

**SCHEDA DELL'INSEGNAMENTO DI**  
**CHIMICA FARMACEUTICA E TOSSICOLOGICA I**  
**PHARMACEUTICAL AND TOXICOLOGICAL CHEMISTRY I**

Corso di Studio  
**CHIMICA e TECNOLOGIA**  
**FARMACEUTICHE**

Insegnamento

LMcu

A.A.2018/2019

Docente: GIUSEPPE CALIENDO

☎081678649

email: CALIENDO@UNINA.IT

SSD **CHIM08**

CFU **10**

Anno di corso (I, II, III) **III**

Semestre (I, II e LMcu) **I**

Insegnamenti propedeutici previsti: **Chimica generale; Chimica Organica I/II.**

**RISULTATI DI APPRENDIMENTO ATTESI**

**Conoscenza e capacità di comprensione**

Il corso intende fornire allo studente le conoscenze basilari di Chimica Farmaceutica necessarie alla: - progettazione; - sintesi; - produzione di sostanze (farmaci) che possano essere usate in medicina per: - la diagnosi; - la prevenzione; - il trattamento; - la cura di malattie umane o animali. Il corso prevede anche lo studio: i) dei prodotti del metabolismo dei farmaci e dei composti ad essi correlati; ii) di alcune fra le più importanti classi di farmaci già esistenti, delle loro proprietà biologiche e delle loro relazioni struttura chimica-attività biologica.

**Conoscenza e capacità di comprensione applicate**

Le principali abilità acquisite saranno: i) conoscere gli aspetti chimici associati alle diverse fasi dello schema LADME; ii) conoscere le caratteristiche strutturali delle diverse classi di recettori; iii) conoscere i principali approcci impiegati nella fase di progettazione di nuove entità molecolari; iv) identificare la classe di appartenenza di un farmaco, descriverne il meccanismo molecolare d'azione, le relazioni struttura-attività e la procedura sintetica.

**Eventuali ulteriori risultati di apprendimento attesi, relativamente a:**

- **Autonomia di giudizio:** Lo Studente del corso di Chimica Farmaceutica e Tossicologica I avrà acquisito la capacità di valutare in maniera autonoma le modifiche chimiche in grado di influenzare le caratteristiche farmacocinetiche e farmacodinamiche di un *lead compound*.
- **Abilità comunicative:** Le abilità comunicative attese al termine del corso sono: i) la capacità di descrivere, attraverso l'utilizzo di una terminologia appropriata, gli aspetti farmacocinetiche e farmacodinamiche associati alla somministrazione dei farmaci; ii) la capacità di relazionare sia oralmente sia attraverso un elaborato scritto sulle relazioni struttura-attività, sul meccanismo molecolare d'azione, sulle procedure sintetiche delle varie classi di farmaci, trattate durante il Corso.
- **Capacità di apprendimento:** Lo Studente sarà in grado di comprendere la necessità di un continuo aggiornamento delle proprie conoscenze mediante la consultazione di testi ed articoli scientifici del settore chimico-farmaceutico.

**PROGRAMMA**

**PARTE GENERALE (4 CFU):** Momenti dell'azione di un farmaco: fase farmaceutica, fase farmacocinetica (Schema LADMET). Fase farmacodinamica. Recettori intracellulari e di membrana. Recettori canale e modulazione della loro attività. Recettori accoppiati alle proteine G. Teorie recettoriali. Affinità ed attività intrinseca. Agonisti puri e parziali. Antagonisti competitivi e non competitivi. Inibitori enzimatici. Ricerca e sviluppo di un farmaco: isosteria, bioisosteria, vinilologia, farmacoforo. Aspetti stereochimici dell'azione dei farmaci. Drug design, QSAR e tecniche computazionali.

**PARTE SPECIALE (6 CFU):** Farmaci anti-infettivi non sistemici: Antisettici, disinfettanti e conservanti. Farmaci anti-infettivi sistemici. Antibatterici: Antibatterici di sintesi 1) Sulfamidici; 2) Antisettici urinari; 3) Fluorochinolonici. Antibiotici: Antibiotici inibitori della sintesi della parete batterica: 1) Penicilline; 2) Cefalosporine; 3) Carbapenemi; 4) Monobattami. 5) Altri antibiotici agenti sulla parete batterica. Inibitori delle beta-lattamasi. Antibiotici inibitori della sintesi proteica: 1) Inibitori della trascrizione; 2) Inibitori della subunità ribosomiale 30S; 3) Inibitori della subunità ribosomiale 50S. Farmaci antitubercolari. Farmaci antiepilettici. Farmaci antimicotici. Farmaci antiprotozoi. Farmaci antivirali: 1) Farmaci antierpetici; 2) Farmaci antiinfluenzali; 3) Farmaci anti-HIV. Farmaci antitumorali: 1) Agenti alchilanti; 2) Antimetaboliti; 3) antitumorali di origine naturale; 4) Ormoni. Antelmintici. Insetticidi.

