppe de consistance dure ou molle, le plus souvent à base de Gélatine renferme la substance active en poudre sous forme de granules (gélule), ou plus rarement sous forme d'une solution ou de gel (capsule).

L'enveloppe peut être d'un seul morceau ou constituée de deux parties s'emboîtant l'une dans l'autre (possibilité d'ouvrir la gélule).

But de revêtement gélatineux :

*Protection du PA de l'action salivaire et surtout contre le pH gastrique,

*Protection de la muqueuse gastrique contre l'action irritante de certains composants (PA)

4. **Pilule** : Appellation donnée au comprimé de très petit volume, réservé aux médicaments dont le PA doit être très faiblement dosé (Cas des médicaments à base d'hormones et des drogues très puissantes du système nerveux)
5. **Granulés** : Présentation sous forme de grains de granulométrie variable se présentant en vrac ou en sachet
6. **Poudres** : Présentation en sachet en doses unitaires (Granulés et poudres peuvent servir à la préparation de solution buvable)

❖ **Formes semi-solides** : *Pâtes orale, Gèle orale*

** Les excipients sont en général :

- ✓ Pour la forme solide: Amidon - Talc - Gluten - Sucres
- ✓ Pour la forme semi-solide : Gélatines - Algines

II.3.1.2. Voie rectale (anale)

❖ **Formes liquides:**

- **Lavements médicamenteux:** Ils vont agir sur la muqueuse rectale et intestinale.
On peut faire 2 types de lavages : lavage rectal et lavage intestinal qui peut être laxatif ou calmant

❖ **Formes semi-solides**

- **Suppositoires:** Ce sont des préparations ovoïdes ou coniques, utilisées par voie rectale pour une absorption très rapide du principe actif

**Les excipients

Beurre de cacao – huiles hydrogénées d'origine végétale- Tri-glycérides – Gélatine- Glycérine - Paraffine - Vaseline- Cire d'abeille.

☒ **Principales propriétés de suppositoires :**

- ✓ Soluble dans les sécrétions et la température rectales
- ✓ Forme et voie non considérées en médecine vétérinaire (exception pour les petites races "carnivores")
- ✓ Forme et voie assez importantes en médecine humaine

II.3.2. Formes galéniques destinées aux voies parentérales

Tous les médicaments ne sont pas obligatoirement administrés par la voie orale, c'est-à-dire avalés. Ils peuvent être aussi donnés par voie parentérale.

En parlant de forme parentérale (forme qui évite l'intestin (entéro= intestin), on désigne en général les formes injectables bien que, en cas d'inhalation ou d'apport sur la muqueuse rectale, le site d'absorption soit également parentéral

II.3.2.1. Formes injectables

Une molécule administrée en injection (intra-veineuse, intramusculaire ou sous-cutanée) est le plus souvent sous forme liquide (soluté injectable en solution, suspension ou émulsion), prête à l'emploi ou à reconstituer juste avant l'utilisation.

Elle doit être: **limpide, stérile, neutre, isotonique et apyrogène** (ne provoque pas de fièvre). Les préparations injectables sont conditionnés dans des ampoules unidoses (ex: Adrénaline) dans des flacons pour perfusions (multidoses) en verre transparent incolore (ex:

Bicarbonate), en PVC (Polychlorure De vinyl) ou PET (Polyéthylène) (ex : Antibiotiques), en Stylos (ex: insulines) ou dans des Seringues (ex : héparines de bas poids moléculaire).

Tous ces flacons sont **hermétiques, inertes et stériles**, ils doivent assurer la conservation de leur contenu sans altération

*** Les excipients (Solvants) : Eau – Alcool – Huile

II.3.2.3. Formes destinées à la voie respiratoire

Appelées : Formes inhalée - Aérosols - Pulvérisateurs - Gaz - Spray

- **Principe**

Médicament sous forme d'une dispersion de particules liquides ou solides (fines gouttelettes ou poudre fine) dans un gaz propulsé sous pression dans un pulvérisateur.

** Les excipients sont des « Gaz propulseurs »

La taille des gouttelettes et des particules propulsées conditionnent la vitesse avec laquelle elles seront entraînées avec l'air inspiré dans les profondeurs de l'arbre respiratoire.

