

FORMELE FARMACEUTICE (MEDICAMENTOASE)

III. FORME FARMACEUTICE RECTALE

Sunt forme farmaceutice solide, semisolide sau lichide destinate administrării prin mucoasa ano-rectală pentru obținerea unui efect local sau general.

1. *Supozitoarele* sunt forme farmaceutice solide, obținute din una sau mai multe substanțe active încorporate în doze unitare într-un excipient, de obicei unt de cacao. Ele se topesc la temperatura corpului și se utilizează pentru efect local (laxativ, antihemoroidal, etc.) sau sistemic (antiinflamator, antipiretic, etc.). Au formă cilindro-conică sau de torpilă și masa 2-3 g cele pentru adulți, respectiv 1-2 g cele pentru copii. Sunt frecvent utilizate în pediatrie, mai ales la copiii sub 3 ani.

Ex.: Fenilbutazona sup., Paracetamol sup., Emetiral sup., Scobutil sup.

Avantaje:

- ✓ utile când deglutiția este imposibilă, dar și în pediatrie;
- ✓ substanțele cu miros sau gust neplăcut pot fi condiționate sub această formă;
- ✓ ocolesc în mare parte primul pasaj hepatic;
- ✓ evită disconfortul gastric produs de unele substanțe iritante;
- ✓ elimină posibilitatea degradării unor substanțe datorită pH-ului gastric sau enzimelor digestive.

Dezavantaje:

- ✓ suprafață de absorbție redusă, absorbție lentă și incompletă;
- ✓ nu pot fi administrate pe această cale substanțe iritante pentru mucoasa rectală.



Figura 11. Supozitorul

2. *Unguentele* sunt forme medicamentoase semisolide care au substanța medicamentoasă încorporată într-un excipient (bază de unguent) de tipul lanolină și/sau vaselină. Sunt destinate aplicării pe mucoasa ano-rectală pentru acțiune locală: antihemoroidală (Ultraproct ung., Hemorzon ung., Hemorsal ung.), antiinflamatoare, anestezică locală, vasoconstrictoare, etc.

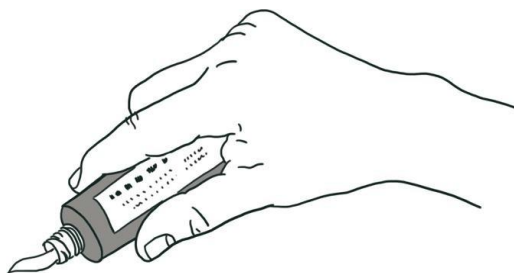


Figura 12. Unguentul

3. *Formele farmaceutice lichide* sunt preparate destinate administrării ano-rectale sub formă de clisme sau microclisme.

- *clismele (spălături rectale)* sunt preparate lichide introduse în ampula rectală cu ajutorul unui irigator prevăzut cu canulă rectală. Se utilizează soluții apoase sau suspensii încălzite la temperatura corpului, ce conțin: substanțe purgative, radioopace (sulfat de bariu 40%) sau medicamentoase (antiseptice, antiinflamatoare, antihelmintice, anestezice, sedative).

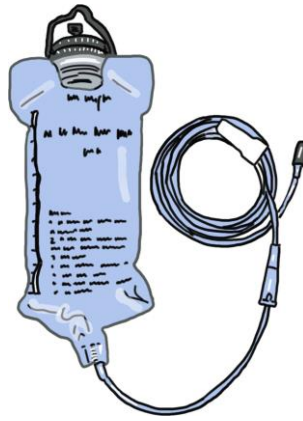


Figura 13. Dispozitiv de administrat clismă

- *microclismele* sunt produse industriale ce conțin un volum mic de lichid (4 – 10 ml). Sunt ambalate într-un tub suplu din material plastic prevăzut cu o canulă închisă etanș. Pot conține soluții apoase sau hidroglicerinate, suspensii, rar emulsii.
Ex.: MeliLax microclisme evacuante, Desitin (Diazepam) sol. rectală.

IV. FORME FARMACEUTICE VAGINALE

Sunt forme farmaceutice lichide, semisolide sau solide administrate pe mucoasa vulvo-vaginală pentru tratamentul local al afecțiunilor ginecologice.

- *spălăturile vaginale* sunt forme farmaceutice lichide, utilizate pentru igiena sau tratamentul mucoasei vaginale, conținând substanțe: antiseptice, antimicotice, epitelizante, dizolvate în apă distilată sau soluție izotonică de NaCl.
Ex. : Tantum Rosa gran. pt. sol. vag., Femigin B pulb. pt. sol. uz vag.
- *comprimatele vaginale (comprimate ginecologice)* sunt mai mari decât cele convenționale și au forme diferite: plate, ovale, de pară sau cilindrice. Pot fi comprimate cu dezagregare normală, întârziată (efect retard) sau cu efervescență (spumogene). Formarea de spumă

asigură pătrunderea rapidă a ingredientelor în toate vilozitățile vaginului.

Ex.: Clotrimazol cpr. vag., Canesten Gyn cpr. vag., Tricomicon cpr. vag.

