



SCHEDA DELL'INSEGNAMENTO (SI)

"TECNICHE PER LA DEFINIZIONE DEL PROFILO CHIMICO-FISICO DI PRODOTTI FARMACEUTICI E NUTRACEUTICI"

SSD CHIM/08

DENOMINAZIONE DEL CORSO DI STUDIO: CONTROLLO DI QUALITA'

ANNO ACCADEMICO 2021-2022

INFORMAZIONI GENERALI - DOCENTE

DOCENTE: ROLANDO CANNALIRE

TELEFONO: 081-678737

EMAIL: rolando.cannalire@unina.it

INFORMAZIONI GENERALI - ATTIVITÀ

INSEGNAMENTO INTEGRATO (EVENTUALE): A SCELTA

MODULO (EVENTUALE):

CANALE (EVENTUALE):

ANNO DI CORSO: II/III

SEMESTRE: II

CFU: 6

INSEGNAMENTI PROPEDEUTICI (se previsti dal Regolamento del CdS)

Nessuno

EVENTUALI PREREQUISITI

Nozioni acquisite con lo studio della Chimica Organica, Chimica Farmaceutica, Chimica Analitica

OBIETTIVI FORMATIVI

Il corso intende fornire conoscenze e competenze sulla determinazione sperimentale di parametri chimico-fisici associati a prodotti farmaceutici e nutraceutici, in quanto importanti proprietà che devono essere definite come pre-requisito per studi di ADME.

RISULTATI DI APPRENDIMENTO ATTESI (DESCRITTORI DI DUBLINO)

Conoscenza e capacità di comprensione

Il percorso formativo è orientato a trasmettere le capacità operative necessarie per la determinazione delle proprietà chimico-fisiche che influenzano il profilo di farmaci e prodotti nutraceutici su piccola scala di laboratorio e su scala industriale. In particolare, lo studente imparerà come: i) individuare le metodiche da applicare ai concetti generali; ii) applicare le metodiche medesime a casi specifici; iii) riconoscere e analizzare i parametri da modificare per ottimizzare l'effetto benefico di tali prodotti.

Le abilità comunicative attese al termine del corso sono la capacità di individuare ed esaminare:

- i) il profilo chimico-fisico dei prodotti farmaceutici e nutraceutici
- ii) i processi analitici e i relativi controlli di qualità per la determinazione di tali proprietà
- iii) le ricadute applicative, scientifiche, terapeutiche ed economiche delle tematiche affrontate.

Capacità di applicare conoscenza e comprensione

Le conoscenze e le capacità acquisite dallo studente gli consentiranno di intraprendere percorsi successivi di ampliamento, approfondimento e aggiornamento delle tematiche trattate. In particolare, le basi acquisite sulla determinazione di proprietà chimico-fisiche di prodotti farmaceutici e nutraceutici consentiranno di affrontare percorsi formativi specialistici atti a rendere lo studente capace di scegliere e utilizzare le migliori tecniche secondo le esigenze del progetto e del campione, con particolare riguardo alla parte di interesse industriale.

PROGRAMMA

Introduzione: proprietà chimico-fisiche dei farmaci e dei componenti attivi dei prodotti nutraceutici.

Richiami e approfondimenti sui concetti di: solubilità, bilancio idrofilia/lipofilia, proprietà acido-base e ionizzazione (LogS, LogP/D, pKa); effetto del legame a idrogeno; effetto di carica; effetto della lipofilia; plasma protein binding, blood/plasma partition, cell permeability.

Introduzione alla determinazione di proprietà chimico-fisiche: descrizione dei principi teorici e dei metodi applicativi delle tecniche di analisi per la determinazione delle proprietà chimico-fisiche dei farmaci e dei componenti attivi in prodotti nutraceutici, su piccola scala di laboratorio e a livello industriale.

Tecniche per la misurazione delle proprietà acido-base (pKa) ed implicazioni: metodi per la misurazione delle proprietà acido-base; effetto del pKa sulla permeabilità e la solubilità. Metodi low-throughput per la determinazione del pKa.

