

<b>SCUOLA</b>	delle Scienze di Base e Applicate
<b>ANNO ACCADEMICO</b>	2014/2015
<b>CORSO DI LAUREA MAGISTRALE A CICLO UNICO</b>	Chimica e Tecnologia Farmaceutiche -2013
<b>INSEGNAMENTO</b>	Chimica Farmaceutica Applicata
<b>TIPO DI ATTIVITÀ</b>	Caratterizzante
<b>AMBITO DISCIPLINARE</b>	Discipline chimico-farmaceutiche e tecnologiche
<b>CODICE INSEGNAMENTO</b>	01868
<b>ARTICOLAZIONE IN MODULI</b>	NO
<b>NUMERO MODULI</b>	
<b>SETTORI SCIENTIFICO DISCIPLINARI</b>	CHIM/09
<b>DOCENTE RESPONSABILE</b>	Giannola Libero Italo Professore Associato Università di Palermo
<b>CFU</b>	8
<b>NUMERO DI ORE RISERVATE ALLO STUDIO PERSONALE</b>	140
<b>NUMERO DI ORE RISERVATE ALLE ATTIVITÀ DIDATTICHE ASSISTITE</b>	60
<b>PROPEDEUTICITÀ</b>	Nessuna. Sono indispensabili le nozioni acquisite nel corso di Tecnologia Farmaceutica
<b>ANNO DI CORSO</b>	IV
<b>SEDE DI SVOLGIMENTO DELLE LEZIONI</b>	Dipartimento di STEBICEF
<b>ORGANIZZAZIONE DELLA DIDATTICA</b>	Lezioni frontali, Esercitazioni in aula
<b>MODALITÀ DI FREQUENZA</b>	Non obbligatoria
<b>METODI DI VALUTAZIONE</b>	Prova Orale
<b>TIPO DI VALUTAZIONE</b>	Voto in trentesimi
<b>PERIODO DELLE LEZIONI</b>	primo semestre
<b>CALENDARIO DELLE ATTIVITÀ DIDATTICHE</b>	<a href="http://offweb.unipa.it/">http://offweb.unipa.it/</a>
<b>ORARIO DI RICEVIMENTO DEGLI STUDENTI</b>	Lunedì 12.00-14.00

#### **RISULTATI DI APPRENDIMENTO ATTESI**

##### **Conoscenza e capacità di comprensione**

Implementazione di:

- Conoscenza degli elementi di base per la progettazione e lo sviluppo di forme innovative per la somministrazione dei farmaci.
- Conoscenza degli attuali sviluppi delle forme non convenzionali di dosaggio. Conoscenza delle metodologie in vitro ed ex vivo per la valutazione dell'assorbimento dei farmaci.
- Capacità di aggiornamento, consultazione e divulgazione del materiale scientifico e delle pubblicazioni nell'ambito delle discipline farmaceutico-tecnologico-applicative.

##### **Capacità di applicare conoscenza e comprensione:**

- Capacità di utilizzare il linguaggio specifico proprio di questa disciplina specialistica.
- Capacità di usare modelli matematici nella progettazione di forme di dosaggio.

**Autonomia di giudizio**

- Capacità di valutare le implicazioni e i risultati degli studi volti a ottimizzare la somministrazione dei farmaci e la loro biodisponibilità.

**Abilità comunicative**

- Capacità di esporre i risultati degli studi anche ad un pubblico non esperto.  
- Capacità di evidenziare le ricadute dello sviluppo di nuove forme di dosaggio dei farmaci sulla società.

**Capacità d'apprendimento**

- Capacità di utilizzare gli elementi basilari per la progettazione e realizzazione di nuovi sistemi terapeutici a rilascio controllato e nuovi metodi di somministrazione di un principio attivo.

**OBIETTIVI FORMATIVI DEL CORSO**

Il Corso intende fornire agli studenti le conoscenze fondamentali sui fattori che determinano l'assorbimento e la biodisponibilità dei farmaci connesse alla forma di dosaggio somministrata. Particolare considerazione è rivolta alle forme di rilascio modificato, sostenuto e controllato. Vengono altresì forniti gli elementi basilari per la progettazione e realizzazione di sistemi terapeutici a rilascio controllato e nuovi metodi di somministrazione di un principio attivo. Il Corso, oltre ad incidere sulle conoscenze professionali, tende a soddisfare alcune specifiche esigenze di professionalità richieste dall'industria farmaceutica al laureato in C.T.F.

<b>CORSO</b>	<b>CHIMICA FARMACEUTICA APPLICATA</b>
<b>ORE FRONTALI</b>	<b>LEZIONI FRONTALI</b>
6	Fattori che influenzano e determinano l'assorbimento e la biodisponibilità dei farmaci: biodisponibilità, equivalenza chimica, equivalenza clinica, equivalenza terapeutica, bioequivalenza. Vie di somministrazione dei farmaci. Fase biofarmaceutica, fase farmacocinetica e fase farmacodinamica. Processi di dissoluzione delle forme farmaceutiche convenzionali. La somministrazione perorale: effetti del pH e progressione attraverso il tratto gastrointestinale. Teoria della dissoluzione: la dissoluzione come fenomeno chimico-fisico. Modello di Wagner.
6	Modelli matematici e loro applicazione. Modelli per lo studio dell'assorbimento e della biodisponibilità dei farmaci. Principi fondamentali; costanti di velocità; tempo di emivita biologica; volume di distribuzione; clearance.
3	I meccanismi di trasporto: diffusione passiva e processi cinetici del primo ordine; trasporto attivo e trasporto facilitato; diffusione ionica o elettrochimica.
8	Concetto di compartimento. Modello ad un compartimento aperto. Somministrazioni intravascolari rapide. Infusioni intravascolari lente. Fase di eliminazione. Calcolo della costante di eliminazione e dell'emivita biologica. Modello a due compartimenti chiusi; modello a due compartimenti aperti; modelli multicompartimentali. Andamento temporale della concentrazione di un farmaco nei vari compartimenti. Sviluppo di metodi matematici e grafici per la determinazione della velocità di assorbimento e di escrezione dei farmaci. Vantaggi dell'analisi compartimentale.
3	Modello di Wagner-Nelson per lo studio della bioequivalenza di forme di dosaggio extravascolari. Calcolo della dose biodisponibile. Somministrazioni extravascolari multiple. Regime di dosaggio.
3	Apparecchiature atte allo studio della biodisponibilità in vitro dei farmaci.