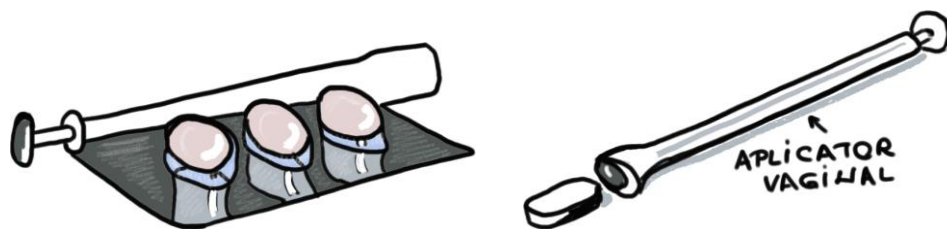


Figura 14. Comprimate vaginale și aplicator vaginal

- **unguente:** forme farmaceutice semisolide, multidoze, aplicate pe mucoasa vulvo-vaginală, ce conțin medicamente cu acțiune antifungică, antiinflamatoare, antimicrobiană.

Ex. : Lomexin cremă vag., Macmiror Complex cremă vag., Gynofort cremă vag.

- **ovulele (supozitoare vaginale)** sunt forme farmaceutice solide, de formă ovoidală sau sferică care conțin doze unitare de substanță medicamentoasă încorporată într-un excipient format din gelatină și glicerină. Administrate endo-vaginal, ele se topesc sau se dizolvă la temperatura corpului. Prin mucoasa inflamată substanțele medicamentoase pot penetra mai ușor, obținându-se uneori chiar o acțiune sistemică.

Ex.: Betadine ovule, Flagyl ovule, Nistatina ATB ovule .

- **sistemul terapeutic intrauterin** este un dispozitiv de administrare intrauterină (DIU) în formă de T cu rezervor medicamentos, eliberând levonorgestrel în interiorul uterului.

Un astfel de DIU este Mirena cu levonorgestrel (20μg/24h), utilizat în scop contraceptiv pe o durată de 5 ani. Este indicat de asemenea în menoragii și pentru prevenirea hiperplaziei endometriale în timpul terapiei de substituție estrogenică. Asemănător este DIU Donasert și ultimul aprobat Jaydess, care asigură contracepția pe o perioadă de 3 ani.

V. FORME FARMACEUTICE ADMINISTRATE PE MUCOASE (FORME OTO-RINO-FARINGIENE)

Medicamentele administrate pe mucoasa auriculară, nazală și buco-faringiană sunt numite *forme farmaceutice oto-rino-faringiene*.

Clasificare:

- forme otologice;
- forme rino-faringiene;
- forme buco-faringiene;
- forme rino-buco-faringiene (aerosoli).

1. Forme farmaceutice otologice

Sunt forme farmaceutice lichide, semisolide sau solide care instilate sau aplicate în conductul auditiv, au acțiune locală, fiind utilizate în tratamentul afecțiunilor urechii.

- **picăturile otice sau auriculare** sunt preparate farmaceutice lichide, sub formă de soluții, emulsii sau suspensii, destinate administrării în conductul auditiv extern (F.R. X). În general, soluțiile apoase sunt indicate în afecțiuni nesupurative, în timp ce soluțiile otice în glicerol sunt mai vâscoase, ceea ce constituie un avantaj în otitele supurative.

Picăturile otice pot conține: antiseptice (acid boric, acid salicilic), antibiotice (cloramfenicol, tetraciclină, neomicină), antifungice (nistatin, clotrimazol), antiinflamatoare (hidrocortizon, indometacin), anestezice locale (anestezină, lidocaină).

Ex.: Otipax sol. auric., Cexidal sol. auric., Boramid sol. auric.

Avantaje:

- ✓ acțiune rapidă și directă datorită administrării topice ;
- ✓ administrare ușoară, netraumatizantă.

Dezavantaje:

- ✓ necesită încălzire la temperatura corpului pentru a evita senzația de vertij, ce poate apare din cauza diferenței de temperatură;
- ✓ nu întotdeauna se poate asigura un contact prelungit cu mucoasa conductului auditiv;
- ✓ uneori soluțiile pot transporta infecția în zonele învecinate (sinusuri);
- ✓ uneori nu sunt miscibile cu secrețiile urechii, menținând o umiditate crescută ce favorizează apariția infecțiilor microbiene sau fungice.

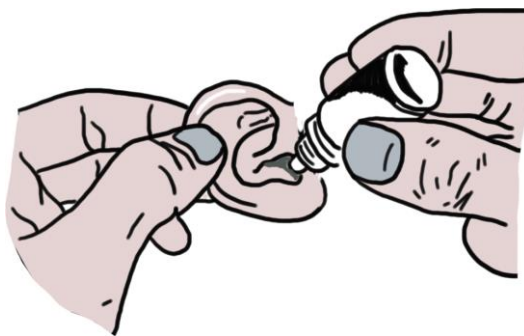


Figura 15. Picături auriculare

- **unguentele, gelurile sau cremele otice** sunt preparate farmaceutice cu baze de unguent lipofile, anhidre sau hidrofile, utile pentru emulsionarea unor secreții glandulare, dar și în scop terapeutic ; se aplică în conductul auditiv extern, eventual cu ajutorul unui tampon impregnat.
- **pulbere auriculară:** preparat solid multidoză, conținând una sau mai multe substanțe active, destinat aplicării în conductul auditiv extern ; se prezintă în recipiente prevăzute cu aplicator sau dispozitiv de suflare.
- **spray auricular:** preparat lichid multidoză, constând dintr-o soluție, suspensie sau emulsie destinată aplicării în conductul auditiv extern prin pulverizare pentru efect local ; se prezintă în recipiente cu pompă de pulverizare sau recipiente presurizate și sunt destinate tratamentului inflamațiilor însoțite de secreții și al eczemelor.

