

*UE6 - Pharmacie Galénique : Voies d'administration et Formes Pharmaceutiques*

# Chapitre 1 : **Généralités : Définition Technologique du Médicament**

Professeur Denis WOUESSI DJEWE

## Introduction : Définitions du Médicament

### Définition légale et définition technologique du médicament

La définition technologique du médicament découle de sa définition légale ([L'article L. 5111-1](#) du Code de la Santé Publique) :

- **Définition légale** : pour plus de détails, se reporter au chapitre 9 : 'Définition des Produits de Santé – Modalité de commercialisation'

La définition légale débute comme suit:

« On entend par médicament

- toute substance ou composition présentée comme possédant des propriétés curatives ou préventives à l'égard des maladies humaines ou animales...
- toute substance ou composition pouvant être utilisée... en vue d'établir un diagnostic médical ou de restaurer, corriger ou modifier leurs fonctions physiologiques...»

⇒ Deux mots clés ressortent: '**SUBSTANCE ou COMPOSITION**'

- **Définition technologique**

Le médicament est rarement une substance seule. Il s'agit généralement d'un produit multi-composants,  $\pm$  complexe.

A titre d'exemples, la composition qualitative (*ne pas apprendre par cœur*) de deux médicaments sont présentés ci-dessous:

**Comprimé enrobé sécable**

**Composition : 8 substances**

**Principe actif**  
**Carbonate Mg lourd**  
**Lactose hydraté**  
**Gélatine**  
**Crospovidone**  
**Stéarate de magnésium**  
**Mélange de filmogène jaune**  
**Cire de carnauba**

**Comprimé osmotique à libération prolongée**

**Composition : 11 substances**

**Principe actif**  
**Oxyde de polyéthylène**  
**Stéarate de magnésium**  
**Oxyde de fer rouge**  
**Acétate de cellulose**  
**Macrogol 3350**  
**Hydroxypropylcellulose**  
**Hypromellose**  
**Dioxyde de titane**  
**Propylène glycol**  
**Oxyde de fer rouge**

## • Définition technologique

⇒ La définition technologique intègre 2 principales notions:

- les composants = matières premières
- l'aspect physique

### ➤ Les composants ou matières premières:

- le(s) principe actif(s) / substance(s) bioactive(s) / molécule(s) active(s) : en abrégé **P.A.**

*Responsables de l'activité pharmacologique...cf. cycle 1*

- les excipients... / adjuvants / véhicules

Excipient vient du latin '*excipere*' qui signifie '*recevoir*'.

Ce sont des substances '*non actives pharmacologiquement*' dont les rôles sont multiples dans le médicament.

- Définition technologique (suite)

- Le médicament est présenté sous un aspect physique:

- La forme galénique

- Le conditionnement

- la forme galénique / forme pharmaceutique

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

- ▶ Les solides :

- ex. Comprimés*

- Gélules*



- ▶ Les liquides

- ex. Sirop*



- ▶ Les semi-solides

- ex. Pommade*



- Définition technologique (suite)
- le conditionnement (articles de conditionnement)

- ▶ Conditionnement primaire

Emballage en contact direct avec le médicament qu'il contient



- ▶ Conditionnement externe

Le médicament dans son conditionnement primaire est introduit dans le conditionnement externe.

# Illustration de la définition technologique du médicament à l'aide de deux exemples

⇒ Les exemples choisis sont des médicaments de type **comprimés**, administrés par voie orale.

## Exemple 1:

Comprimé EFFERVESCENT d'acide acétylsalicylique  
(Aspirine ®)

## Exemple 2:

Comprimé OSMOTIQUE « PUSH-PULL » de Chlorhydrate de  
Prazosine (Alpress®)

***N.B.***

Ces choix sont scrupuleusement dictés par le caractère pédagogique qu'ils devraient susciter.

# Illustration de la définition technologique du médicament

Exemple 1 : Cas d'un médicament à activité antalgique :  
*algie = douleur : antalgique = qui agit contre la douleur*

**Comprimé EFFERVESCENT d'acide acétylsalicylique (Aspirine®)**



**Effervescence du comprimé  
en présence d'eau**

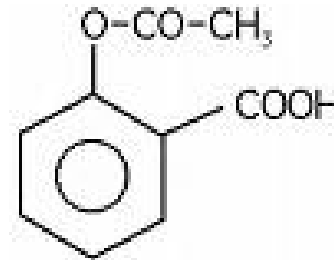


## Exemple 1 (suite)

- Principe actif (P.A.)

