

## *Chapitre I Généralités sur les médicaments*

**I.1. 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 présenter au malade le médicament :

- de la manière la plus adaptée à leur mode d'administration,
- avec la garantie d'un dosage précis,
- d'une stabilité satisfaisante,
- et d'une utilisation simple permettant l'observance.

Elle s'intéresse aux :

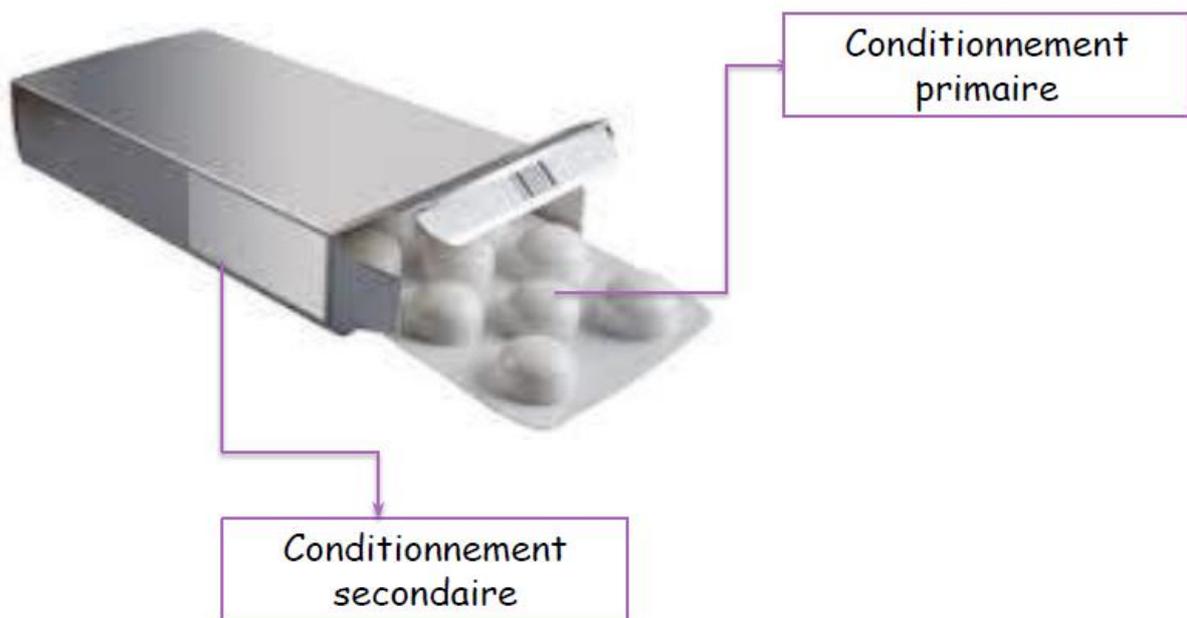
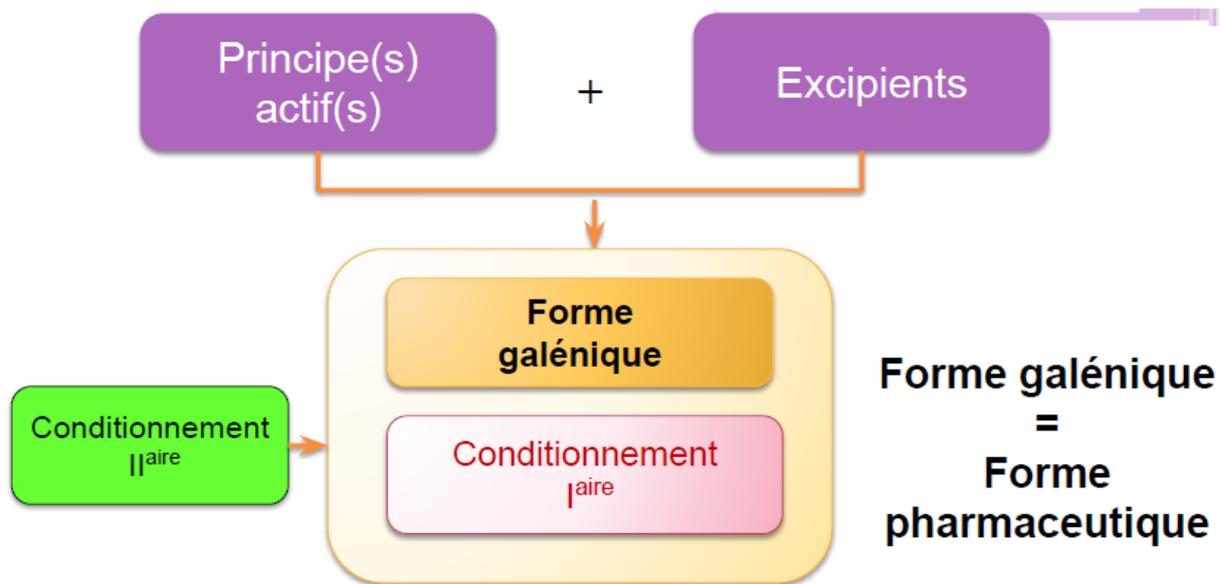
- ✓ Propriétés physico-chimiques des principes actifs et des excipients de façon qu'ils soient compatibles ;
- ✓ Dosages ;
- ✓ Procédés et opérations de fabrication des différentes formes (la pulvérisation, la granulation, l'enrobage, la dessiccation, la lyophilisation, le tamisage, la compression , etc.)
- ✓ Voies d'administration ;
- ✓ Propriétés des matériaux utilisés pour le conditionnement primaire du médicament ;
- ✓ conditions de conservation.