Ex. : Humex spray auricular, Audispray.

2. Formele farmaceutice rino-faringiene

Sunt forme farmaceutice lichide, semisolide sau solide care prin instilații, pulverizări sau aplicare pe mucoasa nazală sunt utile în tratamentul afecțiunilor naso-faringiene. Sunt utilizate în primul rând pentru acțiune locală (vasoconstrictoare, antiseptică, antihistaminică, antiinflamatoare) dar pot avea și acțiune generală, prin trecerea lor în circulația sistemică.

Avantaje:

- ✓ absorbție rapidă, datorită particularităților anatomo-fiziologice ale mucoasei, cu latență scurtă a acțiunii ;
- ✓ evitarea efectului primului pasaj hepatic ;

Dezavantaje:

- ✓ producerea de sensibilizări (rinita medicamentoasă) după utilizare îndelungată ; durata de administrare a erinelor cu vasoconstrictoare (efedrina 0,5-1%, nafazolina 0,1%, fenilefrina, adrenalina), nu trebuie să depășească 7 – 10 zile;
- ✓ afectarea funcției ciliare ;
- ✓ la copii, efecte adverse sistemice mai intense decât la adulți, datorită particularităților anatomico-fiziologice ale mucoasei;
- ✓ interval scurt de menținere la locul de aplicare a formelor farmaceutice lichide, care se elimină rapid.
- **soluțiile pentru spălături nazale** sunt utilizate pentru igiena cavității nazale sau ca antiseptice și trebuie să fie izotone (pH 7-8);
- **picăturile nazale (erine)** sunt preparate farmaceutice lichide sub formă de soluții, emulsii sau suspensii destinate administrării pe mucoasa nazală, cu ajutorul unui aplicator adecvat; denumirea de erine derivă din limba greacă de la cuvintele „en” = în și „rhinos” = nas.
Ex.: Rinofug sol. naz., Bixtonim pic. naz., Rinonef T pic. naz.
- **unguent, gel sau cremă nazală:** preparat semisolid multidoză, destinat administrării nazale pentru efect local. Cremele nazale se prezintă în tuburi prevăzute cu aplicator nazal și au efect emolient, medicamentos sau protector.
Ex. : Bactroban ung. naz., Rinopanteina ung. naz., Vibrocil gel nazal.
- **spray-uri nazale:** preparate farmaceutice formate din particule foarte fine, lichide sau solide dispersate în mediu gazos, administrate cu dispozitive speciale de pulverizare. Au avantajul eliberării unei doze unitare de medicament.



Figura 16. Spray nazal

Ex.: Olynth spray nazal, Vibrocil spray nazal, Nasonex 50 spray nazal.
Instanyl, spray nazal cu fentanil (50, 100 și 200 $\mu\text{g}/\text{doză}$), este indicat în tratamentul durerii episodice la adulții cu cancer ce utilizează deja opioide pentru controlul durerii persistente.

- **sisteme membranare sau rezervoare:** sunt dispozitive cu eliberare prelungită ce conțin o membrană polimerică microporoasă de formă cilindrică, în care se află dispersată substanța medicamentoasă (ex. progesteron).

3. Forme farmaceutice buco-faringiene

Sunt preparate farmaceutice lichide, semisolidă sau solide destinate igienei, profilaxiei sau tratamentului unor afecțiuni ale cavității bucale, gingiilor, dinților, faringelui și laringelui.

- **ape de gură:** soluții apoase sau hidroalcoolice destinate menținerii sănătății mucoasei bucale sau utilizate în scop curativ. Ele conțin antiseptice, deodorante, antiinflamatoare sau anestezice locale. Se pot prezenta și sub formă de pulberi sau comprimate care necesită dizolvare în apă înainte de utilizare.
Ex.: Corsodyl Mint Mouthwash, Glimbax apă de gură.
- **gargarismele:** preparate fluide cu rol de spălare și dezinfectare a mucoasei bucale și faringiene prin efectul mecanic realizat de barbotarea aerului, evitând înghițirea soluției.
Ex.: Tantum Verde sol. pt. gargarisme.
- **gel sau pastă gingivală:** preparat semisolid uni- sau multidoză constând dintr-un gel, respectiv pastă de particule solide, fin dispersate într-o bază hidrofilă. Sunt destinate administrării gingivale pentru efect local.
Ex.: Calgel, Dentinox gel gingival.
- **cremă, gel sau unguent bucal:** preparat semisolid multidoză, constând dintr-o emulsie ulei/apă, un gel hidrofil sau unguent și destinat administrării bucofaringiene pentru efect local.
Ex.: Pansoral gel bucal, Elugel gel bucal, AftiBlock Gel.
- **spray bucofaringian:** preparat lichid multidoză, sub formă de soluție, suspensie sau emulsie destinat administrării prin pulverizare în cavitatea bucală sau faringe. Se prezintă sub formă de recipient presurizat, cu sau fără valvă dozatoare.
Ex.: Hexoral spray, Orofar spray, Strepsils Intensiv spray.

- **comprimate pentru supt (pastile)** sunt preparate care se dizolvă lent în gură, acționând la nivelul mucoasei bucale sau faringiene. Au dimensiuni mai mari și pot conține: vitamine, antibiotice, antiseptice, anestezice locale, analgezice, antiinflamatoare, la care se adaugă agenți aromatizanți și îndulcitori. Ele nu trebuie sfărâmate în gură sau înghițite.

Ex.: Faringosept, Fenosept, Tantum verde, Decasept, Hexoraletten.

