

COURSE PROGRAM

A.Y.	SSD	COURSE	PROFESSOR	CFU
IV° YEAR	CHEM-08/A (ex CHIM/09)	BIOPHARMACEUTICS AND PREFORMULATION	FRANCO ALHAIQUE	6
	ATTENDANCE: 70% minimum	OFFICE HOURS: By email appointment	e-mail/contact: franco.alhaique@uniroma1.it	

SPECIFIC AIMS AND EXPECTED OUTCOMES

LEARNING OUTCOMES: This course will give detailed information on the stage of medicine development during which the physicochemical properties of the drugs and excipients are characterized and how such properties, as well as the dosage forms and routes of administration, affect the rate and extent of drug absorption. Both theoretical and practical points of view will be faced, thus allowing the formation of students provided with a valid background together with the constructive criticism needed by the pharmaceutical technologists when facing their professional responsibilities. The experience acquired from the lessons is fundamental for the students that will follow the course of pharmaceutical technologies and should give the possibility to find, after the final degree, an appropriate job within private or public pharmacies, but also in the field of industrial production and control of medicines as well as in innovative research.

KNOWLEDGE AND UNDERSTANDING: The student should at least acquire the information related to the methods for the physicochemical characterization of drugs and the related biopharmaceutical implications. He/she should also be capable to read and understand books and papers about these topics, also as far as the theory which is behind these subjects.

APPLYING KNOWLEDGE AND UNDERSTANDING: The student should be able to apply, at least on a basic level, the information acquired during the course in practical situations, such as during a usual work in a pharmacy, in a pharmaceutical industry or in a research laboratory; at the beginning probably under the supervision of an expert pharmacist or researcher. Reading and understanding of specific textbooks and articles should further improve his/her preparation.

MAKING JUDGEMENTS: Making autonomous judgements can be somehow limited at this stage, because an overall view of the skills that are actually needed in a practical work is still not completely acquired. Only at the end of the university studies a sufficient capacity of personal and autonomous judgement will be reached.

COMMUNICATION SKILLS: Students are expected to speak clearly and fluently in English with an appropriate technical language. Communication skills are fundamental and represent one of the main targets that should be reached in any kind of profession, but in particular in those that are related to personal and public health.

LEARNING SKILLS: The student will be able to read, to understand and, when needed, to practically apply the information present in scientific books and papers within the field of biopharmaceutics and preformulation. Thus he/she will be well acquainted with the specific type of language and terms that are characteristic of these topics.

OBIETTIVI E RISULTATI DI APPRENDIMENTO

OBIETTIVI FORMATIVI:

Questo corso intende fornire informazioni dettagliate riguardo quella fase di sviluppo dei medicinali relativa allo studio e alla caratterizzazione chimico-fisica dei principi attivi e degli eccipienti e come tali caratteristiche, insieme alla forma farmaceutica e la via di somministrazione, influiscono sulla biodisponibilità del farmaco e in definitiva sulla sua azione farmacologica. Questo insegnamento assicurerà agli studenti un valido background e uno spirito critico costruttivo necessario al tecnologo farmaceutico nello svolgimento delle proprie responsabilità professionali. L'esperienza acquisita durante le lezioni rappresenta una base fondamentale per il successivo corso di tecnologia farmaceutica e fornisce allo studente, una volta laureato, la possibilità di trovare lavoro sia presso farmacie private che pubbliche, ma anche in ambito della produzione e controllo dei medicinali a livello industriale così come nella ricerca innovativa.

CONOSCENZA E CAPACITÀ DI COMPrensIONE: Lo studente dovrà conoscere almeno le principali metodologie necessarie per la caratterizzazione chimico-fisica dei farmaci, anche in relazione alle implicazioni biofarmaceutiche, ed essere capace di leggere e comprendere i testi relativi a tali argomenti anche per ciò che riguarda la teoria che è alla base delle diverse formulazioni.

CAPACITÀ DI APPLICARE CONOSCENZA E COMPrensIONE: Lo studente dovrà essere capace di applicare, almeno a livello di base, le informazioni acquisite durante il corso in ambito pratico, come ad esempio in un lavoro routinario in farmacia, in una industria del settore o in un laboratorio di ricerca. In una fase iniziale dovrebbe essere opportuna la presenza di un supervisore. Le sue capacità potranno poi essere migliorate e sviluppate attraverso la lettura e la comprensione di testi specifici.