*Claudius Galenus – Galien est après Hippocrate la plus grande figure de la médecine antique, C'est le premier qui a décrit la composition et la façon d'obtenir des médicaments, ce qui a valu à Galien plus tard sa réputation de PÈRE DE LA PHARMACIE GALÉNIQUE*

### **I.2. Médicament**

« On entend par médicament, toute **substance** ou **composition** présentée comme possédant des **propriétés curatives** ou **préventives** à l'égard des **maladies humaines** ou **animales**, ainsi que tout produit pouvant être administré à l'homme ou à l'animal en vue d'établir un diagnostic médical ou de restaurer, corriger ou modifier leurs fonctions organiques ». Un médicament doit disposer d'une A.M.M. (autorisation de mise sur le marché) impliquant la réalisation d'études chimiques, biologiques, biotechnologiques, toxicologiques, pharmacologiques, cliniques et galéniques.

Le médicament ou forme pharmaceutique est composé de différents éléments :



Activer Windows

**I.2.1.Principe actif :** Appelée substance active qui a les propriétés curatives ou préventives vis-à-vis des maladies. Le PA est destiné à exercer une action pharmacologique ou un autre effet direct en rapport avec :

- le **traitement** d'une maladie ;
- le **diagnostic** d'une maladie ;
- ou la **prévention d'une maladie**.

**Tableau 1 : Origines des principes actifs utilisés en pharmacie**

Minérale	Minérale Talc, Argiles, Bicarbonate de sodium, Sulfate de magnésium.
Végétale	Plantes entières ou parties de plantes : Eucalyptus (feuille) : antiseptique Réglisse (racine) : diurétique • Principes actifs de végétaux : Morphine, Quinine, Digoxine, ....
Animale : Opothérapie	Substances extraites d'organes ou glandes fraîches, remplacée par les techniques de génie génétique. Comme Insuline : hormone antidiabétique extraite du pancréas ; Héparine : médicament anticoagulant extrait du poumon ; Trypsine : enzyme protéolytique extraite du pancréas
Humaine	Médicaments dérivés du sang : Albumine, Facteurs de coagulation, Plaquettes, globules rouges.
Microbiologique	Les vaccins : Obtenus à partir de bactéries ou de virus vivants atténués ou inactivés. Vaccin BCG (contre la tuberculose), Vaccin antigrippal • Sécrétion de diverses substances par les microorganismes : Antibiotiques.
Synthétique	C'est la principale source de production des médicaments modernes. Ce sont généralement des molécules complexes obtenues par des méthodes de synthèse de chimie organique. Dans certains cas, il est possible de transformer des molécules déjà connues d'origine naturelle pour aboutir à de nouvelles molécules ( Hémi-synthèse).
Biotechnologique	Biotechnologie : utilisation de cellules vivantes, d'organismes, ou de cultures cellulaires afin de produire un produit d'origine biologique.
Gazeuse	L'oxygène, le monoxyde d'azote, le protoxyde d'azote (analgésique).