- **guma masticabilă medicamentoasă:** preparat solid unidoză, constând dintr-o bază compusă din gume. Substanța activă, încorporată în nucleu este eliberată în salivă prin mestecare. Guma masticabilă medicamentoasă este destinată tratamentului local al afecțiunilor bucale sau eliberării sistemice. În preparatele comerciale disponibile sunt incluse: nicotina, clorhidrat de ambroxol, acid ascorbic, etc.

Ex.: Nicorette Freshfruit, Niquitin Fresh Mint, Mucosolvan gumă orală.

- **comprimatele orodispersabile** sunt destinate dizolvării sau dispersării rapide în salivă (sub 1 min.), rezultând soluții cu concentrații mari în substanță activă, capabile să acopere ușor suprafața mucoasei orale. În prezent există o serie de comprimate de acest tip conținând analgezice-antipiretice, antihistaminice, anxiolitice, etc.

Ex.: Aerius cpr. orodispersabile, Nurofen pentru copii cpr. orodispersabile.

- **comprimat bucal mucoadeziv:** preparat solid unidoză care se aplică pe mucoasa bucală pentru o eliberare sistemică pe o perioadă extinsă de timp. Conține de obicei polimeri hidrofilii care prin umectare cu salivă produc un hidrogel flexibil, ce aderă la mucoasa bucală.

Ex. Loramyc (miconazol) cpr. mucoadeziv.

- **film bucal:** peliculă uni- sau pluristratificată dintr-un material adecvat pentru a fi aplicată în cavitatea bucală în vederea obținerii unui efect sistemic.

Ex.: Breakyl (Fentanyl) film bucal.

- **spray sublingual:** preparat lichid multidoză, constând dintr-o soluție, suspensie sau emulsie, condiționat într-un recipient presurizat cu valvă dozatoare și destinat administrării sublinguale. Are efect rapid, conține doze mici și evită efectul primului pasaj hepatic.

Ex.: Clemastin fumarate lingual spray, Nitrolingual spray, Estradiol lingual spray.

- **comprimat sublingual**: preparat solid unidoză, constând dintr-un comprimat neacoperit, destinat administrării sublinguale. Calea sublinguală este utilă în urgențe, efectul realizându-se în maxim 5 minute.
Ex.: Nitroglicerina, Buprenorfina Alkaloid, Edluar (Zolpidem), Lunaldin (Fentanyl), Orolair (extract alergen polen de graminee).
- **granule homeopate**: preparate solide, utilizate în medicația homeopată. Se obțin din sucroză sau lactoză, impregnate cu o diluție a sușelor homeopate și dinamizate.

VI. FORME FARMACEUTICE OFTALMICE

Medicamentele oftamice sunt forme farmaceutice sterile, destinate tratamentului sau pentru diagnosticarea ochiului bolnav sau lezat. Preparatele oftalmice sunt utilizate în general pentru acțiune locală și se aplică pe mucoasa conjunctivală, corneea, pleoape sau gene.

- **picăturile oftalmice** sunt preparate farmaceutice sterile sub formă de soluții apoase sau uleioase, suspensii, emulsii folosite pentru tratamentul și diagnosticarea afecțiunilor oculare. Se pot prezenta uneori sub formă de pulberi sterile care se dizolvă sau se suspendă înainte de folosire într-un vehicul steril. De obicei instilarea unei picături în sacul conjunctival este considerată suficientă ; dacă este necesară a doua picătură, se recomandă un interval de 5 minute față de prima.



Figura 17. Modul de aplicare a picăturilor oftalmice

Dezavantajele administrării colirelor:

- ✓ uneori intoleranță locală;
- ✓ durata staționării în ochi a soluțiilor oftalmice este mică (4-5 minute);
- ✓ după deschidere flaconul se poate utiliza maxim 15 zile.

În funcție de acțiunea terapeutică, colirele pot conține: antiinfecțioase, anestezice locale, miotice sau midriatrice, antiinflamatoare, antiglaucomatoase.

Ex.: Betabioptal sol. oft., Mydriacyl sol. oft., Timolol sol. oft. 0,25% și 0,5%, Tobrex sol. oft.

- **soluții pentru lentile de contact:** sunt soluții apoase sterile folosite pentru dezinfectarea, păstrarea și umectarea lentilelor de contact.
- **unguent, cremă sau gel oftalmic:** sunt preparate semisolide sterile, ce se aplică în sacul conjunctival sau pe marginea pleoapelor. Sunt indicate mai ales pentru prelungirea acțiunii, comparativ cu soluțiile oftalmice. Se preferă aplicarea lor seara, deoarece unele unguente oftalmice formează cu lacrimile o emulsie ce împiedică vederea. Unguentele oftalmice pot conține: agenți antimicrobieni (antibacteriene, antivirale), midriatrice, antiinflamatoare.

Ex.: Kanamicina sulfat 1% ung. oft., Tobradex ung. oft., Zovirax ung. oft.

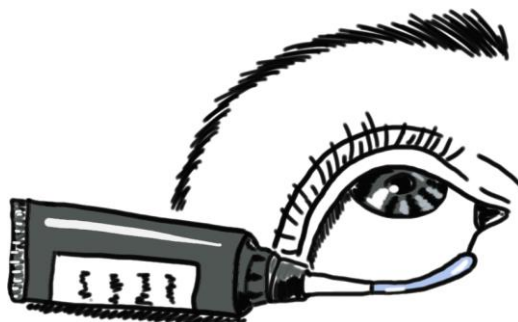


Figura 18. Modul de aplicare a unguentelor oftalmice

- **insert oftalmic:** preparat solid steril, cu aspectul unei lentile de contact de dimensiuni foarte mici. Se aplică în sacul conjunctival

pentru efect local, produs de eliberarea substanței active într-o perioadă de timp determinată. Constă dintr-un rezervor cu substanța activă încorporat într-o matrice sau delimitat de o membrană de control a vitezei de eliberare.

