

Attività formativa	00126 - CHIMICA FARMACEUTICA E TOSSICOLOGICA I				
CFU	9				
Ore	76				
Metodo didattico	Lezioni frontali				
Obiettivi formativi	Al termine del corso lo studente conosce: - i concetti base della Chimica farmaceutica e tossicologica generale riguardanti le interazioni farmaco-bersaglio molecolare, la farmacocinetica e la scoperta di farmaci; - gli aspetti fondamentali riguardanti la progettazione, il meccanismo d'azione a livello molecolare e le relazioni struttura-attività di alcune classi di farmaci riconducibili ai chemioterapici antiinfettivi e antitumorali, agli antinfiammatori non steroidei e ai farmaci che agiscono sul Sistema nervoso centrale; - ha capacità di avvicinare criticamente testi ed articoli di chimica farmaceutica sui vari argomenti.				
Tematica			Lezioni		
Tema	Obiettivo	Ore		Argomenti	Ore
Introduzione al corso	Lo studente conosce l'organizzazione del corso (programma, modalità di svolgimento dell'esame, testi e materiale di studio) e un inquadramento generale della materia.	2	1	Organizzazione delle lezioni e modalità di verifica dell'apprendimento. Definizione ed obiettivi della Chimica farmaceutica.	2
Scoperta di farmaci: dalla casualità alla progettazione	Lo studente viene brevemente introdotto ad alcune tecniche di progettazione di nuove molecole farmacologicamente attive	2	2	Introduzione alla progettazione molecolare.	2
Processo d'azione di un farmaco	Lo studente viene introdotto alla dimensione molecolare del processo d'azione di un farmaco. Apprende l'influenza delle caratteristiche chimico-fisiche dei farmaci sui fenomeni che compongono la fase farmacocinetica del processo d'azione di un farmaco (ADME)	7	3	Processo generale di azione di un farmaco. Fasi del processo d'azione.	1
			4	Elementi di farmacocinetica. Vie di somministrazione. Membrane biologiche e proprietà chimico-fisiche che influenzano il loro attraversamento.	2
			5	Assorbimento. Distribuzione. Eliminazione. Metabolismo dei farmaci.	2

			6	Reazioni della fase 1. Profarmaci. Reazioni della fase 2.	2
Interazione farmaco-target	Lo studente conosce, oltre ai vari target, i legami che possono instaurarsi tra farmaco e target e come la stereochimica può influenzare l'attività.	5	7	Descrizione dei diversi target: enzimi, recettori, canali ionici, proteine strutturali.	3
			8	Legami chimici. Influenza della stereochimica sull'attività di un farmaco.	2
Farmaci antibatterici	Lo studente conosce farmaci in grado di inibire la sintesi della parete batterica; farmaci che inibiscono la sintesi dell'acido folico e tetraidrofolico; farmaci che inibiscono le topoisomerasi; farmaci che intervengono sulla trascrizione e traduzione.	16	9	Sintesi parete batterica. Antibiotici beta-lattamici: struttura generale e meccanismo d'azione molecolare.	1
			10	Penicilline di origine naturale. Penicilline semisintetiche: acido-resistenti, resistenti alle Beta-lattamasi, ad ampio spettro. Sintesi di 6-APA da penicilline. Sintesi di ampicillina	2
			11	Cefalosporine: caratteristiche strutturali e meccanismo d'azione. Cefalosporine di I, II, III, IV generazione	3
			12	Antibiotici beta-lattamici non classici: carbapenemi e monobattami. Struttura e meccanismo d'azione.	1
			13	Fosmomicina. Antibiotici glicopeptidi. Struttura e meccanismo d'azione.	1
			14	Farmaci che interferiscono con la trascrizione batterica inibendo la DNA polimerasi batterica: ansamicine.	1

			15	Farmaci che inibiscono la sintesi delle proteine batteriche inibendo la RNA polimerasi batterica: Rifamicine. Rifamicine semisintetiche.	1
			16	Farmaci che inibiscono la sintesi delle proteine batteriche legandosi al ribosoma batterico: amminoglicosidi, tetraciline, cloramfenicolo (sintesi), teraciline, linezolid.	2
			17	Farmaci che agiscono sulla biosintesi del DNA. Concetto di antimetabolita. Inibitori della diidrofollato-reduttasi. Sulfamidici (SAR e sintesi) Trimetoprim.	2
			18	Antibatterici che agiscono sul complesso DNA/Topoisomerasi. Chinoloni di I, II, III e IV generazione. Struttura, meccanismo d'azione, impiego.	2
Farmaci antitubercolari	Lo studente conosce la struttura ed il meccanismo d'azione dei farmaci impiegati per la tubercolosi.	2	19	Farmaci antitubercolari di prima e seconda scelta. Bersagli molecolari, meccanismo d'azione.	2
Farmaci antimalarici	Lo studente conosce la struttura ed il meccanismo d'azione dei farmaci impiegati per la terapia della malaria.	2	20	Ciclo vitale del plasmodio della malaria. Alcaloidi della china. Farmaci per la fase eritrocitaria e per la fase tissutale. Nuovi approcci di terapia.	2