### **I.2.2. Excipient**

- De excipere, verbe latin qui signifie recevoir.
- Substance ou mélange de substances inactives par elles-mêmes sur la maladie, utilisées dans la formulation, facilite la préparation et l'emploi du médicament.
- L'excipient peut jouer un rôle important dans la libération du principe actif à partir du médicament et par la même, modifier son activité thérapeutique.

### **I.2.3. Conditionnement**

#### **I.2.3.1. Définition:**

Ensemble des opérations (y compris le remplissage et l'étiquetage) que doit subir un produit en vrac ou une forme galénique avant de devenir un produit fini, le plus souvent, une spécialité

pharmaceutique fabriqué industriellement. Ou bien Ensemble des éléments matériels destinés à protéger le médicament tout au long de son parcours.

### **I.2.3.2. Différents types de conditionnement :**

#### **a. Conditionnement primaire :**

Il désigne le contenant avec lequel le médicament se trouve en contact direct (ex : blister, flacon, ampoule, sachet, piluliers...etc.)



#### **b. Conditionnement secondaire :**

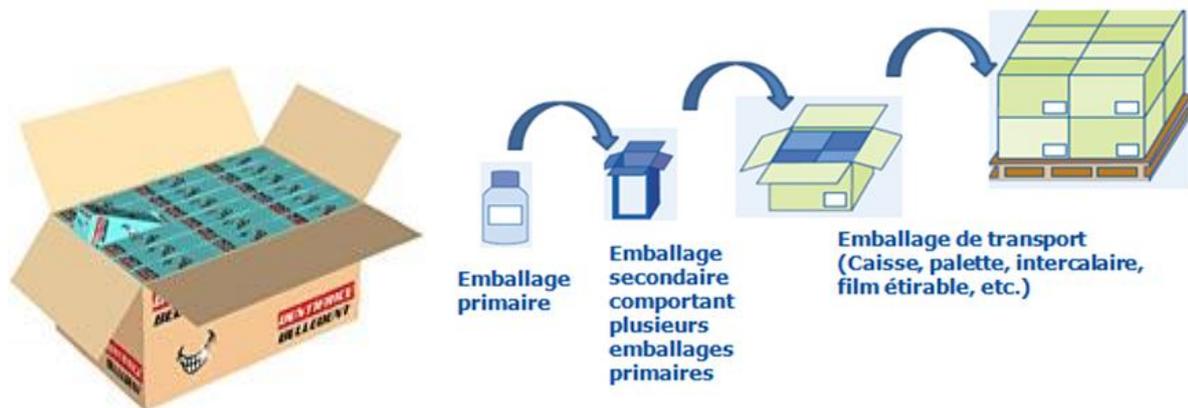
Il désigne l'emballage externe, qui est également appelé conditionnement extérieur, et correspond à l'emballage dans lequel est placé le conditionnement primaire. Ces éléments ne sont pas directement en contact avec le médicament

Il contient la notice et peut contenir des accessoires: cuillère-mesure, compte-gouttes...etc



#### **c. Conditionnement tertiaire:**

Emballage de groupage ou de transport se présentant sous forme de caisses cartonnées contenant un ensemble de conditionnements secondaires.



### I.2.3.3. Rôles du conditionnement:

#### a. Rôle de protection:

Assurer la conservation du médicament en le protégeant jusqu'au moment de l'utilisation contre les agressions extérieures : variations de température, chocs, humidité, contamination microbologique...etc.

L'élément essentiel est celui en contact avec le produit, mais les éléments de calage peuvent assurer ce rôle également.

#### b. Rôle fonctionnel:

- Faciliter l'emploi :
  - Seringue graduée en unité de masse corporelle
  - Calendrier
  - Stylos injecteurs d'insuline



- Augmenter la sécurité de son utilisation :
  - « Conditionnement à sécurité enfant » (presser et tourner)
  - Dispositifs de fermeture inviolable.

#### c. Rôle d'information :

Etiquetage : nom commercial, DCI, dosage, voie d'administration, n lot, DDF,DDP...

Notice : indications, effets indésirables, mode d'emploi, précautions à prendre

#### I.2.3.4. Propriétés essentielles des articles et matériaux de conditionnement :

- Imperméabilité aux agents extérieurs (lumière, oxygène, humidité atmosphérique) : susceptibles de provoquer une altération des matières qu'ils sont appelés à protéger de l'action de ces agents.
- Démunis de toute capacité d'absorption : vis-à-vis du médicament, afin d'éviter toute modification quantitative trop accusée des formes pharmaceutiques.
- La capacité des matériaux à céder : aux formes pharmaceutiques qu'ils sont destinés à protéger, certains de leurs constituants capables d'entraîner soit des modifications d'aspect ou d'activité, soit encore d'y provoquer l'apparition d'une certaine toxicité, doit être la plus faible possible (innocuité).