Ex. : Ocusert, insert oftalmic cu pilocarpină, ce se aplică sub pleoapa inferioară fiind necesară o singură aplicare pe săptămână pentru a realiza o concentrație constantă și eficientă în glaucomul cronic.

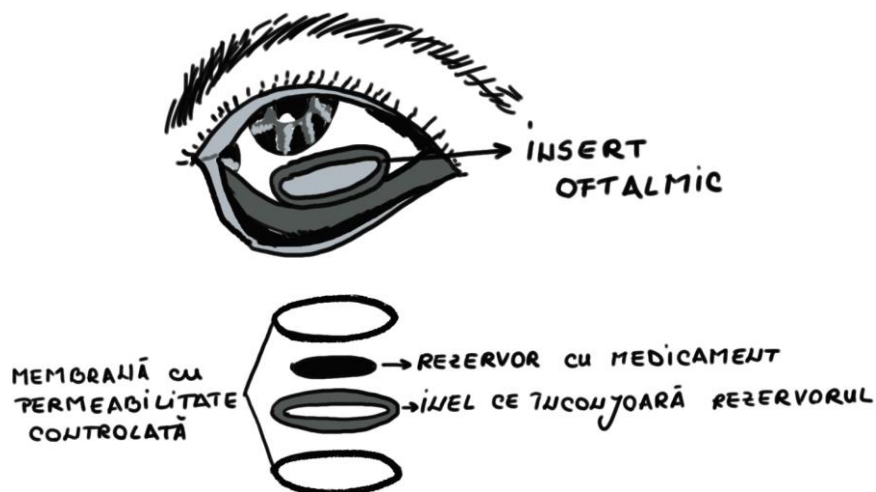


Figura 19. Insert oftalmic

Mydriaserit insert oftalmic conține tropicamidă și fenilefrină hidroclorică, utilă pentru obținerea midriazei preoperatorii sau necesară diagnosticării ochiului, atunci când monoterapia e insuficientă. Se aplică cu 2 ore înaintea procedurii.

VII. AEROSOLII MEDICAMENTOȘI

Aerosolii farmaceutici sunt sisteme disperse eterogene la care faza internă este un lichid sub formă de picături fine dispersate în faza externă gazoasă, cu ajutorul unor dispozitive speciale. Sunt utilizați pentru tratamentul diferitelor afecțiuni: astm, traheite, laringite, bronșite, pneumonii. Substanțele active administrate sub această formă fac parte din

diferite clase farmacodinamice: simpatomimetice, parasimpatolitice, anestezice locale, antibiotice, antihistaminice, etc.

Avantajele aerosolilor:

- ✓ asigură o administrare comodă la nivelul arborelui respirator, ușor acceptată de pacienți;
- ✓ substanțele active evită bariera hepatică și acțiunea sucurilor digestive;
- ✓ absorbția medicamentelor pe cale transpulmonară este comparabilă cu cea obținută pe cale parenterală;
- ✓ substanțele medicamentoase administrate ca aerosoli sunt utilizate în doze reduse față de alte căi de administrare;
- ✓ dispozitivele folosite asigură și o dozare exactă a medicamentului;
- ✓ în funcție de mărimea particulelor substanței active, se poate dirija nivelul de penetrație în arborele respirator, de la fosele nazale până la nivelul alveolelor pulmonare.

Dezavantaje:

- ✓ posibilă intoleranță locală, manifestată prin tuse și bronhospasm;
- ✓ eficacitatea terapeutică depinde de coordonarea dintre eliberarea pufului și inspir, mai greu de realizat de către unii pacienți (copii, bătrâni);
- ✓ depunerea principiului activ preferențial în cavitatea bucală și orofaringe poate favoriza apariția candidozei orofaringiene (corticoizii inhalatori).

Preparatele pentru inhalații se prezintă sub formă lichidă (soluții, suspensii, emulsii) sau solidă (pudre) și sunt destinate administrării pe cale respiratorie pentru acțiune locală sau sistemică. Atât preparatele lichide cât și cele solide sunt transformate în aerosoli în vederea administrării.

Tipuri de dispozitive pentru aerosoli de inhalație:

- *nebulizatoarele* transformă medicamentele lichide în particule foarte fine, ușor de inhalat pe mască;
- *dispozitive de aerosolizare cu valvă dozatoare* (MDI = “metered-dose inhalers”) sunt cele mai utilizate, conținând aproximativ 200 de doze unitare; pot fi utilizate singure sau împreună cu un spacer.