- DCI : acide acétylsalicylique (Aspirine® : nom de marque) responsable de l'effet antalgique

- Formule chimique :  $C_9O_4H_8$



- Dosage nominal

- 500 mg de P. A. par unité de prise ou par comprimé

- Forme galénique

- Comprimé effervescent

- Masse totale du comprimé : 4 grammes

## Exemple1 (suite)

- Excipients

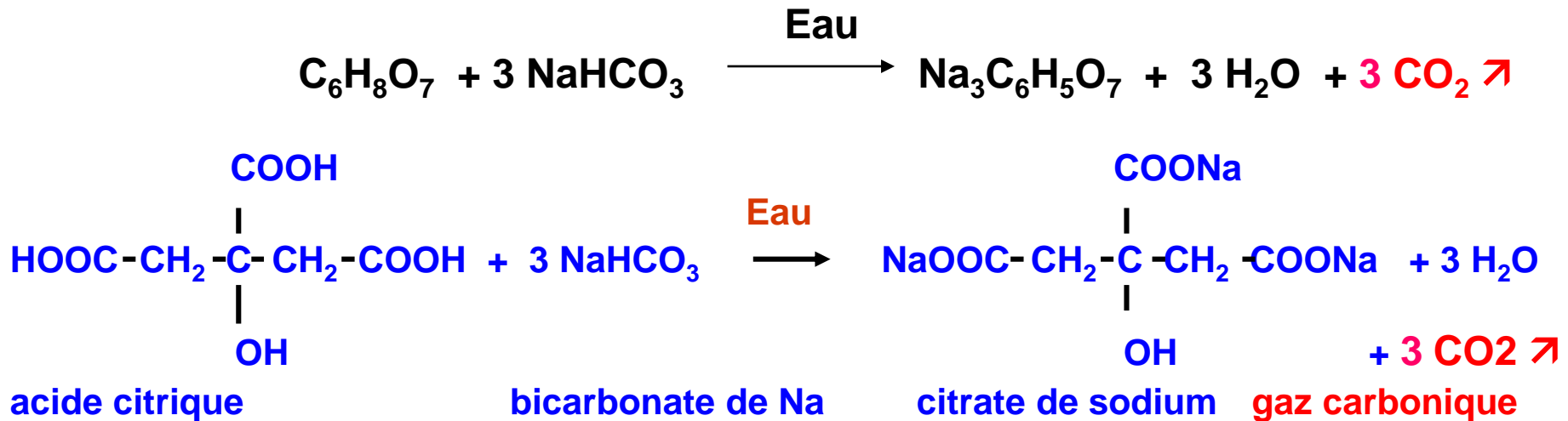
- Bicarbonate de sodium
- Acide citrique anhydre
- Citrate monosodique anhydre
- Carbonate de sodium anhydre
- Povidone
- Aspartam
- Arôme orange

- Conditionnement (emballage)

- Conditionnement **primaire** : film *thermosoudé* de protection
- Conditionnement **externe** : boîte de carton contenant :
  - ♦ les comprimés sous *film thermosoudé*
  - ♦ la notice d'informations sur l'utilisation du médicament.