#### I.3. La forme pharmaceutique

Les formes galéniques sont généralement regroupées sous trois principales présentations physiques :

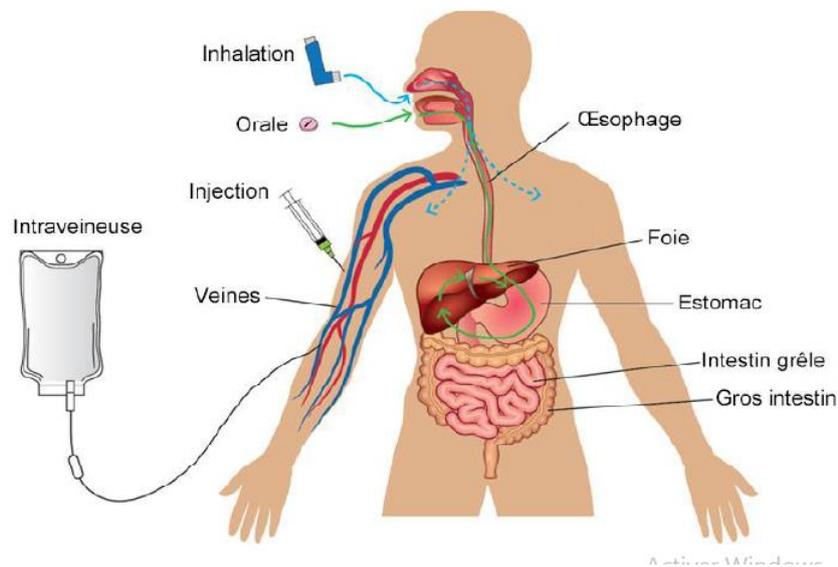
Les solides	Les liquides	Les semi-solides
<i>Comprimés, gélules, granulés,..</i>	<i>Sirops, solutions injectables,..</i>	<i>Pommades, suppositoires,...</i>
		

#### I.4. Les voies d'administration des médicaments

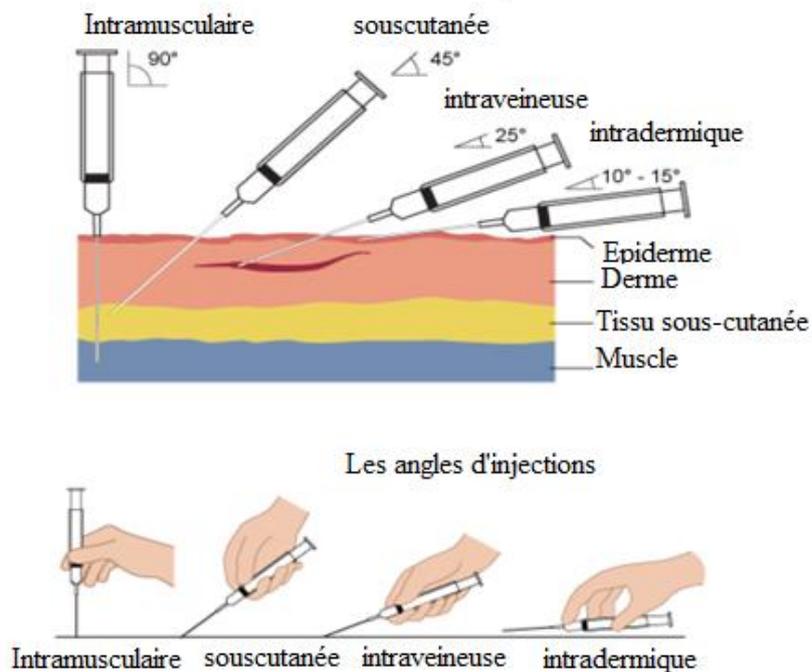
Il existe plusieurs voies d'administration, mais, selon la voie utilisée, les PA n'ont pas le même devenir dans l'organisme et subissent des modifications métaboliques plus ou moins importantes, ce qui peut altérer leur activité pharmacologique, l'intensité et la durée de leur action.