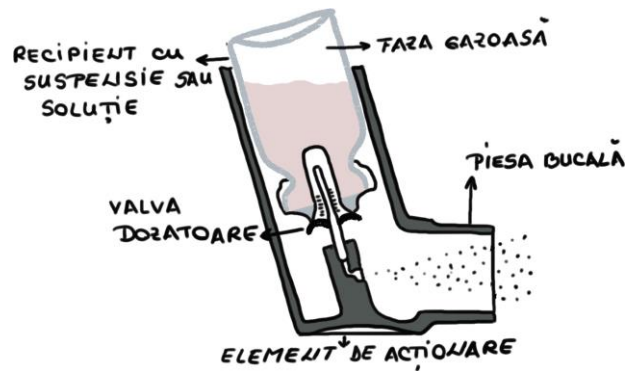


Figura 20. Dispozitiv de aerosolizare cu valvă dozatoare

Spacer-ul este un dispozitiv care facilitează administrarea medicamentului prin eliminarea necesității coordonării între inspir și elementul de acționare a dispozitivului cu valvă dozatoare. Contine o extremitate unde dispozitivul de aerosolizare este atașat și o extremitate (piesa bucală) prin care pacientul inspiră substanța medicamentoasă.

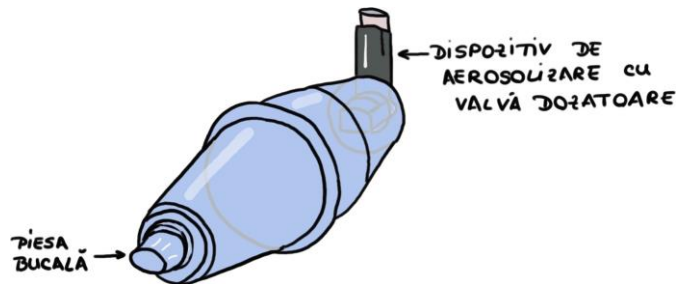


Figura 21. Dispozitiv de aerosolizare cu valvă dozatoare

- dispozitive pentru inhalarea orală a pulberilor (spinaler, rotahaler, diskhaler) la care principiul activ sub formă de pudră este eliberat și aspirat în cazul unui inspir profund.

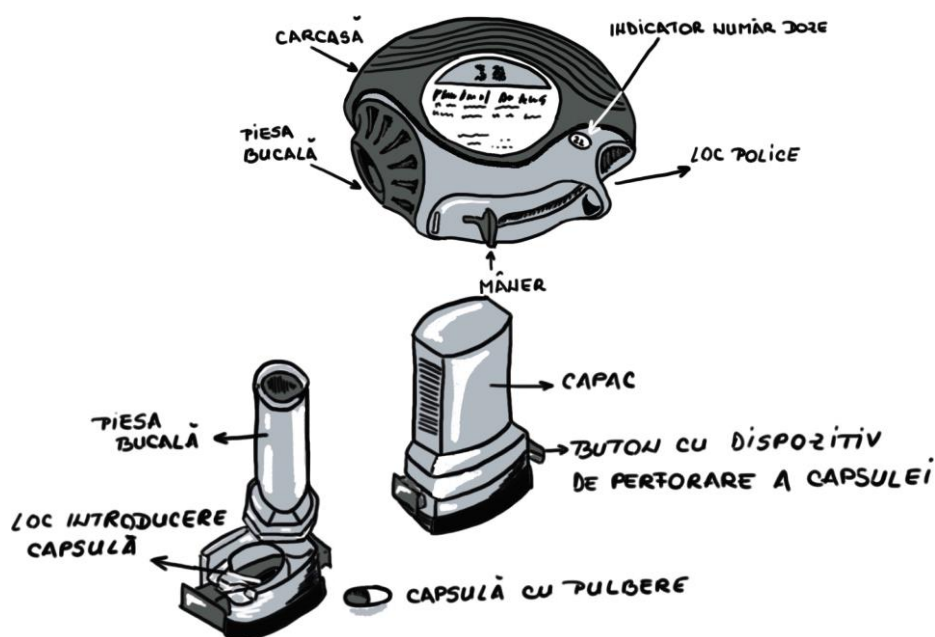


Figura 22. Dispozitive pentru inhalarea orală a pulberilor

Formele farmaceutice administrate pe cale inhalatorie sunt:

- **soluții, suspensii sau emulsii de inhalat prin nebulizator:** preparate lichide care se administrează prin inhalare, fiind transformate în aerosoli printr-un nebulizator de uz continuu sau cu doze măsurate.
Ex.: Fluimucil sol. inhal. nebulizator, Ipratropiu/Salbutamol sol. inhal. nebulizator, Flixotide Nebules susp. inhal. nebulizator.
- **soluție, suspensie sau emulsie de inhalat presurizată:** preparat lichid multidoză, administrat prin inhalare și condiționat într-un recipient presurizat cu valvă dozatoare.
Ex.: Symbicort susp. inhal. presurizată, Salbutamol Sandoz susp. inhal. presurizată, Berotec sol. inhal. presurizată.
- **pulbere de inhalat:** preparat solid, unidoză sau multidoză care se administrează prin inhalare ; constă din una sau mai multe substanțe active, care se administrează printr-un inhalator pentru pulberi uscate prevăzut cu mecanism dozator.
Ex.: Pulmicort Turbuhaler pulb. inhal., Symbicort Turbuhaler pulb. inhal., Frenolyn pulb. inhal.

- ***capsula cu pulbere de inhalat***: preparat solid unidoză, sub formă de pulbere inclusă într-o capsulă gelatinoasă tare, care se introduce într-un inhalator.
Ex.: Spiriva caps. pulb. inhal., Seebri Breezhaler caps. pulb. inhal., Pneumera caps. pulb. inhal.
- ***vapori de inhalat soluție, pulbere sau comprimat***: preparate lichide, semisolide sau solide care generează vapori pentru inhalare, în vederea obținerii unui efect local. Vaporii sunt generați prin introducerea preparatului respectiv în apă fierbinte.
Ex.: Karvol sol. vap. inhal., Pulmozyme sol. inhal.
- ***vapori de inhalat unguent***: preparat semisolid care generează vapori de inhalat pentru a se obține un efect local.
Ex.: Wick Vaporub ung. vap. inhalat.