Tecniche per la misurazione della solubilità (LogS) ed implicazioni: solubilità apparente e solubilità intrinseca; solubilità cinetica e solubilità termodinamica. e loro applicazioni in drug discovery e drug development. Metodi low-throughput e high-throughput per la determinazione sperimentale della solubilità.

Determinazione della lipofilia (LogP e LogD) ed implicazioni: Metodi diretti e metodi indiretti per la misurazione del bilancio lipofilia/idrofilia (LogP, LogD).

Processi di assorbimento-permeabilità: sull'attraversamento delle membrane biologiche e misurazione di permeabilità in diversi sistemi surrogati. Relazione fra pKa, solubilità, lipofilia, permeabilità e ripartizione.

Casi studio per ogni tecnica e correlazione

Dimostrazioni pratiche: esperienze su metodi low-throughput per la determinazione di solubilità, della lipofilia, della stabilità di un analita in un modello di assorbimento gastrointestinale

MATERIALE DIDATTICO

- Materiale didattico fornito dal docente.
- Physicochemical and Biomimetic Properties in Drug Discovery: Chromatographic Techniques for Lead Optimization, Autore: Klara Valko, Casa editrice: Wiley
- Molecular Drug Properties: Measurement and Prediction, Autore: Raimund Mannhold, Casa editrice: Wiley
- Solubility, Delivery and ADME Problems of Drugs and Drug-Candidates, Autore: Karoly Tihanyi, Monika Vastag, Casa editrice: Bentham
- Physicochemical Principles of Pharmacy, Autore: A. T. Florence, D. Attwood, Casa editrice: Springer
- Essential Pharmacokinetics, Autore: Thorsteinn Loftsson, Casa editrice: Academic Press
- Elementi essenziali di farmacocinetica, Autore: Donald J. Birkett, Casa editrice: Piccin

MODALITÀ DI SVOLGIMENTO DELL'INSEGNAMENTO

Lezioni Frontali.

Esercitazioni teorico/pratiche dimostrative

VERIFICA DI APPRENDIMENTO E CRITERI DI VALUTAZIONE

a) Modalità di esame:

L'esame si articola in prova	
scritta e orale	
solo scritta	
solo orale	X
discussione di elaborato progettuale	
altro	

In caso di prova scritta i quesiti sono (*)	A risposta multipla	
	A risposta libera	
	Esercizi numerici	

(*) È possibile rispondere a più opzioni

b) Modalità di valutazione:

Il voto finale d'esame è espresso in trentesimi da 18/30 a 30/30 e lode e tiene conto del livello di conoscenza dei contenuti del programma, della chiarezza espositiva e della capacità di effettuare collegamenti interdisciplinari.

L'attribuzione del voto avviene secondo i criteri riportati in Tabella:

Voto	Descrittori
< 18 insufficiente	Conoscenze frammentarie e superficiali dei contenuti, errori nell'applicare i concetti, esposizione carente
18 - 20	Conoscenze dei contenuti sufficienti ma generali, esposizione semplice, incertezze nell'applicazione di concetti teorici

21 - 23	<i>Conoscenze dei contenuti appropriate ma non approfondite, capacità di applicare i concetti teorici, capacità di presentare i contenuti in modo semplice</i>
24 - 25	<i>Conoscenze dei contenuti appropriate ed ampie, discreta capacità di applicazione delle conoscenze, capacità di presentare i contenuti in modo articolato.</i>
26 - 27	<i>Conoscenze dei contenuti precise e complete, buona capacità di applicare le conoscenze, capacità di analisi, esposizione chiara e corretta</i>
28 - 29	<i>Conoscenze dei contenuti ampie, complete ed approfondite, buona applicazione dei contenuti, buona capacità di analisi e di sintesi, esposizione sicura e corretta,</i>
30 30 e lode	<i>Conoscenze dei contenuti molto ampie, complete ed approfondite, capacità ben consolidata di applicare i contenuti, ottima capacità di analisi, di sintesi e di collegamenti interdisciplinari, padronanza di esposizione</i>