Le médicament diffuse dans tout l'organisme pour traiter plusieurs sites (Figure 1):

- Voies intraveineuse,
- intramusculaire,
- sous-cutanée,
- transdermique,
- pulmonaire,
- orale, buccale,
- nasale,
- rectale.



**Figure 1 : Voies d'administration des médicaments**



## I.5. Formes galéniques et voies d'administration

Mode d'administration	Forme galénique	Mode d'action
<b>Voie orale (à avaler)</b>	Comprimés, non-enrobés, enrobés, solubles, effervescents, gélules.	Le médicament est avalé et le principe actif se libère au niveau de l'estomac ou de l'intestin.
<b>Voie rectale (par le rectum)</b>	Suppositoires, lavements, crème locale.	Le principe actif est libéré très rapidement.  Forme de médicament très utilisée chez les bébés, les personnes handicapées ou les patients souffrants de pathologies sévères de l'estomac.
<b>Voie transcutanée (par la peau)</b>	Pommades, gels, patchs.	Application et action locales
<b>Voie respiratoire (par inhalation)</b>	Inhalateurs. Compte-gouttes et atomiseurs (nez).	Action locale utilisée pour les pathologies ORL et respiratoires.
<b>Voie parentérale (par aiguille ou cathéter).</b>	Injections, perfusions, implants.	Action rapide, utilisée pour la vaccination ou la diffusion lente et prolongée et pour la prise de traitement en milieu hospitalier.
<b>Voie oculaire (par les yeux)</b>	Collyres, pommades, inserts.	Traitement local des pathologies ophtalmiques ou allergiques.

## I.6. Avantages et inconvénients des voies d'administration

### I.6.1. Voie parentérale :

#### Avantages

- ✓ La posologie est très précise.
- ✓ L'effet est très rapide.
- ✓ On évite presque toujours le premier passage hépatique.
- ✓ On peut traiter le malade inconscient ou non coopérant.
- ✓ On peut injecter des médicaments qui seraient irritant pour le tube digestif.

### **Inconvénients**

- ✓ Médicaments difficiles à préparer (stériles, apyrogène, isotonique).
- ✓ Elle est douloureuse.
- ✓ Elle nécessite un personnel spécialisé.

### **I.6.2. Voie rectale**

#### **Avantages**

- ✓ On évite les enzymes digestives.
- ✓ Pratique chez les bébés.
- ✓ Le substance active passe très rapidement dans les voies sanguines.

#### **Inconvénients.**

- ✓ Irritant.
- ✓ On n'évite pas le foie.

### **I.6.3. Voie orale :**

#### **Avantages**

- ✓ L'administration de médicaments par cette voie est aisée.
- ✓ Elle est bien acceptée par le patient.
- ✓ Des doses élevées peuvent être prises en une seule fois.
- ✓ C'est la plus pratique et, habituellement, la plus sûre et la moins coûteuse.

#### **Inconvénients**

✓ Dans le cas des médicaments administrés par voie orale, la phase d'absorption peut débuter au niveau de la bouche ou de l'estomac mais, habituellement, la plupart des médicaments sont absorbés au niveau de l'intestin grêle. Le médicament passe par la paroi intestinale et le foie avant d'être transporté jusqu'au site cible par la circulation sanguine. La paroi intestinale et le foie modifient chimiquement (métabolisent) de nombreux médicaments en diminuant la quantité du produit actif qui gagne la circulation sanguine. C'est pourquoi ces médicaments sont souvent utilisés par voie intraveineuse à des doses réduites, pour un même effet.