AUTONOMIA DI GIUDIZIO: L'autonomia di giudizio in questa fase dello studio potrà essere parzialmente limitata a causa di una visione ancora incompleta di tutte le competenze necessarie per l'esercizio della professione. Solo al

completamento del ciclo di studi, il/la laureato/a avrà acquisito la suddetta capacità di giudizio ed un'autonomia sufficiente nelle diverse situazioni di lavoro.

ABILITÀ COMUNICATIVE: Gli studenti saranno capaci di esprimersi correttamente in lingua inglese utilizzando la terminologia appropriata. La capacità di esporre e di comunicare concetti e informazioni tecniche dovrà costituire uno dei principali obiettivi da raggiungere in previsione dei rapporti interpersonali necessari in ogni tipo di professione ed in particolare in quelle collegate con la salute.

CAPACITÀ DI APPRENDIMENTO: Lo studente dovrà essere capace di leggere, comprendere e, se necessario, applicare sperimentalmente le nozioni presenti nei testi e negli articoli scientifici del settore della tecnologia farmaceutica. Dovrà quindi conoscere bene il linguaggio e i termini tecnici caratteristici della materia.

PREREQUISITES

To be able to follow the lessons, the student should have already the basic information of mathematics, chemistry, physics and biology.

PREREQUISITI

Per poter seguire con profitto le lezioni, lo studente deve aver già acquisito le conoscenze di base matematica, di chimica, fisica e biologia.

PROGRAM

The course will consist in frontal lessons (48 h) based on the following topics.

Outlines on Pharmaceutical Companies Organizational Structure. Active Pharmaceutical Ingredient (API) and Good Manufacturing Practice (cGMP). International Conference on Harmonization (ICH)

Introduction to biopharmaceutics and basic principles of pharmacokinetics. Blood levels and therapeutic effects. Routes of administration. Mechanisms of drug dissolution and absorption. Compartment models and pharmacokinetic parameters. Apparent distribution volume. ADME-PK and related Physicochemical Properties of Drugs. Drug-protein interaction.

API's Physical properties. Appearance and identity. Polymorphic form(s). Crystallinity. Melting point. Particle size, shape and surface area. Density. Hygroscopicity. Aqueous solubility as a function of pH. Solubility in organic solvents. Solubility in the presence of surfactants. Dissolution rate. Wetting phenomena. Partition coefficient (octanol/water).

API's Chemical properties. Ionization constant (pKa). Solubility product of salt forms. Chemical stability in solution and in solid state. Photolytic stability. Oxidative stability. Expiring date.

API's Mechanical properties

Basic principles of rheology. Elasticity. Viscoelasticity. Plasticity (hardness).

API's Biological properties.

Outlines
Impurities in New Drug Substances

PROGRAMMA

Il corso comprende lezioni frontali (48 ore) basate sulle seguenti tematiche.

Cenni sull'organizzazione e struttura di un'industria farmaceutica. I principi attivi (API). Le norme di buona fabbricazione dei medicinali (Good Manufacturing Practice / cGMP). Ruolo della International Conference on Harmonization (ICH)

Introduzione alla biofarmaceutica e principi generali di farmacocinetica. Livelli ematici ed effetto terapeutico. Vie di somministrazione. Meccanismi di dissoluzione e assorbimento. Modelli compartimentali e parametri farmacocinetici. Volume apparente di distribuzione. ADME-PK in relazione alle proprietà chimico-fisiche dei farmaci. Interazione farmaci proteine.

Proprietà fisiche di API. Aspetto e identità. Forme polimorfe. Cristallinità. Temperatura di fusione. Dimensioni, forme e area superficiale delle particelle. Densità. Igroscopicità. Solubilità in acqua (effetto pH), in solventi organici e in presenza di tensioattivi. Velocità di dissoluzione. Bagnabilità. Coefficiente di ripartizione (ottanolo/acqua).

Proprietà chimiche di API. Costante di ionizzazione (pKa). Prodotto di solubilità e Sali. Stabilità chimica in soluzione e in forma solida. Fotosensibilità. Processi di ossidazione. Scadenza.

Proprietà Meccaniche di API

Principi generali di reologia. Elasticità. Plasticità. Viscoelasticità. Durezza.

Cenni sulle proprietà biologiche di API nell'ambito delle questioni affrontate durante il corso

La questione delle impurezze.

