

DIPARTIMENTO FARMACIA

CORSO DI LAUREA FARMACIA

DOCENTE Prof Giuseppe Cirino

INSEGNAMENTO Farmacologia Generale e Farmacoterapia I- (modulo FARMACOTERAPIA I---)

Tipologia di insegnamento *caratterizzante*

Crediti formativi (CFU) 8

Settore Scientifico disciplinare (SSD) BIO/14

Posizionamento nel calendario didattico (*es: I semestre del 2° anno*)

Prerequisiti *Nozioni acquisite con lo studio della* Fisiologia e Biochimica

Propedeuticità Nessuna

Commissione d'esame: **Prof. Giuseppe Cirino (Presidente); Componenti. Prof. R.Meli, Prof M.Bucci, Prof F. Roviezzo; Prof G Mattace Raso**

PROGRAMMA DEL CORSO

Il sistema adrenergico, la trasmissione adrenergica recettori α e β : sintesi dell' noradrenalina e farmaci che ne modificano la sintesi. Agonisti adrenergici indiretti o amine simpaticomimetiche indirette: promotori della liberazione del neurotrasmettitore dalle vescicole: amfetamina e tiramina, inibitori della ricaptazione delle monoamine: cocaina. Agonisti adrenergici diretti (catecolamine endogene: noradrenalina adrenalina e dopamina, α_1 -stimolanti: fenilefrina, metoxamina, α_2 -stimolanti: clonidina; beta-stimolanti non selettivi: isoproterenolo o isoprenalina; β_1 -stimolanti: dobutamina; β_2 -stimolanti: metaproterenolo, terbutalina, salbutamolo, albuterolo, formoterolo, salmeterolo). Agonisti adrenergici ad azione mista (liberano noradrenalina e stimolano i recettori alfa e beta: efedrina) Antagonisti α -adrenergici indiretti (inibitori del trasporto vescicolare delle catecolamine: reserpina, blocco della liberazione di noradrenalina dai depositi: guanetidina). Antagonisti α -adrenergici diretti o alfa-litici (non selettivi: fenossibenzamina, fentolamina; alfa 1 selettivi: prazosina, terazosina, doxazosina e tamsulosina, alfa 2 bloccanti: yohimbina). Antagonisti beta-adrenergici o Beta bloccanti (non selettivi: propranololo, timololo, nadololo, pindololo; cardioselettivi: metoprololo, atenololo, acebutololo, esmololo; agonisti parziali: pindololo, acebutololo; alfa e beta bloccanti: labetalolo, carvedilolo)**Trasmissione colinergica. Recettori nicotinici e muscarinici.** Agonisti colinergici. Colinomimetici diretti: acetilcolina, pilocarpina, metacolina, carbacolo, betanecolo. Colinomimetici indiretti o anticolinesterasici: edrofonio, fisostigmina, neostigmina, piridostigmina e ambenonio, tacrina, donezepil, rivastigmina e galantamina, isofluorofato. Avvelenamento da inibitori delle colinesterasi. Antagonisti colinergici o antimuscarinici: atropina e suoi derivati ciclopentolato tropicamide, scopolamina e scopolamina