- **Action générale (anesthésie):**

- Gaz: ex: Protoxyde d'azote
- Liquides volatils: ex: anesthésiques halogénés

- **Action locale (asthme, broncho-pneumopathie chronique obstructive):**

- Inhalateurs pressurisés à valve doseuse: Aérosols ex : Ventoline
- Inhalateurs à poudre : unidose (gélule à introduire à chaque prise) ex: Foradil ou multidoses : ex: système Diskus: Flixotide

II.3.2.4. Formes destinées à la voie intra-mammaire

La forme destinée à cette voie est une substance semi solide à base d'antibiotiques et/ou d'anti-inflammatoires conditionnée dans des **tubes injecteurs** ou seringues en plastique pour faciliter l'administration par le canal du trayon (Strictement à usage vétérinaire)

II.3.2.5. Formes des voies locales

- ❖ **Formes pour la voie cutanée**

Appelées : Formes multidoses, dermatologiques, externes ou topiques.

La peau a une structure qui se distingue en trois parties de l'extérieur à l'intérieur: L'épiderme, le derme et l'hypoderme.

Les formes galéniques destinées à cette voie sont:

En Formes liquides : Solutions - Emulsions - lotions. Conditionnés en flacon ou en spray pulvérisateur.

** Les excipients : Eau - Solvants volatils (Alcool surtout – Ether – Acétone.) Huiles

Film dermique: Sous forme pressurisée (spray):

- ✓ isole la peau du milieu extérieur
 - ✓ Favorise la cicatrisation Ex; Cicajet18, Alluspray (usage vétérinaire),
- Il existe d'autres pansements : imprégnés antibiotiques, corticoïdes

En Forme semi-solides: Pâte- Pommade- Crème – Gel (Différence: réside dans la densité)

** Les excipients : Huiles végétales - Cires synthétiques - Cires d'abeille- Glycérine - Paraffine - Vaseline.

En Formes solides :

Poudres : destinées à l'usage superficiel (non résorbables) leur adhérence est toujours mauvaise. Elles sont répandues sur la peau intacte et contiennent du talc, du stéarate de magnésium, de la silice, ou de l'amidon.

En Formes cutanée adhésives:

A - Formes cutanées non médicamenteuses : Sparadraps, pansements adhésifs

B- Formes cutanées médicamenteuses : Emplâtres et cataplasmes: formes souples hydrophiles

En Pansements médicamenteux non adhésifs:

A- Lipido-colloïde: Exemple : **TULLE GRAS**

- ✓ Favorise le bourgeonnement (cicatrisation)
- ✓ plaies importantes et brûlures

B- Pansements au charbon actif

- pour plaies malodorantes,
- 3 couches: plastique, charbon, antiseptique (en contact de la plaie)

** L'excipient est choisi en fonction :

- ✓ du pouvoir pénétrant du PA et l'action pharmacologique recherchée dans les différents parties de la peau
- ✓ Pour une action parentérale retardée
- ✓ Pour un pouvoir pénétrant dans la peau nul (Cas des solutions aqueuses destinées à l'usage externe)

Il doit être :

- Bien toléré par la peau
- Ne provoque pas d'allergies

***Les formes dermatologiques :

- ont une très grande importance en médecine humaine, les utilisations sont multiples, l'intérêt pharmacologique est très important, il permet de limiter l'utilisation des médicaments par la voie générale.
- Leur importance est limitée en médecine vétérinaire et leur utilisation est adaptée à chaque espèce animale en fonction du type du phanère.

❖ **Formes destinées à la voie gynécologique**

Formes solides, appelées :

- ✓ *Oblets* (usage vétérinaire)
- ✓ *Ovules ou comprimés gynécologiques* (usage médical)

** Les excipients sont de même nature que pour les suppositoires, conçus pour fondre et libérer le principe actif à la température vaginale.

Ces formes sont :

- très importantes en médecine vétérinaire (dans la gestion de la reproduction en élevage intensif bovin et ovin)
- assez utilisées en médecine humaine.

Formes liquides: cas Irrigation intra-utérine qui consiste à introduire une solution dans l'utérus à base d'antiseptique (ex: solution iodée) ou suspension à base d'antibiotique (ex: Pénicilline) à l'aide d'un cathéter et d'une seringue à fin d'agir localement en cas de métrite.