**CONTENTS(in English, min 10, max 15 lines, Arial 9)**

**GENERAL SECTION (4 CFU):** Moments of drug action: Pharmacokinetic Phase (LADMET). Pharmacodynamic Phase. Intracellular and membrane receptors. Channel receptors and modulation of their activity. G protein-coupled receptors. Receptor theories. Affinity and intrinsic activity. Full and partial agonists. Competitive and non-competitive antagonists. Enzyme inhibitors. Research and development of a drug: isostery, bioisostery, vinylogy, pharmacophore. Stereochemical aspects of drug action. Drug design, QSAR and computational techniques.

**SPECIAL SECTION (6 CFU):** Non-systemic anti-infective drugs: antiseptics, disinfectants and preservatives. Systemic anti-infective drugs. Antibacterial drugs: synthetic antibacterial drugs: 1) Sulfonamides; 2) Urinary antiseptics; 3) Fluoroquinolones. Antibiotics: Antibiotics inhibitors of bacterial cell wall synthesis: 1) Penicillins; 2) Cephalosporins; 3) Carbapenems; 4) Monobactams; 5) Other antibiotics acting on the bacterial cell wall. Antibiotic inhibitors of protein synthesis: 1) Transcription inhibitors; 2) 30S Ribosomal Subunit Inhibitors; 3) 50S Ribosomal Subunit Inhibitors. Antitubercular drugs. Antiepileptic drugs.

**SCHEDA DELL'INSEGNAMENTO DI**  
**CHIMICA FARMACEUTICA E TOSSICOLOGICA I**  
**PHARMACEUTICAL AND TOXICOLOGICAL CHEMISTRY I**

**Corso di Studio**  
**CHIMICA e TECNOLOGIA**  
**FARMACEUTICHE**

Insegnamento

LMcu

**A.A.2018/2019**

Antimicrobici. Antiprotozoici. Antivirali: 1) Anti-Herpes Drugs; 2) Anti-influenza drugs; 3) Anti-HIV Drugs.  
 Anticancer drugs: 1) Alkylating drugs; 2) Antimetabolites; 3) anticancer drugs from natural sources. Anthelmintics. Insecticides.

**MATERIALE DIDATTICO (max 4 righe, Arial 9)**

**Aspetti chimico-farmaceutici**

“Foye’s Principi di Chimica Farmaceutica” Editori: D. A. Williams, T. L. Lemke, VI Edizione Italiana a cura di F. Dall’Acqua, S. Caffieri, PICCIN (2014).

“Chimica Farmaceutica” A. Gasco, F. Gualtieri, C. Melchiorre, I Edizione, Casa Editrice Ambrosiana (2015).

“Chimica Farmaceutica” Wilson & Gisvold I Edizione Italiana basata sulla 12° Edizione Americana. Casa Editrice Ambrosiana (2014).

“Chimica Farmaceutica – I processi di scoperta dei farmaci”, Erlend Stevens, Edizione italiana, PICCIN (2015).

“Introduzione alla Chimica Farmaceutica”, Graham L. Patrick, II Edizione Italiana, EdiSES (2010).

“Burger’s Medicinal Chemistry and Drug Discovery” VI Edizione, Editore: M. E. Wolff, John Wiley & Sons. Trattato composto da cinque volumi.

“Le Applicazioni della Chimica Farmaceutica”, Editore: C. G. Wermuth, I Edizione Italiana a cura di V. Tortorella, EdiSES.

“Chimica dei Recettori”, Editore: C. Melchiorre, CLUEB. La collana comprende una serie di nove monografie (recettori colinergici, adrenergici, oppioidi), delle quali sei sono state pubblicate.

Le basi chimico-fisiche della progettazione dei farmaci, A.Gasco, C. Silipo, A. Vittoria, edizioni SES.

Chimica Farmaceutica, vol. I e II, F. Schroder, C. Rufer, R. Schmiechen, S.E.E, Napoli.

**Aspetti farmacologici**

“Goodman-Gilman: Le basi farmacologiche della terapia” - XII Edizione - 2012, McGraw-Hill Health Professional Division.

“Trattato di Farmacologia e Terapia: Farmacologia Generale e Molecolare”. III edizione, R. Paoletti, S. Nicosia, F. Clementi; G. Fumagalli, UTET. § Aggiornamenti ricavati dalla letteratura scientifica recente.

**MODALITA' DI ESAME**

L'esame si articola in prova	Scritta e orale	x
Altro, specificare		

Solo scritta	

Solo orale	

In caso di prova scritta i quesiti sono (*)	A risposta multipla	
---	---------------------	--

A risposta libera	x
-------------------	---

Esercizi numerici	
-------------------	--

(\*) E' possibile rispondere a più opzioni