metilbromuro, ipratropio e tiopropio **Chemioterapia**. Principi generali di chemioterapia. Fattori modificanti l'attività di un chemioantibiotico: relativi all'ospite e relativi al farmaco. Concentrazione minima inibente (MIC). Antibiogramma. Effetto post-antibiotico. Profilassi e terapia con farmaci antimicrobici. Resistenza batterica. Antagonisti dell'acido folico Sulfamidici: sulfasalazina, sulfadiazina argantica. Cotrimoxazolo (trimetoprim e sulfametossazolo). Inibitori della sintesi della parete cellulare. Penicilline naturali: penicillina G e V e di semisintesi: antistafilococciche resistenti alle penicillinasi: meticillina, nafcillina, oxa-, cloxa-, dicloxa- e flucloxacillina. Penicilline ad ampio spettro: ampicillina, amoxicillina. Penicilline antipseudomonas: carbossipenicilline carbenicillina indanil carbenicillina, ticarcillina e ureidopenicilline mezlocillina, azlocillina e piperacillina Cefalosporine: prima generazione: cefazolina, cefalexina, seconda generazione: cefaclor, cefoxitina, cefuroxima e cefuroxima axetil, terza generazione: cefoperazone, cefotaxima, ceftazidima, ceftriaxone, quarta generazione: cefepima . **Altri antibiotici beta-lattamici**: Carbapenemi: imipenem/cilastatina e Monobactami: aztreonam. **Altri antibiotici**: bacitracina, vancomicina Inibitori della sintesi proteica: Tetracicline: clortetraciclina, doxiciclina, minociclina e altri. Aminoglicosidi: streptomina, gentamicina, tobramicina, amikacina, netilmicina, kanamicina, neomicina. Macrolidi: eritromicina, roxitromicina, claritromicina, azitromicina e altri Ketolidi: telitromicina. Cloramfenicolo e derivati: tioamfenicolo. Clindamicina. Linezolid Lincosammidi. Antibiotici glicopeptidici: vancomicina e teicoplanina. Antibiotici polipeptidici: polimixina B, bacitracina. Fosfomicina e ac.fusidico. Mupirocina **Antitubercolari**. Farmaci di prima scelta: isoniazide, rifampicina e altre rifamicine, etambutolo, streptomina, pirazinamide. Farmaci di seconda scelta: cicloserina, etionamide, rifabutina e rifapentina, fluorchinoloni, macrolidi, acido aminosalicilico . **Chemioterapia delle infezioni dell'apparato urinario**. Antisettici urinari. Metenamina, Nitrofurantoina Chinolonici di prima generazione: acido nalidissico, Fluorchinolonici : ciprofloxacina, norfloxacina, ofloxacina, levofloxacina moxifloxacina, gatifloxacina e trovafloxacina. **Antimicotici**. Micosi sottocutanee e sistemiche: amfotericina B, flucitosina, imidazoli e triazoli: ketoconazolo itraconazolo, fluconazolo. Micosi cutanee: farmaci sistemici griseofulvina, terbinafina, topici nistatina miconazolo, clotrimazolo, econazolo, terconazolo **Antivirali**. Farmaci antiinfluenzali: amantadina e rimantadina, oseltamivir, zanamivir, ribavirina. Farmaci antiepatite: interferoni, lamivudina, adefovir, ribavirina. Farmaci contro gli herpesvirus: aciclovir e valaciclovir,, famciclovir, penciclovir, foscarnet, ganciclovir, vidarabina. Farmaci per infezioni da HIV: Inibitori della trascrittasi inversa nucleosidici e nucleotidici: AZT, didanosina, zalcitabina, stavudina, lamivudina, tenofovir, emtricitabina. Inibitori della trascrittasi inversa non nucleosidi nevirapina efavirenz Inibitori delle proteasi: saquinavir, ritonavir, indinavir, Inibitori della fusione virale: enfuvirtide **Farmaci antitumorali**. Generalità sui farmaci antitumorali. Classificazione e meccanismi d'azione dei farmaci antitumorali. Resistenza ai farmaci. **Alchilanti**: Mostarde azotate: mecloretamina, ciclofosfamide, ifosfamide, melfalan, clorambucile. Alchil solfonati: busulfan. Nitrosuree: carmustina, streptozocina e altre. Triazeni: dacarbazina. Procarbazina. Etenimine: altretamina e tiotepa Composti di coordinazione del platino: cisplatino, carboplatino e oxaliplatino. **Antimetaboliti**: Analoghi dell'ac. folico: metotrexato, analoghi delle pirimidine: 5-fluoruracile, capecitabina, analoghi delle purine: 6-mercaptopurina, 6-tioguanina, azatioprina, analoghi della citidina: citarabina e gemcitabina.. **Antitumorali naturali**. Antimitotici: alcaloidi della Vinca: vincristina vinblastina, vindesina e vinorelbina e tassani: paclitaxel, docetaxel e derivati, epipodofillotossina. Analoghi della camptotecina: topotecan e irinotecan. Epidofillotossine: Etoposide e teniposide **Antibiotici**: dactinomina. Antracicline: doxorubicina, daunorubicina, epirubicina, idarubicina e mitoxantrone. Bleomicine. **Ormoni ed antiormoni** nel trattamento dei tumori: glucocorticoidi (desametasone, prednisone), estrogeni, androgeni e progestinici, modulatori selettivi del recettore degli estrogeni (SERM): tamoxifene e toremifene, inibitori dell'aromatasi: aminoglutetimide, anastrozolo, esemestano, agonisti e antagonisti dell'ormone di rilascio delle gonadotropine: leuprolide e goserelina, bloccanti dei recettori degli androgeni: ciproterone e flutamide, Inibitori delle tirosinchinasi e modificatori della risposta biologica (IL-2, anticorpi monoclonali). **Chemioprotettori** (fattori di crescita, antiemetici, antiossidanti ed altri). **Immunostimolanti** (citochine ricombinanti)

