

DUE STRATEGIE GALENICHE PER PERSONE DISFAGICHE E AFFETTE DA PARKINSONISMO GBA1-DIPENDENTE: SVILUPPO DI UN SISTEMA COMPLESSO DI MASCHERAMENTO DEL SAPORE DEL PRINCIPIO ATTIVO

X CONGRESSO NAZIONALE SIFAP – LA GALENICA COME FORMA DI INTELLIGENZA UMANA-VERONA 18-20 SETTEMBRE 2026

Sebastiano Cavallaro • Farmacia Nigro Maria, Siracusa (sebastianocavallaro10@gmail.com)

Master di II livello: Preparazioni galeniche per uso umano e veterinario — Università degli Studi di Roma “La Sapienza”, a.a. 2024–25

LA SFIDA GALENICA

ALTA DOSE: 500 mg x volte di
ambroxolo cloridrato per dose, circa x10 volte rispetto a formulazioni commerciali

Uso giornaliero per anni
Necessità di sicurezza per ogni singola componente per l'uso giornaliero e ripetuto negli anni
NOAEL → ADI (DGA)

Disfagia
difficoltà di deglutizione di forme solide e liquide

Caratteristiche organolettiche del P.A.
Amaro ad intensità elevatissima, insorgenza rapida, persistenza prolungata e sensazione pungente

CONTESTO E OBIETTIVI

MALATTIA

È la seconda più comune malattia neurologica dopo l'Alzheimer, più di 10mln di persone affette e in rapido incremento.

Classificazione eziopatogenica:

-80% "idiopatica", ovvero senza causa nota

-10% legata a mutazione dell'espressione GBA1

-10% tutte le altre

Patogenesi:

GBA1 ↓ → GCase ↓ → disfunzione lisosomiale → ↑ α-sinucleina → aggregazione → corpi di Lewy → neurodegenerazione

MECCANISMO D'AZIONE DEL P.A.

Ambroxolo cloridrato come chaperone farmacologico e induttore di espressione di glucocerebrosidasi (Gcase)

OBIETTIVI

Sviluppare due modalità di somministrazione alternative, adattabili alle possibilità tecnologiche del laboratorio galenico e alle esigenze del paziente e del caregiver.

STRATEGIA DI MASCHERAMENTO DELLE CARATTERISTICHE ORGANOLETTICHE

EDULCORANTI

Potenti, acalorici, aglicemizzanti, acariogeni

Sucralosio: rapida insorgenza, 500x saccarosio

saccarina sodica: rapida insorgenza, 300x saccarosio

ciclamato sodico: persistenza 40x saccarosio

ammonio glicirizzinato: persistenza e retrogusto aromatico 100x saccarosio

MODULAZIONE DEL pH

pH~ 7 per minore interazione con papille gustative...

ALTRO

Lecitina di soia: mascheramento dell'amaro [1] e funzione di tensioattivo edibile.