VIII. FORME FARMACEUTICE ADMINISTRATE PE CALE CUTANATĂ

Sunt forme farmaceutice lichide, solide sau semisolide destinate administrării pe piele, cu efect local sau sistemic.

- ***loțiuni*** sunt soluții apoase de uz extern, utilizate pentru întreținerea pielii feței, capului, mâinilor sau a părului, reprezentând un grup de preparate farmaceutice dermato-cosmetice. Conțin substanțe antiseptice, antiparazitare (sulf), tonifiante (ulei de ricin), etc.
- ***spirturi***: soluții alcoolice incolore, ce conțin substanțe medicamentoase dizolvate în alcool etilic de diferite concentrații sau soluții alcoolice colorate (tincturi), destinate administrării pe piele, sub formă de badijonări sau frecții.
Ex.: soluția alcoolică iod-iodurată (impropriu numită tinctură de iod), spirtul camforat 10%.
- ***soluții cutanate***: forme farmaceutice lichide de uz extern, conținând una sau mai multe substanțe active dizolvate într-un solvent.
Ex.: Betadine sol. cut., Clavusin sol. cut., Dermovate sol. cut., Exoderil sol. cut., Iodosept sol. cut.

- **aerosolii pentru uz extern** sunt utilizați topic, în dermatologie, în diferite afecțiuni ale pielii și mucoaselor. Aerosolii pentru uz dermatologic pot conține substanțe cu rol antiseptic, bactericid, cicatrizant, antiinflamator (nesteroidian), siccativ etc.
Ex.: Ketospray spray cutanat, Lidocain spray; Articare Cold Spray oferă răcire imediată și îndepărtează rapid durerea cauzată de întinderi, entorse și luxații.
- **pulberile de uz extern sunt preparate farmaceutice solide, alcătuite din particule uniforme ale uneia sau mai multor substanțe active, cu sau fără auxiliari, aplicate pe tegumente sau mucoase.**
Ex.: Catix Pudră Cicatrizantă cu Colagen, Baneocin pulb. cut., Bivacyn pulb. cut.
- **unguentele și gelurile** sunt preparate farmaceutice semisolide destinate aplicării pe piele sau mucoase; după acțiunea terapeutică, ele pot fi unguente: de acoperire sau protectoare, cosmetice (emoliente, hidratante) sau pot conține antiseptice, antiinflamatoare, antibiotice, chimioterapice, antimicotice, antiparazitare, etc.
Ex.: Neopreol ung., Clobetasol ung., Locoid ung.
Pe lângă denumirea de unguent, se mai folosesc și următoarele:
 - pomezi - consistență semisolidă, se înmoaie când sunt frecate pe piele și formează un film superficial gros;
 - cremele - unguente-emulsii cu conținut ridicat de apă și consistență mai scăzută;
 - pastele - preparate cu conținut mare de pulberi și consistență crescută; nu se topesc la temperatura corpului, iar prin întindere pe piele formează un film protector.
- **sisteme cu eliberare transdermică (SET):** plasturele transdermic este un preparat farmaceutic de mărimi variabile ce se aplică pe pielea intactă, în anumite regiuni anatomice (torace, abdomen, retroauricular) pentru acțiune sistemică.



Figura 23. Secțiune transversală prin sistemul terapeutic transdermic

Avantajele sistemelor terapeutice transdermice:

- ✓ evitarea degradării substanței medicamentoase la nivel intestinal sau hepatic;
- ✓ realizarea unui efect farmacologic similar celui obținut după administrarea în perfuzie i.v. a substanței medicamentoase: o concentrație plasmatică constantă și eliberarea cu viteză controlată a principiului activ pe un interval de minim 24 de ore;
- ✓ calea transdermică este adecvată administrării medicamentelor cu timp de înjumătățire scurt, biodisponibilitate scăzută sau cu fereastră terapeutică îngustă.

Principalul **dezavantaj** al sistemelor de eliberare transdermică provine din faptul că pielea este o barieră foarte eficientă; ca urmare, doar medicamentele ale căror molecule sunt suficient de mici (800-1.000 Daltoni) pentru a penetra pielea pot fi administrate eficient pe această cale, bazată pe fenomene de difuzie.

Componentele plasturilor transdermici

În principiu, plasturii sunt formați dintr-un suport extern pe care este fixat preparatul ce conține substanța medicamentoasă, aflată într-o matrice polimerică, alături de activatori de penetrare, plastifianți și alți excipienți necesari. Peste acestea este un film protector, care se îndepărtează înainte de fixarea pe piele, având rol de protecție a preparatului farmaceutic. Între cele două folii se află substanța activă, înglobată într-un sistem polimeric, ce asigură eliberarea controlată a acesteia.

Tipuri de plasturi transdermici și mecanisme de eliberare a substanțelor active

Au fost formulate diverse tipuri de cedare controlată a substanței active, din ce în ce mai performante.

1. Plasture tip dispersie în adeziv

Substanța activă este dispersată în stratul adeziv, care are dublu rol: de lipire pe suprafața cutanată și de eliberare a medicamentului în stratul cornos. Acest tip de formulare poate fi și multistrat : primul, care vine în contact cu epiderma eliberează imediat substanța activă, în timp ce straturile succesive determină eliberarea controlată a principiului activ. Pe același principiu se fabrică și plasturii în care substanța activă din stratul adeziv eliberează vapori, fiind utilizate pentru eliberarea de uleiuri esențiale cu rol

decongestionant, pentru îmbunătățirea calității somnului sau reducerea nevoii de fumat.