## ■ Commentaires sur le comprimé effervescent d'acide acétylsalicylique

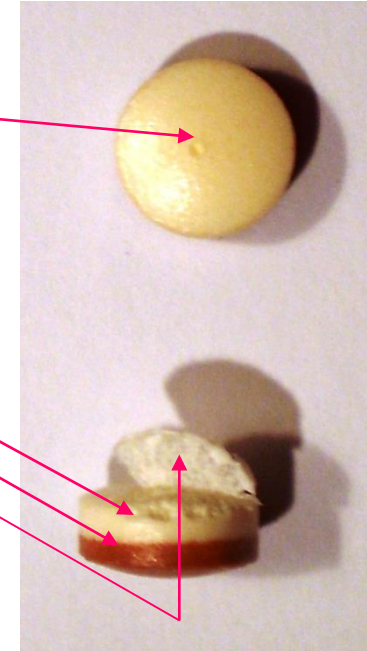
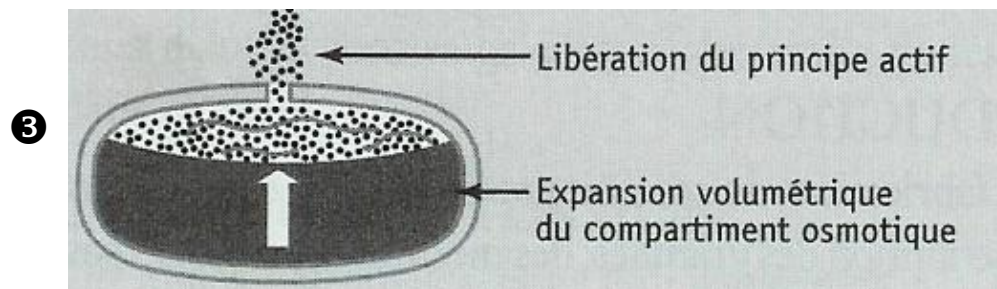
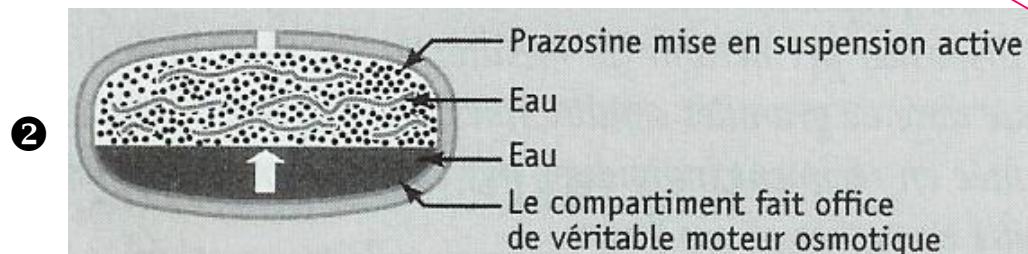
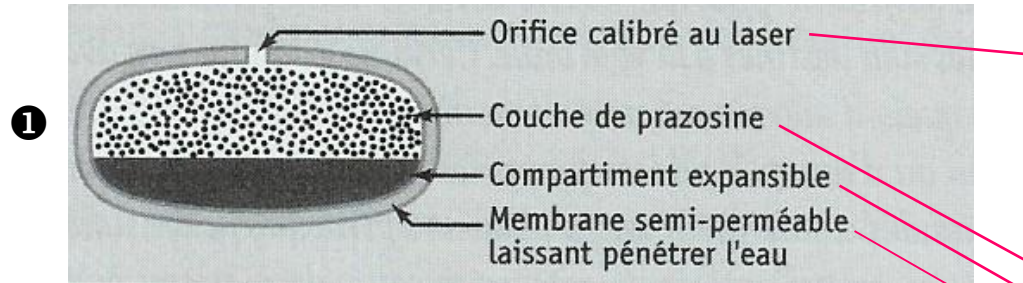
- Le P.A. représente 12.5 % (m/m) du médicament. Les excipients utilisés permettent la préparation et l'utilisation du médicament.
- Excipients à l'origine de la réaction d'effervescence:
  - Acide organique R-COOH : ex. acide citrique anhydre
  - Agent alcalin : ex. carbonate monosodique ou 'bicarbonate de Na'
- **Réaction chimique d'effervescence :**



Dégagement de  $\text{CO}_2$  :  $\Rightarrow$  accélération de la destruction du comprimé et facilitation du passage rapide en solution de l'acide acétylsalicylique.

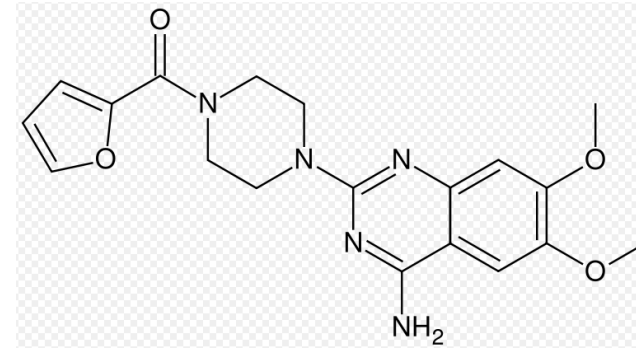
# Illustration de la définition technologique du médicament

## Exemple 2: Cas d'un médicament contre l'hypertension artérielle **Comprimé OSMOTIQUE « PUSH-PULL »** de Chlorhydrate de Prazosine



## Exemple 2: (suite)

- Principe actif



, HCl

- DCI : Prazosine

1-(4 amino-6,7-diméthoxyquinazolin-2-yl)-4-(furan-2-ylcarbonyl)piperazine, HCl

- Formule chimique :  $C_{19}H_{22}ClN_5O_4$

- Dosage nominal

- 2,5 mg ou 5 mg de P. A. par unité de prise ou par comprimé

- Forme galénique

- *Comprimé osmotique Push-Pull*

- Masse totale du comprimé : 290 mg grammes

## Exemple 2: (suite)

- Excipients

- Oxyde de polyéthylène
- Chlorure de sodium
- Hypromellose
- Oxyde de fer rouge
- Stéarate de magnésium
- Acétate de cellulose
- Macrogol