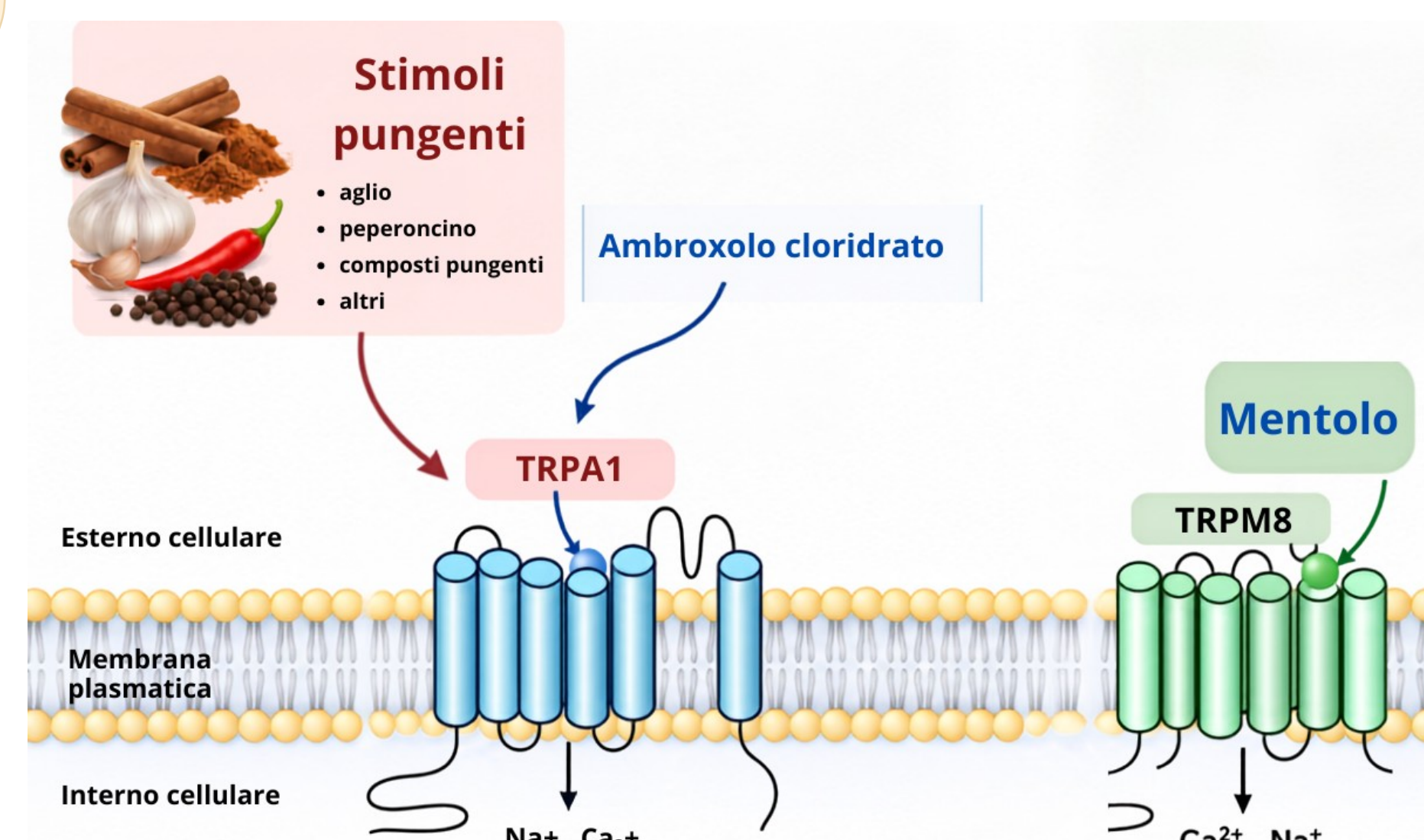
AROMI

Cacao: nota di cuore

Vaniglia: nota di fondo

"DISTRAZIONE" TRIGEMINALE

Mentolo: recettore TRPM8 innervazione trigeminale



DUE STRATEGIE TECNOLOGICHE

01 CAPSULE APRIBILI



02 SOSPENSIONE ACQUOSA CON SOLUZIONE "NEUTRALIZZANTE"



MOLECOLA E STABILITÀ DEL PRINCIPIO ATTIVO

Reazioni più probabili in sospensione acquosa:

gruppo R-OH

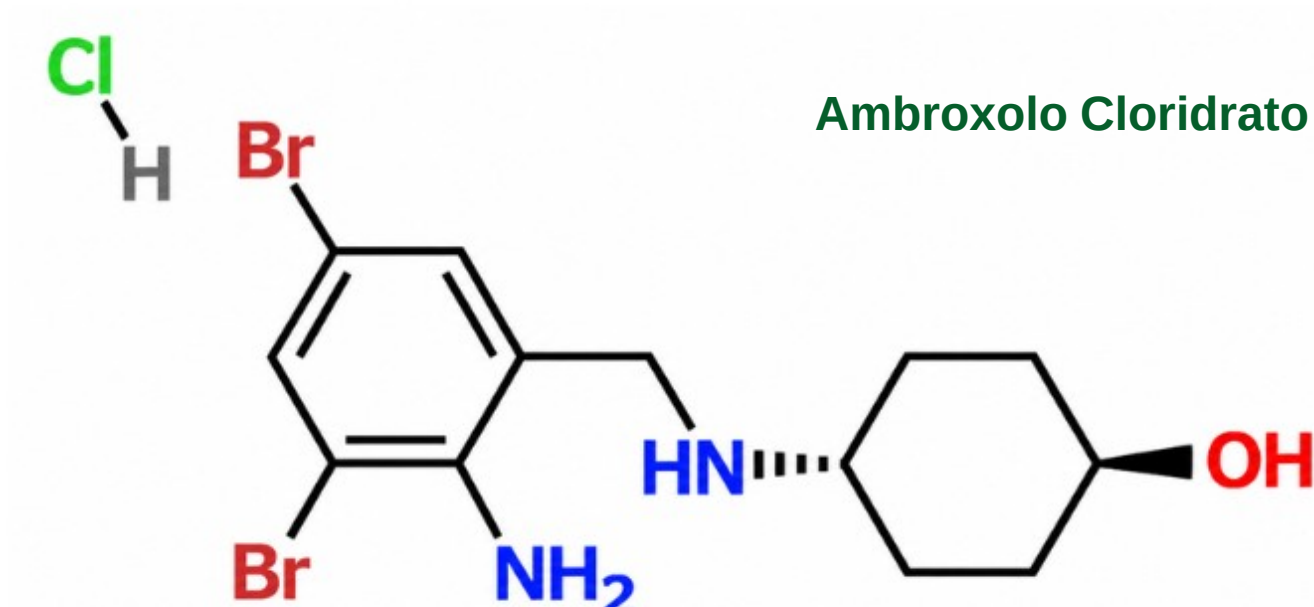
→ ossidazione

gruppo R-NH

→ deaminazione ossidativa e protonazione

gruppo Ar-NH-

→ ossidazione



CONSERVANTI

ANTIOSSIDANTI (utili sia a PA che a cacao)

EDTA bisodico e Vanilina: chelanti di ioni metallici che catalizzano ossidazioni

Acido ascorbico o ascorbato

ANTIMICROBICI

Sorbato

EDTA bisodico

CORRETTORI del pH

Tampone Lattato pH~ 5 [2]

CONCLUSIONI

Il caso evidenzia il ruolo della galenica nella personalizzazione della terapia quando disfagia e caratteristiche organolettiche del principio attivo possono compromettere l'aderenza.

Le strategie di mascheramento sensoriale descritte possono costituire un approccio trasferibile anche a molecole con caratteristiche organolettiche analoghe.

BIBLIOGRAFIA

[1] Basic studies for the practical use of bitterness inhibitors: selective inhibition of bitterness by phospholipids

<https://pubmed.ncbi.nlm.nih.gov/9210187/>

[2] Ambroxol hydrochloride aqueous solution preparation

<https://patents.google.com/patent/JP2000007561A/en>



SAPIENZA
UNIVERSITÀ DI ROMA