Farmaci antifungini	Lo studente conosce la struttura ed il meccanismo d'azione dei farmaci impiegati per i vari tipi di micosi.	3	21	Echinicandine e parete cellulare fungina. Antibiotici macrociclici-polienici: meccanismo d'azione di Anfotericina B. Griseofulvina, 5-Flucitosina: struttura e meccanismo d'azione.	2
			22	Derivati azolici: struttura e meccanismo d'azione. SAR, Sintesi di fluconazolo.	1
Farmaci antivirali	Lo studente conosce le varie classi di farmaci, con i rispettivi meccanismi, impiegati per le infezioni virali.	4	23	Farmaci Inibitori della replicazione virale.	2
			24	Farmaci anti HIV: inibitori di trascrittasi inversa e proteasi. Inibitori del virus dell'epatite C.	2
Antitumorali	Lo studente conosce le varie classi di farmaci impiegati per la terapia antitumorale e i rispettivi meccanismi.	5	25	Farmaci antitumorali alchilanti. Mostarde azotate, strutture e meccanismo d'azione (sintesi ciclofosfamide). Nitrosouree, strutture e meccanismo d'azione. Farmaci organo-platino, strutture e meccanismo d'azione	2
			26	Farmaci antitumorali intercalanti del DNA e attivi su topoisomerasi II. Antracicline, strutture e meccanismo d'azione.	1
			27	Farmaci non intercalanti che agiscono su DNA e topoisomerasi. Epidofillotossine. Strutture e meccanismo d'azione. Camptotecine. Meccanismo d'azione. Farmaci che inibiscono la mitosi agendo sul sistema tubulina/microtubuli. Alcaloidi della Vinca. Taxani.	1

			28	Inibitori di proteine-chinasi. Imatinib: struttura e meccanismo d'azione. Gefitinib: struttura e meccanismo d'azione; Sorafenib: struttura e meccanismo d'azione.	1
Farmaci antiinfiammatori non steroidei (FANS)	Lo studente conosce le strutture, il meccanismo d'azione molecolare e le relazioni struttura-attività di una classe di farmaci (FANS) che agiscono interferendo con la sintesi degli eicosanoidi	4	29	Sistema di trasmissione dei mediatori eicosanoidi: struttura, biosintesi e attività degli eicosanoidi. Enzimi COX1 e COX2.	1
			30	FANS non selettivi: bersaglio molecolare e classificazione chimica. FANS COX2 selettivi: bersaglio molecolare e classificazione chimica	3
Farmaci ansiolitici e sedativi ipnotici	Lo studente conosce i vari ligandi del recettore GABA-A con azione ansiolitica e sedativa ipnotica.	4	31	Recettore GABA-A. Modulatori allosterici positivi.	1
			32	Benzodiazepine: bersaglio molecolare e meccanismo d'azione. Sintesi diazepam e Bromazepam. Derivati non benzodiazepinici. Farmaci Z.	3
Farmaci anticonvulsivanti	Lo studente conosce i vari approcci per la terapia sintomatica dell'epilessia.	4	33	Definizione di epilessia. Bersagli molecolari dei farmaci anticonvulsivanti.	1
			34	Farmaci che interferiscono con la sintesi, il metabolismo ed il recettore del neurotrasmettitore GABA. Farmaci che interagiscono con i canali voltaggio dipendenti	3
Farmaci antipsicotici	Lo studente conosce i farmaci antipsicotici e i rispettivi meccanismi d'azione.	4	35	Vie dopaminergiche, recettori dopaminergici e dopamina. Basi biochimiche della schizofrenia.	1

			36	Farmaci antipsicotici tipici o di prima generazione. Fenotiazine, tioxanteni, butirrofenoni, benzamidi: strutture e meccanismo d'azione. Sintesi clorpromazina e analoghi fenotiazinici 2-sostituiti. Sintesi derivati etanol-piperazinici.	2
			37	Farmaci antipsicotici atipici o di seconda generazione. Derivati azepinici e composti correlati. Derivati benzoisossazolicici e composti correlati	1
Farmaci Antiparkinson	Lo studente conosce i diversi approcci terapeutici e i farmaci per la cura del morbo di Parkinson.	4	38	Vie dopaminergiche coinvolte nel Morbo di Parkinson. Bio sintesi e metabolismo della dopamina. Recettori dopaminergici.	1
			39	Levodopa. Inibitori della dopa-decarbossilasi. Inibitori MAO e COMT. Agonisti dopaminergici. Antagonisti muscarinici	2
Farmaci antidepressivi	Lo studente conosce i farmaci, con i rispettivi meccanismi d'azione, utilizzati nei confronti della depressione.	4	40	Ammine biogene coinvolte nella depressione. Inibitori delle monoamminossidasi.	1

			41	Antidepressivi triciclici: strutture e meccanismo d'azione. Inibitori selettivi della ricaptazione di 5-HT: strutture e meccanismo d'azione. Inibitori selettivi della ricaptazione di 5-HT e NA: strutture e meccanismo d'azione. Inibitori della ricaptazione di NA: strutture e meccanismo d'azione. Inibitori della ricaptazione di NA e DA: strutture e meccanismo d'azione.	2
			42	Antidepressivi di nuova generazione. Antagonisti degli autorecettori alfa2-adrenergici e sugli eterorecettori alfa2-adrenergici situati sui neuroni serotonergici. Antagonisti 5HT2 serotonergici	1
Farmaci analgesici oppioidi oppioidi	Lo studente conosce gli alcaloidi presenti nell'oppio e i diversi derivati ottenuti per modificazione e semplificazione della struttura della morfina.	4	43	Impulso nocicettivo, recettori oppioidi ed endorfine.	1
			44	Alcaloidi contenuti nell'oppio: strutture e meccanismo d'azione, SAR. Derivati semisintetici e sintetici della morfina: strutture e meccanismo d'azione. Sintesi del metadone. Agonisti parziali e antagonisti oppioidi. Antagonisti oppioidi	3