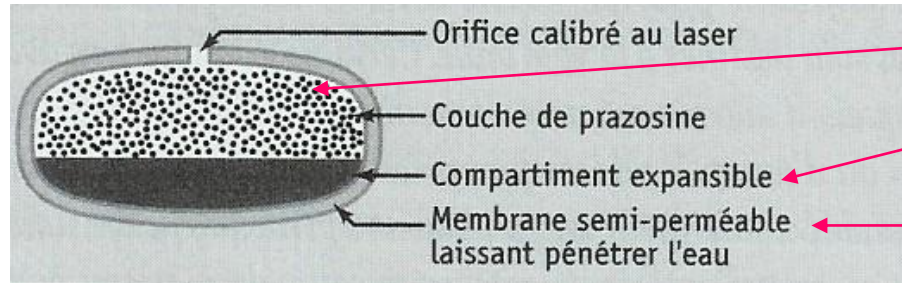


- Conditionnement (emballage)

- Conditionnement **primaire** : *Plaquette thermoformée* de protection
- Conditionnement **externe** : boîte de carton contenant :
  - ♦ les comprimés sous plaquette thermoformée
  - ♦ la notice d'informations sur l'utilisation du produit

## ■ Commentaires sur le comprimé osmotique « PUSH PULL »

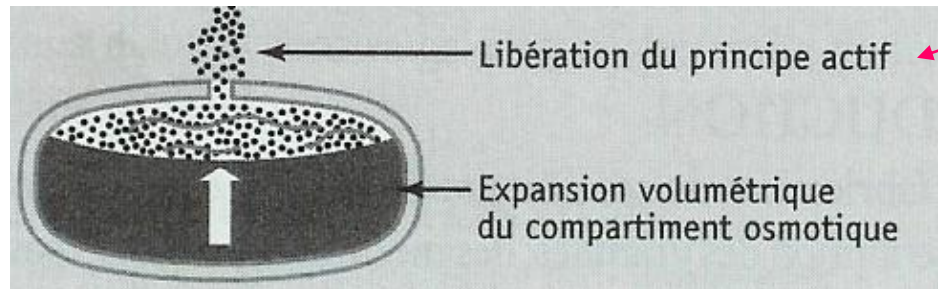
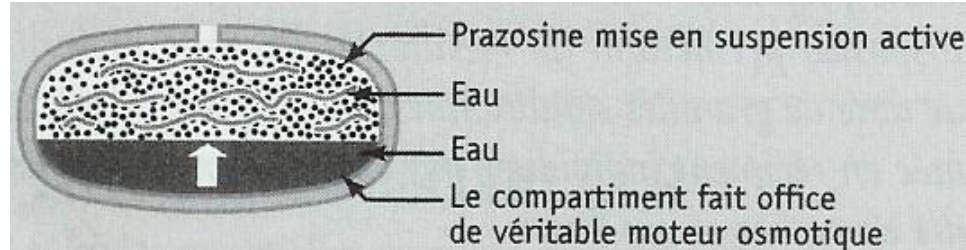
Le P. A. représente moins de 2% du médicament. Parmi les excipients utilisés, ceux mentionnés ci-après sont déterminant pour la libération du P.A.



Oxyde de polyéthylène + NaCl

Oxyde de polyéthylène + NaCl

Acétate de cellulose + Macrogol



**Libération lente et progressive du P.A. pendant plusieurs heures...**

⇒ Grâce à la libération prolongée du P.A., la posologie est de 1 comprimé/jour. *'Ne pas casser, ni broyer, ni mâcher'*



## ■ CONCLUSION

- Le P.A. est à l'origine de l'activité pharmacologique, mais il ne constitue pas en lui tout seul le médicament
- Les rôles des excipients et de la forme galénique peuvent être déterminants entre autres pour :
  - la fabrication du médicament et
  - son administration
  - le devenir et l'activité in vivo du principe actif
- Il est essentiel que :
  - le PRESCRIPTEUR (Médecin)
  - le DISPENSATEUR (Pharmacien)
  - le PERSONNEL SOIGNANT (infirmière...)soient conscients de l'impact de la composition et de la forme galénique sur le bon usage du médicament par le patient.



# 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 à l'Université Grenoble Alpes (UGA).

L'utilisation de ce document est strictement réservée à l'usage privé des étudiants inscrits en Première Année Commune aux Etudes de Santé (PACES) à l'Université Grenoble Alpes, et non destinée à une utilisation collective, gratuite ou payante.