ed immunodepressori (glucocorticoidi, inibitori della calcineurina, farmaci antiproliferativi e antimetaboliti, anticorpi)

ENGLISH

Autonomic Nervous System Adrenergic system and adrenergic transmission: synthesis of norepinephrine and drugs that modify its synthesis. Indirect adrenergic agonists: promoters of the release of the neurotransmitter from the vesicles: amphetamine and tyramine, monoamine recombinate inhibitors: cocaine. Direct adrenergic agonists (endogenous catecholamines: noradrenaline adrenaline and dopamine, alpha1-agonists: phenylephrine, methoxamine, alpha2-agonists: clonidine, non-selective beta-agonists: isoproterenol or isoprenaline, beta1-agonists: dobutamine, beta 2-agonists: metaproterenol, terbutaline, salbutamol, albuterol, formoterol, salmeterol. Adrenergic mixed action agonists: ephedrine. Indirect alpha-adrenergic antagonists (catecholamine transport inhibitors: reserpine, blockade release of norepinephrine from deposits: guanethidine). Alpha-adrenergic antagonists (non-selective: phenoxybenzamine, phentolamine, alpha 1 selective: prazosine, terazosin, doxazosin and tamsulosin, alpha 2 blockers: yohimbine). Beta-adrenergic or beta blockers (non-selective: propranolol, timolol, nadolol, pindolol, cardiovascular agents: metoprolol, atenolol, acebutolol, esmolol, partial agonists: pindolol, acebutolol, alpha and beta blockers: labetalol, carvedilol). Cholinergic transmission. Nicotine and muscarinic receptors. Cholinergic agonists. Direct colinomimetics: acetylcholine, pilocarpine, metacoline, carbacol, betanecol. Indirect or anticholinesterase colinomimetics: edrophonium, fisostigmine, neostigmine, pyridostigmine and ambenonio, tacrine, donepezil, rivastigmine and galantamine, isofluorophore. Cholinesterase inhibitors poisoning. Cholinergic or antimuscarinic antagonists: atropine and its cyclopentylated derivatives tropicamide, scopolamine and scopolamine methyl bromide, ipratropium and thiotropium.

