



CHIMICA FARMACEUTICA APPLICATA (5 crediti, 30 ore)

DOCENTE: Beatrice Perissutti

bperissutti@units.it

tel. 040-5583106

stanza 171, Dip. Scienze Farmaceutiche



PROGRAMMA

- Studi di preformulazione nello sviluppo di un farmaco Proprietà fisicochimiche e biofarmaceutiche che influenzano la disponibilità biologica del principio attivo (stabilità chimica, solubilità, velocità di dissoluzione, costante di dissociazione, coefficiente di ripartizione, cristallinità, polimorfismo, solvatazione e dimensioni particellari). Studi di compatibilità farmaco-eccepiante. La diffrattometria dei raggi X nell'indagine dello stato solido delle sostanze farmaceutiche Raggi X: proprietà, diffrazione (legge di Bragg) e applicazioni nella caratterizzazione e nell'analisi strutturale di farmaci ed eccepianti. Distinzione tra sostanze amorphe e cristalline e tra modificazioni polimorphe.
- Tecniche termoanalitiche nell'indagine dello stato solido delle sostanze farmaceutiche Metodi di analisi termica: calorimetria differenziale a scansione (DSC), analisi termogravimetrica (TG), analisi termomeccanica (TMA) e analisi termomicroscopica (hot stage microscopy, HSM). Principi della DSC a flusso di calore e a compensazione di potenza; informazioni DSC sull'evento termico; impieghi nelle caratterizzazione e identificazione delle materie prime (polimorfismo, solvatazione) e nello sviluppo di forme galeniche. Studi di compatibilità.
- Aspetti teorici della diffusione e della dissoluzione dei farmaci: Diffusione passiva e trasporto attraverso membrane. Velocità di dissoluzione dei farmaci: legge di Noyes-Whitney. Sink conditions, velocità di dissoluzione intrinseca.
- Proprietà fondamentali delle polveri: dimensioni, forma e area superficiale; porosimetria a mercurio.
- Approcci per migliorare le caratteristiche di biodisponibilità di farmaci scarsamente idrosolubili: dispersioni solide farmaco-polimero e complessi di inclusione farmaco-ciclodestrina.
- Cinetica chimica e studi di stabilità dei farmaci e dei preparati farmaceutici: Cenni di cinetica: velocità e ordine di reazione, equazioni cinetiche, $t_{1/2}$. Reazioni di decomposizione e possibilità di stabilizzazione dei farmaci. Stabilità e scadenza delle forme solide. Dipendenza della costante cinetica dalla temperatura: equazione di Arrhenius e test accelerati di stabilità.
- Sistemi dispersi: Tensione superficiale, bagnabilità e angolo di contatto. I tensioattivi. Influenza dei tensioattivi sull'assorbimento dei farmaci. Proprietà elettriche all'interfaccia. Potenziale zeta. Emulsioni e sospensioni.
- Materiali polimerici di interesse farmaceutico: Caratteristiche strutturali, pesi molecolari medi e grado di polimerizzazione dei polimeri. Grado di cristallinità, temperatura di transizione vetrosa, proprietà meccaniche. Solubilità dei polimeri.
- Alcune applicazioni dei sistemi polimerici nel rilascio di farmaci: sistemi matriciali e a riserva, ad erosione, pompe osmotiche, resine a scambio ionico, sistemi flottanti, mucoadesivi, profarmaci polimerici, liposomi e nanoparticelle.
-

TESTO CONSIGLIATO

- A.T. Florence e D. Atwood “Le basi chimico fisiche della tecnologia farmaceutica” - Edises

Modalità di esame

COMPITO SCRITTO

2 provette

(3 domande per esteso
ogni compito)

unico

(5 domande per esteso)

```
graph TD; A[COMPITO SCRITTO] --> B["2 provette  
(3 domande per esteso  
ogni compito)"]; A --> C["unico  
(5 domande per esteso)"];
```

OBIETTIVI

La Chimica farmaceutica applicata fornisce le basi chimico-fisiche della tecnologia farmaceutica.

La tecnologia farmaceutica ha lo scopo di:

1. elaborare nuove forme farmaceutiche o modificare quelle note in funzione di un differente obiettivo da raggiungere
2. Allestire una formulazione a rilascio immediato o ritardato, migliorare l'assorbimento e selezionare il sito di rilascio del principio attivo
3. dedicarsi alla produzione trasferendo le preparazioni dalla fase di laboratorio alla scala industriale, mettendo a punto nuovi procedimenti e perfezionando le tecniche di produzione.

DEFINIZIONI

LE PAROLE
SONO
IMPORTANTIIII!



medicinale

ogni sostanza o associazione di sostanze presentata come avente proprietà **curative o profilattiche** delle malattie umane, che possa essere utilizzata sull'uomo o somministrata all'uomo allo scopo di **ripristinare, correggere o modificare funzioni fisiologiche** esercitando un'azione farmacologica, immunologica o metabolica ovvero di stabilire una **diagnosi medica**.

- Esso viene sottoposto a trasformazioni al fine di poter assumere caratteristiche che ne consentano la somministrazione nell'uomo o nell'animale.
- La somministrazione del farmaco avviene mediante **forme farmaceutiche** fabbricate con l'impiego di sostanze ausiliarie, o **eccipienti**, in grado di favorirne la preparazione.

ECCIPIENTE

- L'**eccipiente** è qualunque componente (INERTE), diverso dal principio attivo, presente in una preparazione medicinale o usato nella produzione della preparazione.
- La funzione di un eccipiente è quella di operare come **vettore** del principio attivo e

contribuire alle caratteristiche del prodotto:

- stabilità,
- profilo biofarmaceutico,
- proprietà organolettiche,
- gradimento da parte del paziente,
- facilitare l'allestimento della preparazione...