

Abstract

Co-crystallization processes are a group well-established techniques applied to modulate the properties of active pharmaceutical ingredients. In general, the desired effects are obtained through the formation, via non-covalent interactions, of a crystal lattice including at least two species in precise stoichiometric ratio.

Riboflavin, better known as vitamin B2, is a natural compound found in several foods, and artificially produced to be used as a nutraceutical or, in some countries, as an additive for enriching flours, cereals and grains. However, the poor solubility, bioavailability, and easy photo-degradation of riboflavin reduce its effectiveness and range of application. Because of these limitations, riboflavin constitutes an ideal candidate for co-crystallization experiments aimed at obtaining mixed crystals with enhanced stability and bioavailability.

Since the molecular structure of vitamin B2 can be rationalized as composed by an isoalloxazine moiety and a ribityl moiety, this research focuses on obtaining molecular co-crystals by coupling riboflavin with compounds that, due to their chemical structures, are supposed to selectively interact with one of the two moieties of the vitamin's molecule.

Riassunto

Con co-cristallizzazione ci si riferisce a una serie di tecniche che permettono di regolare le proprietà di un principio attivo in una formulazione farmaceutica mediante la sua inclusione in un reticolo cristallino ad almeno due componenti, in preciso rapporto stechiometrico tra loro, attraverso interazioni non covalenti.

La riboflavina (o vitamina B2) è una molecola naturale contenuta in alcuni alimenti, nonché prodotta artificialmente ed utilizzata come nutraceutico o additivo per l'arricchimento di farine, cereali e altri semi commestibili. Purtroppo, la scarsa solubilità, biodisponibilità e resistenza alla luce della riboflavina ne riducono gli effetti e i possibili utilizzi. Per cercare di migliorare queste caratteristiche che ne limitano la sua applicazione, la riboflavina si presta ad essere utilizzata come substrato per prove di co-cristallizzazione. In questo elaborato viene valutata la possibilità di accoppiare la riboflavina a molecole capaci di interagire con i residui della flavina e del ribitolo che compongono la sua struttura.