Chemotherapy: general principles of chemotherapy. Factors modifying the activity of a chemo-antibiotic: regarding the patient and related to the drug. Minimal Inhibit Concentration (MIC). Antibioграмма. Post-antibiotic effect. Prophylaxis and therapy with antimicrobial drugs. Bacterial resistance. Sulphamidic folic acid antagonists: sulfasalazine, arginine sulfadiazine. Cotrimoxazole (trimethoprim and sulfamethoxazole). **Cell wall synthesis inhibitors.** Natural penicillins: penicillin G and V and semisynthetic penicillinase-resistant anti-filipocytes: methicillin, nafcillin, oxacillin, dicloxacillin and flucloxacillin. Broad spectrum penicillins: ampicillin, amoxicillin. Penicillin antipseudomonas: carboxypenicilline carbenicillin indanil carbenicillin, ticarcillin and ureidopenicilline mezlocillin, azoxylin and piperacillin Cephalosporin: first generation: cefazoline, cefalexin, second generation: cefaclor, cefoxitin, cefuroxime and cefuroxime axetil, third generation: cefoperazone, cefotaxime, ceftazidime, ceftriaxone, fourth generation : cefepime.

Other beta-lactam antibiotics: Carbapenems: imipenem / cilastatin and monobactams: aztreonam.

Other antibiotics: bacitracin, vancomycin. **Anti-tuberculosis.** : isoniazid, rifampicin and other rifamycin, etambutol, streptomycin, pyrazinamide. **Secondary Drugs:** cycloserine, ethionamide, rifabutin and rifapentine, fluorocinolones, macrolides, aminosalicylic acid

Chemotherapy of urinary tract infections. **Urinary antiseptics.** Methenamine, Nitrofurantoin. First generation chinolones: nalidixic acid, Fluoroquinolones: ciprofloxacin, norfloxacin, ofloxacin, levofloxacin moxifloxacin, gatifloxacin and trovafloxacin. **Antifungals.** Subcutaneous and systemic mycoses: amphotericin B, flucitosan, imidazoles and triazoles: ketoconazole itraconazole, fluconazole. Skin mycosis: systemic griseofulvin, terbinafine, topical nistatin miconazole, clotrimazole, econazole, terconazole.

Antivirals. drugs: amantadine and rimantadine, oseltamivir, zanamivir, ribavirin. Antiepileptic drugs: interferons, lamivudine, adefovir, ribavirin. Herpesvirus drugs: aciclovir and valaciclovir, famciclovir, penciclovir, foscarnet, ganciclovir, vidarabine. Drugs for HIV infections: Inhibitors of nucleoside and nucleotide reverse transcriptases: AZT, didanosine, zalcitabine, stavudine, lamivudine, tenofovir, emtricitabine. Reverse transcriptase inhibitors non-nucleoside nevirapine efavirenz Protease inhibitors: saquinavir, ritonavir, indinavir, Viral Fusion Inhibitors: Enfuvirtide

Generalities on Antineoplastic Drugs. Classification and mechanism of action of anticancer drugs

and Drug resistance. Alkylates: Nitrogenous products: mechlorethamine, cyclophosphamide, ifosfamide, melphalan, chlorambucil. Allyl sulfonates: busulfan. Nitrosureas: carmustine, streptozocine and others. Triazene: dacarbazine. Procarbazine. Etenimine: altretamine and thiotepa Coordinates of platinum: cisplatin, carboplatin and oxaliplatin. Antimetabolites: Acetone analogs. folic: methotrexate, pyrimidine analogs: 5-fluorouracil, capecitabine, purine analogs: 6-mercaptopurine, 6-thioguanine, azathioprine, cytidine analogs: cytarabine and gemcitabine. Natural anti cancer drugs. Antimitotic drugs: Vinca alkaloids: vincristine vinblastine, vindesina and vinorelbine and taxan: paclitaxel, docetaxel and derivatives, epipodophyllotoxin. Camptothecin analogues: topotecan and irinotecan. Epidophyllotoxins: Etoposide and teniposide Antibiotics: dactinomycin. Anthracycline: doxorubicin, daunorubicin, epirubicin, idarubicin and mitoxantrone. Bleomicine. Hormones and antihormones in the treatment of tumors: glucocorticoids (dexamethasone, prednisone), estrogen, androgen and progestin, selective estrogen receptor modulators (SERM): tamoxifen and toremifene, aromatase inhibitors: aminoglutetimide, anastrozole, exemestane, agonists and antagonists 'gonadotropin releasing hormone: leuprolide and goserelin, blockers of androgen receptors: cyproterone and flutamide. Tyrosinase inhibitors and biological response modifiers (IL-2, monoclonal antibodies) Chemioprotector drugs (growth factors, antiemetics, antioxidants and others). Immunostimulants (recombinant cytokines) and immunodepressors (glucocorticoids, calcineurin inhibitors, antiproliferative drugs and antimetabolites, antibodies)