Cenni sull'organizzazione e struttura di un'industria farmaceutica. I principi attivi (API). Le norme di buona fabbricazione dei medicinali (Good Manufacturing Practice / cGMP). Ruolo della International Conference on Harmonization (ICH)

TEXT BOOKS

- Aulton's Pharmaceutics: The design and manufacture of medicines" 5th Edition. Elsevier
- Tecnologia Farmaceutica a cura di Paolo Caliceti Casa Editrice Ambrosiana 2025.
- Principi di tecnica farmaceutica" Michele Amorosa (6th Edition, F. Barbato Ed.) Piccin Editore

- Pharmaceutical Preformulation and Formulation: A Practical Guide from Candidate Drug Selection to Commercial Dosage Form. Mark Gibson Ed. CRC Press
- Italian Pharmacopoeia and European Pharmacopoeia (last edition and supplements)

All these textbooks only for the chapters and or sections related to biopharmaceutics and preformulation and may be not needed for the students that regularly followed the lessons. Slides presented during the lessons will also be available.

TESTI ADOTTATI

- Aulton's Pharmaceutics: The design and manufacture of medicines" 5th Edition. Elsevier
- Tecnologia Farmaceutica a cura di Paolo Caliceti Casa Editrice Ambrosiana 2025.
- Principi di tecnica farmaceutica" Michele Amorosa (Sesta edizione a cura di Francesco Barbato) Piccin Editore
- Pharmaceutical Preformulation and Formulation: A Practical Guide from Candidate Drug Selection to Commercial Dosage Form. Mark Gibson Ed. CRC Press
- Italian Pharmacopoeia and European Pharmacopoeia (last edition and supplements).

Tutti questi testi solo per le parti riguardanti la biofarmaceutica e la preformulazione e possono essere non necessari per gli studenti che hanno seguito regolarmente le lezioni. Saranno anche messe a disposizione le slides proiettate durante le lezioni.

EXAM METHOD

Oral exam with discussion on topics faced during the lessons. The student should show that he/she has acquired the appropriate terminology of the various subjects. Critical reasoning and knowledge of the studied concepts is required.

MODALITA' D'ESAME

Esame orale con discussione su argomenti trattati a lezione. Lo studente/La studentessa dovrà mostrare di aver acquisito la corretta terminologia della materia, l'applicazione del ragionamento critico sviluppato a lezione e la conoscenza delle nozioni studiate.

EVALUATION

Failed exam: Poor or lacking knowledge and understanding of the topics; limited ability to analyze and summarize data and information, frequent generalizations of the requested contents; inability to use technical language.

18-20: Barely sufficient knowledge and understanding of the topics, with obvious imperfections; barely sufficient ability to analyze, summarize data and information, and limited autonomy of judgment; poor ability to use technical language.

21-23: Sufficient knowledge and understanding of the topics; sufficient ability to analyze, summarize data with the ability to reason with logic and coherence the required contents; sufficient ability to use technical language.

24-26: Fair knowledge and understanding of the topics; adequate ability to analyze and summarize data and information with ability to rigorously discuss the required contents; good ability to use technical language.

27-29: Good knowledge and understanding of the required contents; good ability to analyze and summarize data and information together with ability to rigorously discuss and present the required contents; good ability to use technical language.

30-30L: Excellent level of knowledge and understanding of the required contents with an excellent ability to analyze and synthesize data and information with the ability to discuss and present the required contents in a rigorous, innovative and original way; excellent ability to use technical language.

VALUTAZIONE

Non idoneo: Scarsa o carente conoscenza e comprensione degli argomenti; limitate capacità di analisi e sintesi, frequenti generalizzazioni dei contenuti richiesti; incapacità di utilizzo del linguaggio tecnico.

18-20: Appena sufficiente conoscenza e comprensione degli argomenti, con evidenti imperfezioni; appena sufficienti capacità di analisi, sintesi e autonomia di giudizio; scarsa capacità di utilizzo del linguaggio tecnico.

21-23: Sufficiente conoscenza e comprensione degli argomenti; sufficiente capacità di analisi e sintesi con capacità di argomentare con logica e coerenza i contenuti richiesti; sufficiente capacità di utilizzo del linguaggio tecnico.

24-26: Discreta conoscenza e comprensione degli argomenti; discreta capacità di analisi e sintesi con capacità di argomentare in modo rigoroso i contenuti richiesti; discreta capacità di utilizzo del linguaggio tecnico.

27-29: Buona conoscenza e comprensione dei contenuti richiesti; buona capacità di analisi e sintesi con capacità di argomentare in modo rigoroso i contenuti richiesti; buona capacità di utilizzo del linguaggio tecnico.

30-30L: Ottimo livello di conoscenza e comprensione dei contenuti richiesti con un'ottima capacità di analisi e sintesi con capacità di argomentare in modo rigoroso, innovativo e originale, i contenuti richiesti; ottima capacità di utilizzo del linguaggio tecnico.