2. *Plasture tip rezervor*

Substanța activă (nitroglicerină, scopolamină) sub formă de soluție sau suspensie este dispersată în matricea polimerică solidă și constituie rezervorul. Acesta este încorporat într-un suport impermeabil din plastic laminat și acoperit cu o membrană de control a vitezei de eliberare a substanței active, protejată de un film protector.

3. *Plasture tip matrice*

Substanța activă (nicotină, rivastigmină, fentanil) este dispersată omogen într-o matrice semisolidă de polimer hidrofil sau lipofil.

4. *Plasture tip microrezervor*

Sistemul de cedare a substanței active reprezintă o combinație între rezervor și matrice. Rezervorul este format prin suspendarea substanței active într-o soluție apoasă de polimer solubil în apă și apoi se dispersează soluția omogen într-un polimer lipofil, formând sfere microscopice de rezervor de medicament.

Exemple de plasturi transdermici:

- ✓ plasturi cu Nitroglicerină, utili pentru profilaxia crizelor anginoase în cardiopatia ischemică: Deponit, Nitrodisc, Nitrodur, TransdermNitro;
- ✓ plasture conținând Clonidină, cu efect antihipertensiv: Catapres-TTS;
- ✓ lidocaina, anestezic local, se găsește sub formă de plasture sub denumirea Lidoderm și asociată epinefrinei în produsul Iontocaina;
- ✓ capsaicina, substanță utilă în durerile neuropatice : Quetenza;
- ✓ fentanilul, analgezic opioid este inclus în SET: Duragesic, Ionsys;
- ✓ rotigotina, utilă în boala Parkinson este inclusă în SET: Neupro ;
- ✓ rivastigmina, indicată în demență: Exelon ;
- ✓ nicotina, administrată sub formă de SET în dependența de tutun, se găsește sub diferite denumiri comerciale: Prostep, Nicotrol, Habitraol ;
- ✓ testosteronul indicat în hipogonadism și disfuncții sexuale: Androderm, Testoderm TTS, Intrinsa;
- ✓ oxibutinin, util în incontinența urinară: Kentera;
- ✓ estradiolul indicat în sindromul postmenstrual: Climara, Vivelle, Estraderm;
- ✓ asocierea norelgestromin și etinilestradiol se găsește în preparatul contraceptiv Evra ;
- ✓ scopolamina, utilă în răul de mișcare: Transderm Scop.



VERIFICAREA CUNOȘTIȚELOR

1. Eliberarea substanței active la 2 - 4 ore după administrare este caracteristică pentru:
 - a. cpr. cu eliberare prelungită;
 - b. cpr. cu eliberare secvențială;
 - c. sisteme cu eliberare transdermică;
 - d. cpr. cu eliberare întârziată;
 - e. cpr. cu eliberare bifazică.

2. Supozitoarele:
 - a. au ca excipient untul de cacao;
 - b. se topesc la temperatura corpului;
 - c. suferă efectul primului pasaj hepatic;
 - d. sunt utile în pediatrie;
 - e. au numai efect local.

3. Formele farmaceutice vaginale:
 - a. trebuie să fie sterile;
 - b. au acțiune sistemică;
 - c. se folosesc comprimate cu efervescentă;
 - d. ovulele sunt alcătuite din gelatină și glicerină;
 - e. DIU acționează 3-5 ani.

4. Sunt forme farmaceutice rino-faringiene:
 - a. erine;
 - b. spray;
 - c. sisteme membranare;
 - d. colire;
 - e. crème.

5. Comprimatele sublinguale:

- a. asigură un efect terapeutic rapid;
 - b. asigură un efect terapeutic prelungit;
 - c. se administrează o dată pe zi;
 - d. se dizolvă în apă înainte de administrare;
 - e. pot fi utilizate în urgențe.
6. Sunt forme farmaceutice buco-faringiene:
- a. comprimate retard;
 - b. guma masticabilă;
 - c. drajee;
 - d. comprimate efervescente;
 - e. comprimate orodispersabile.
7. Au acțiune rapidă, fiind utile în urgențe:
- a. comprimat mucoadeziv;
 - b. granule homeopate;
 - c. spray sublingual;
 - d. comprimat sublingual;
 - e. gel bucal.
8. Formele farmaceutice oftalmice:
- a. trebuie încălzite la temperatura corpului;
 - b. sunt sterile;
 - c. au efecte adverse mai frecvente la copii;
 - d. produc uneori intoleranță locală;
 - e. pot produce sensibilizări.
9. Aerosolii de inhalație:
- a. evită bariera hepatică;
 - b. doze mai mari față de alte căi de administrare;
 - c. absorbția transpulmonară comparabilă cu cea orală;
 - d. mărimea particulelor dirijează nivelul de acțiune;
 - e. necesită coordonare eliberare puf – inspir.
10. Sistemele terapeutice transdermice au următoarele avantaje:
- a. evită degradarea SM la nivel intestinal sau hepatic;
 - b. asigură o concentrație plasmatică constantă;
 - c. utile pentru medicamente cu $T_{1/2}$ lung;
 - d. permit administrarea SM cu fereastră terapeutică îngustă;
 - e. se pot administra molecule de 10.000 Daltoni.