TESTI E MATERIALE DIDATTICO CONSIGLIATO

Manuale di Farmacoterapia Idelson Gnocchi Editore
Farmacologia Principi di base ed applicazioni terapeutiche , Ed Minerva Medica
Materiale del corso disponibile sul sito docente

METODI DIDATTICI/ORGANIZZAZIONE DELL'INSEGNAMENTO

Il Corso prevede lezioni frontali ed attività didattiche interattive in aula

MODALITÀ DI VALUTAZIONE DELL'APPRENDIMENTO

Durante il corso sono previste attività didattiche interattive finalizzate all'autovalutazione da parte

OBIETTIVI FORMATIVI

Il corso fornisce le basi molecolari della trasmissione adrenergica e colinergica. Introduce le maggiori classi di farmaci utilizzati agonisti o antagonisti fornendo le basi per il corso di Farmacoterapia. Il corso fornisce anche le nozioni di base necessarie per l'apprendimento della farmacoterapia antibiotica, antivirale e della chemioterapia antitumorale . I meccanismi di azione, la trasduzione del segnale ed i maggiori effetti collaterali sono anche presentati

dello studente del grado di apprendimento e dell'efficacia didattica. Queste attività non comportano votazione od altri tipi di valutazione

Il voto finale d'esame è espresso in trentesimi da 18/30 a 30/30 e lode e tiene conto:

a) della valutazione della prova scritta; b) delle conoscenze acquisite inerenti la trasmissione adrenergica e colinergica, della chemioterapia antibiotica, antivirale ed antitumorale c) della capacità dello studente di inquadrare le classi di farmaci in base al meccanismo d'azione ed indicare la scelta terapeutica in base alle caratteristiche sia farmacocinetiche che farmacodinamiche delle maggiori classi di farmaci trattati

L'attribuzione del voto avviene secondo i criteri riportati in Tabella:

Voto	Descrittori
------	-------------

< 18 insufficiente	Conoscenze frammentarie e superficiali dei contenuti, errori nell'applicare i concetti, prova scritta insufficiente ed esposizione carente
18 - 20	Conoscenze dei contenuti sufficienti ma generali, esposizione semplice, incertezze nell'applicazione di concetti teorici, scarsa proprietà di linguaggio
21 - 23	Conoscenze dei contenuti appropriate ma non approfondite, capacità di applicare i concetti teorici, capacità di presentare i contenuti in modo semplice con sufficiente proprietà di linguaggio
24 - 25	Conoscenze dei contenuti appropriate ed ampie, discreta capacità di applicazione delle conoscenze, buona capacità di presentare i contenuti in modo articolato con buona proprietà di linguaggio
26 - 27	Conoscenze dei contenuti precise e complete, buona capacità di applicare le conoscenze, capacità di analisi e di effettuare collegamenti, esposizione chiara, corretta con buona proprietà di linguaggio
28 - 29	Conoscenze dei contenuti ampie, complete ed approfondite su meccanismi ed interazioni tra farmaci, buona applicazione dei contenuti a semplici problemi terapeutici, buona capacità di analisi e di sintesi, esposizione sicura e corretta con ottima proprietà di linguaggio
30 30 e lode	Conoscenze dei contenuti molto ampie, complete ed approfondite, capacità ben consolidata di applicare i contenuti, ottima capacità di analisi, di sintesi e di collegamenti interdisciplinari e trasversali nell'approccio alla Farmacoterapia, piena padronanza della materia con eccellente proprietà di linguaggio