	Calcolo della costante di assorbimento. Correlazione tra i dati ottenuti in vitro e la biodisponibilità in vivo.
3	Proprietà chimico-fisiche dei farmaci e velocità di soluzione: solubilità dei farmaci, lipofilia e coefficiente di ripartizione, stato cristallino, polimorfismo, dimensioni delle particelle. Fattori chimici di dissoluzione: manipolazioni strutturali di un farmaco a scopo farmacocinetico.
4	Fattori tecnologici che influenzano la dissoluzione delle forme di dosaggio: fattori di formulazione e metodi per potenziare la solubilità dei farmaci e le caratteristiche di dissoluzione delle forme farmaceutiche. Biodisponibilità dei farmaci dopo somministrazione per via orale, percutanea, nasale, polmonare, oculare, rettale, vaginale, sublinguale, buccale.
4	Forme di dosaggio convenzionali a rilascio modificato. Sistemi di rivestimento delle forme di dosaggio convenzionali. Sistema Aquacoat-Aquateric. Sistema Eudragit. Acryl-eze. Sistema Sureteric e Surelease. Opadry e Opaglos. Compresse sandwich. Compresse quick-slow. Compresse a rilascio bimodale. Compresse swellable e compresse erodibili. Mucosal drug delivery. Teorie della mucoadesione.
8	Sistemi non convenzionali per il rilascio dei principi attivi. Rilascio sostenuto, rilascio controllato. Definizione del profilo di assorbimento da formulazioni a rilascio controllato. Vantaggi nell'uso delle forme farmaceutiche a rilascio controllato. Confronto tra biodisponibilità di farmaci rilasciati da forme farmaceutiche convenzionali e forme a rilascio controllato. Cinetiche implicate nel rilascio controllato. Sistemi terapeutici: definizione. Sistemi terapeutici open loop e close loop. Materiali usati nei dispositivi per il rilascio controllato. Uso dei profarmaci nel rilascio controllato e nel drug targeting. Sistemi terapeutici di rilascio a velocità preprogrammata: sistemi controllati dalla permeazione attraverso membrane polimeriche, sistemi reservoir, inserti oculari e TTS, diffusione da matrici polimeriche, sistemi monolitici, swellable system, ripartizione in microreservoir, sistemi impiantabili, cronosfere.
8	Sistemi di rilascio modulato dall'attivazione: sistemi attivati da pressione osmotica, pressione idrodinamica, pressione di vapore, mezzi meccanici, magnetici, iontoforesi, elettroporazione sonoforesi, idratazione, somministrazione di calore, pH, ioni, reazioni chimiche, enzimi, reazioni biochimiche. Chimica dei polimeri biodegradabili. Sistemi bioerodibili, matrici idrofile e sistemi pendant chains. Profarmaci macromolecolari. Sistemi di rilascio regolati da un meccanismo a feedback: Sistemi di rilascio site-targeting. Altri sistemi di rilascio controllato: sistemi radiocontrollati, sistemi con meccanismi di rilascio misti, smart systems. Sistemi di rilascio controllato per la somministrazione di insulina.
	<b>ESERCITAZIONI IN AULA</b>
4	Esempi di modellizzazione attraverso l'applicazione di sistemi multi-compartimentali. Discussioni guidate, role playing, simulazioni, project works.
<b>TESTI CONSIGLIATI</b>	- H. M. Abdou, <b>Dissolution, bioavailability and bioequivalence</b> , The MACK Publishing Company, 1989. - S. C. Chow, J. P. Liu, <b>Design and analysis of bioavailability and bioequivalence studies</b> , CRC Press, 2009.

- |  |   |
|--|---|
|  | <ul style="list-style-type: none"><li>- H. van de Waterbeemd, B. Testa, Drug bioavailability, Wiley, 2009.</li><li>- S. Kiyohiko Biopharmaceutics Modeling and Simulations, Theory, Practice, Methods, and Applications, Wiley, 2012.</li><li>- L. Shargel, S. Wu-Pong, A.B.C. Yu, Applied biopharmaceutics and pharmacokinetics, The McGraw Hill Companies, 2005.</li><li>- Drug delivery devices, General Books LLC, 2010.</li><li>- M. Schäfer-Korting, Drug delivery, Spinger, 2010.</li><li>- V.V. Ranade, J.B. Cannon, Drug delivery systems, CRC Press, 2011.</li><li>- G. S. Banker, C. T. Rhodes, Novel drug delivery systems M. Dekker, 1995.</li><li>- H. Wen, K. Park, Oral controller release: formulation design and drug delivery, theory to practice, Wiley, 2010.</li><li>- H.C. Ansel, L.V. Allen Jr., N.G. Popovich, Pharmaceutical dosage forms and drug delivery systems, Lippincott Williams &amp; Wilkins, 2004.</li></ul> |
|--|---|