❖ **Formes pour la voie ophtalmique (ou oculaire)**

Forme liquide : Collyre (ou goutte oculaire) sous forme de gouttes à excipient aqueux, isotonique et toujours stérile. La durée de conservation après ouverture doit être strictement respectée.

Forme semi-solide : Gèles et Pommade ophtalmiques (avec applicateur)

Forme solide: Insert oculaire : comprimé placé dans le cul-de sac conjonctivale, libérant le principe actif en se délitant (très spécifique).

❖ **Formes pour la voie auriculaire**

Forme liquide : soluté sous forme de gouttes huileuses (gouttes auriculaires).

Forme semi-solide : Pommade auriculaire

❖ **Formes pour la voie nasale**

Forme liquide : gouttes nasales - pulvérisation – spray- fumigation.

Forme semi-solide : Pommade nasale

❖ **Formes pour la voie bucco-pharyngée**

Formes liquides : sous forme de bains de bouche, *Spray, Collutoires.*

Formes semi-solides: Gel buccale et non buvable

II.3.3. Formes spéciales à libération prolongée

II.3.3.1. Définition

Ce sont des dispositifs médicaux contenant une réserve de principe actif qui sera libéré en continue dans l'organisme. Leur but est d'éviter une prise répétée de médicament par toute autre voie.

1. **Timbre cutané, timbre transdermique (patch)**

C'est un médicament contenu dans une pellicule de plastique souple qui adhère à la peau.

Il contient une substance thérapeutique qui permet une absorption transdermique lente du PA.

Exemple: Médicaments Analgésiques et Anti-inflammatoires en médecine humaine

2. **Bolus**

Ce sont des nouvelles formes cylindriques (uniquement à usage vétérinaire) introduits dans le tube digestif à l'aide d'un lance-bolus.

- ✓ **But** : vermifugation, administration des suppléments nutritionnels et prévention de RPT (réticulo-péritonite-traumatique)

Exemple: Certains Antiparasitaires utilisés pendant l'engraissement des ruminants. Le Bolus tombe dans le réticulo-rumen et reste jusqu'à l'abattage de l'animal où il libère de façon continue un PA aux doses thérapeutiques recommandées. Il présente à la fois l'intérêt curatif et préventif et il permet de diminuer la manipulation des animaux.

3. **Collier antiparasitaire**

C'est un antiparasitaire utilisé contre les parasites externes des petits animaux (carnivores).

4. **Implants, éponges et spirales vaginale, Dispositif vaginal**

- ✓ **Principe**: on tente de recréer un cycle sexuel normal, en imitant les conditions hormonales retrouvées durant les différentes périodes œstrales.

Ils sont retirés en respectant la durée du traitement hormonal

✓ **But:** synchronisation des chaleurs et mise à la reproduction des femelles.

-Les implants sont placés sous la peau à la base de l'oreille (vaches et brebis) à l'aide d'un implanteur spécial

-Les éponges vaginales (brebis), spirales vaginales et Dispositif vaginal (vache): sont placés dans le vagin (voie gynécologique)

Références bibliographiques :

1. **Bensegueni Tounsi L, 2013-2014:** Pharmacologie générale, Cours de 3ème année Docteur vétérinaire - ISVK Constantine.
2. **Benazzouz Amina, 2017-2018 :** Pharmacie galénique, Cours ELearning. UMMTO de 3ème année licence chimie pharmaceutique.; Université Mouloud Maameri Tizi –Ouzou.
3. **Lezzar N, 2007-2008:** Pharmacologie générale, 2ème année vétérinaire LMD- ISVK Constantine.
4. **Lüllmann H, Mohr K, Ziegler A, 1998:** Atlas de poche de pharmacologie 2ème édition, Flammarion médecine sciences Paris.
5. **Montéas L, Prodhome J, Ourliac S, 2006:** Manipulation et intervention chez les bovins, édition 2006, France.
6. **Rivoire A., 2012:** Intérêts de l'administration orale forcée chez le veau et chez la vache au peripartum. Thèse de doctorat vétérinaire. Vetagro sup campus vétérinaire de Lyon.
7. **Wehrlé P, 2012:** Formes pharmaceutiques et voies d'administration pharmacologie et thérapeutique - S1 faculté de pharmacie – université de Strasbourg.