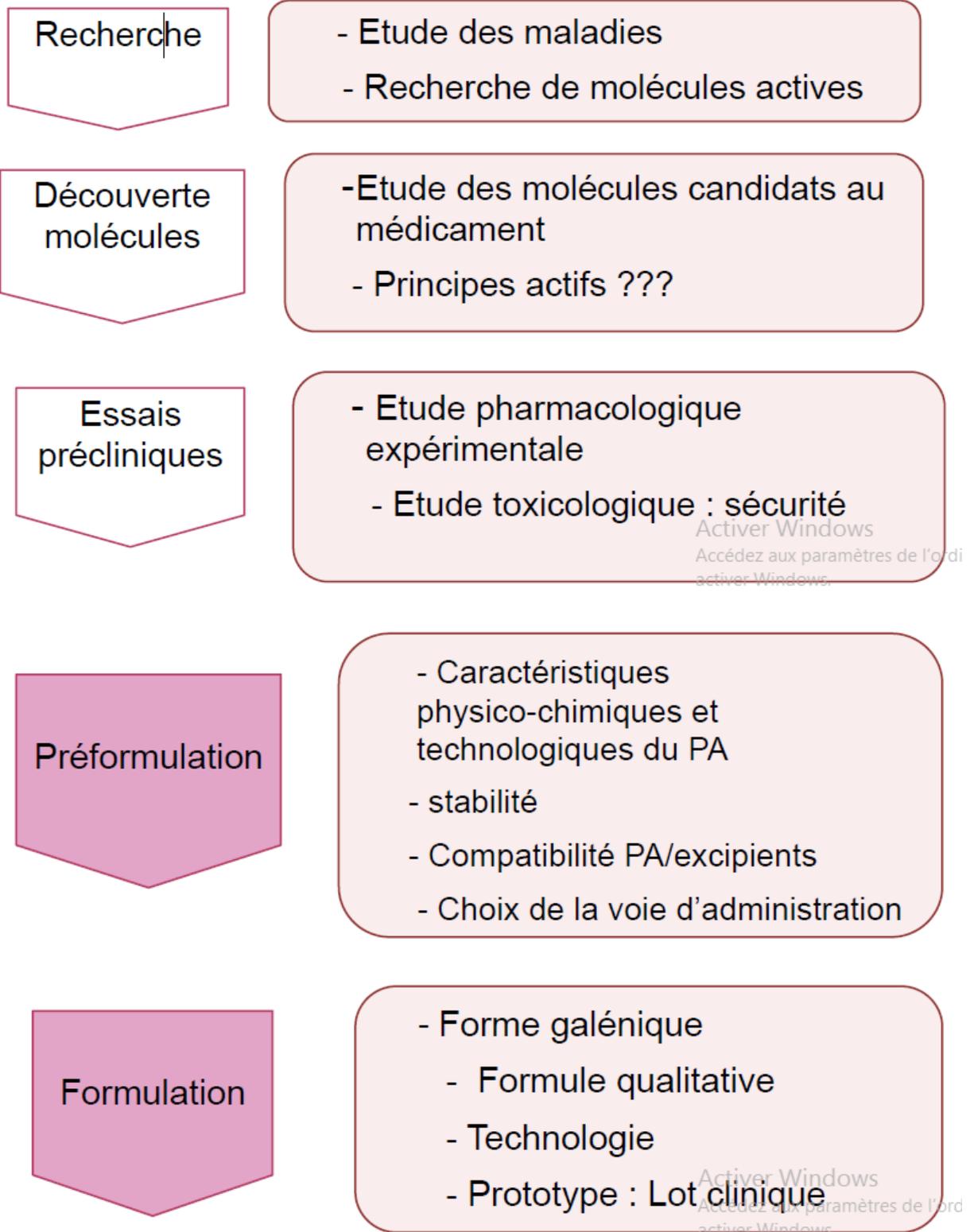
- ✓ Les aliments et les autres médicaments présents dans le tube digestif peuvent modifier la quantité réellement absorbée et la vitesse d'absorption.
- ✓ Certains médicaments administrés par voie orale irritent le tube digestif. Par exemple, l'aspirine, ainsi que la majorité des anti-inflammatoires non stéroïdiens (AINS),
- ✓ D'autres médicaments sont mal absorbés ou absorbés de façon irrégulière par le tube digestif ou sont détruits par l'acidité et les enzymes digestives dans l'estomac.
- ✓ Parfois l'absorption est incomplète, voire nulle (certains sulfamides, les sels métalliques).
- ✓ L'odeur et le goût des médicaments sont parfois désagréables (d'où l'emploi d'aromatisants).
- ✓ La voie orale est difficile d'utilisation en cas de nausées et de vomissements.
- ✓ Elle ne peut pas être utilisée chez un patient inconscient.
- ✓ Il faut être attentif chez l'enfant en cas de fausse route

### **I.7. La conception d'un médicament**

La conception de médicament est l'ensemble des processus nécessaires à la mise au point d'un médicament. Ce processus est divisé en plusieurs phases comme l'indique le schéma ci-dessous.

Différentes phases de la conception d'un médicament :

De la découverte de la molécule active à la commercialisation



L'objectif du développement Galénique étant de transformer un principe actif en un produit médicament, en vue de l'obtention de l'Autorisation de Mise sur le Marché ou AMM.