



SCHEDA DELL'INSEGNAMENTO (SI)

" CHIMICA FARMACEUTICA E TOSSICOLOGICA I "

SSD CHIM/08

DENOMINAZIONE DEL CORSO DI STUDIO: LAURA MAGISTRALE A CICLO UNICO IN FARMACIA

ANNO ACCADEMICO 2021-2022

INFORMAZIONI GENERALI - DOCENTE

DOCENTE: GIOVANNI GRECO

TELEFONO: 081 678645

EMAIL: giovanni.greco@unina.it

INFORMAZIONI GENERALI - ATTIVITÀ

INSEGNAMENTO INTEGRATO:

MODULO:

CANALE: matricole dispari

ANNO DI CORSO: III

SEMESTRE: I

CFU: 10

INSEGNAMENTI PROPEDEUTICI

Nessuno

EVENTUALI PREREQUISITI

Nozioni acquisite con lo studio della Chimica Generale, della Chimica Organica, della Biochimica, della Microbiologia.

OBIETTIVI FORMATIVI

Il corso intende fornire conoscenze fondamentali concernenti le proprietà chimiche e chimico-fisiche che regolano la farmacocinetica e la farmacodinamica di tutti i farmaci (parte generale) nonché le caratteristiche principali dei farmaci antinfettivi e dei farmaci antineoplastici (parte speciale) con riguardo alle loro proprietà chimiche e chimico-fisiche.

RISULTATI DI APPRENDIMENTO ATTESI (DESCRITTORI DI DUBLINO)

Conoscenza e capacità di comprensione

Acquisizione di competenze teoriche e operative con riferimento specifico alle proprietà strutturali e chimico-fisiche dei farmaci antinfettivi e antineoplastici con particolare riguardo al ruolo che tali proprietà giocano nel determinare le loro modalità d'uso (topico o sistemico), le loro indicazioni terapeutiche, la loro tossicità e le loro controindicazioni.

Capacità di applicare conoscenza e comprensione

Acquisizione della capacità di interpretare e razionalizzare le principali proprietà dei farmaci antinfettivi e antineoplastici mediante un apprendimento critico e non mnemonico, utilizzando un approccio metodologico scientifico tale da consentire allo studente di studiare autonomamente le caratteristiche dei farmaci attraverso le varie fonti di informazione disponibili (testi specialistici, schede tecniche, letteratura scientifica).

PROGRAMMA

PARTE GENERALE

Proprietà fisiche dei farmaci

Solubilità. Comportamento acido-base. Coefficiente di ripartizione (lipofilia). Dimensioni molecolari.

Forme farmaceutiche. Forme farmaceutiche orali, parenterali, iniettive, topiche.

Farmacocinetica Assorbimento. Distribuzione, escrezione, metabolizzazione. Curve di livello plasmatico dei farmaci.

Farmacodinamica. Interazione farmaco-recettore. Affinità ed efficacia. Inibitori enzimatici.

Determinazione dell'attività antimicrobica in vitro. L'azione dei farmaci in vivo.

Aspetti di tossicologia.

PARTE SPECIALE

Antibiotici inibitori della sintesi del peptidoglicano. Penicilline. Cefalosporine. Carbapenemi. Monobattami.

Inibitori delle beta-lattamasi. Fosfomicina. Antibiotici glicopeptidici

Antibiotici inibitori della sintesi proteica. Macrolidi. Lincosamidi. Amfenicoli. Streptogramine

Tetracicline. Aminoglicosidi. Acido fusidico. Mupirocina.

Rifamicine.

Antibiotici ciclo peptidici.

Antibatterici di sintesi. Sulfamidici. 2,4-Diaminopirimidine. Chinoloni. Metronidazolo. Nitrofurani.

Linezolid. Antimicobatterici di sintesi.

Antifungini. Antibiotici macrolido-polienici. Azoli antifungini. Inibitori della squalene epossidasi. Derivati 2,6-dialchilmorfolinici.

Antiprotozoari. Antimalarici. Antiamebici. Tricomonicidi. Farmaci anti-toxoplasma

Antielmintici.

Antivirali. Antierpetici. Antinfluenzali. Farmaci anti-AIDS. Antiepatite B. Antiepatite C
Antisettici, conservanti e disinfettanti.
Antineoplastici. Agenti alchilanti. Intercalatori del DNA. Agenti antimitotici. Antimetaboliti

CONTENTS OF THE COURSE OF MEDICINAL AND TOXICOLOGICAL CHEMISTRY I

Part I - Fundamentals of medicinal chemistry and principles of pharmacology.

Physicochemical properties of drugs relevant to pharmacokinetics and pharmacodynamics (solubility, lipophilicity, acid-base behavior, molecular dimensions).

Principles of pharmacokinetics (absorption, distribution, metabolism and excretion of drugs, prodrugs, curves of drug plasmatic concentration vs time, relationships between pharmacokinetic properties and posology).

Principles of pharmacodynamics (receptors, potency and efficacy of drugs, in vitro and in vivo assays, enzyme inhibitors, IC50, MIC, ED50).

Principles of toxicology (LD50, therapeutic index, side effects, cronic toxicity). Unwanted interactions between drugs (in vitro, pharmacodynamic-based and pharmacokinetic-based interactions). Principles of clinical pharmacology (drug development). Principles of drug discovery (isosterism, lead compound finding, lead compound optimization). Nomenclature of drugs and ATC code.

Part II – Drugs

Drugs (structures of the most representative drugs of each pharmacological class, physicochemical properties, mechanism of action, pharmacokinetic properties, main side effects, structure-activity relationships).

Antiseptics, preservatives and disinfectants.

Antibiotics interfering with cell-wall synthesis: beta-lactams (penicillins, cephalosporins, carbapenems, monobactams, beta-lactams inhibitors), fosfomicin, cycloserine, vancomycin and teicoplanin, bacitracin.

Antibiotics interfering with transcription: rifamycins.

Antibiotics interfering with protein synthesis: macrolides, streptogramins, amphenicols, lincosamides, aminoglycosides, tetracyclines, fusidic acid.

Antibiotics interfering with the cytoplasmic membrane organization: polymyxins.

Chemiotherapeutic antimicrobial drugs.

Antibacterial drugs: sulfamides, diaminopyrimidines, quinolones, nitroimidazoles, nitrofurans, oxazolidiones (linezolid).

Antifungal drugs: polyene macrolides, azole derivatives, squalene epoxidase inhibitors, morfoline derivatives, griseofulvin, flucytosine.

Antiprotozoal drugs: antimalarial drugs, antiamoebic drugs, anti-trichomonas drugs, anti-toxoplasma drugs.

Anthelmintic drugs: praziquantel, niclosamide.

Antiviral drugs: Anti-herpes drugs, anti-influenza drugs, anti-HIV drugs, anti-hepatitis B drugs, and anti-hepatitis C drugs.

Antineoplastic drugs: alkylating agents, antimetabolites, DNA intercalating agents, antimitotic agents.

MATERIALE DIDATTICO

A. Gasco, F. Gualtieri e C. Melchiorre, Chimica Farmaceutica, Casa Editrice Ambrosiana.

D. A. Williams e T. L. Lemke, V.F Rochee S.W. Zito, Foye's principi di chimica farmaceutica, Piccin.

G. L. Patrick, Introduzione alla chimica farmaceutica, EdiSES

J. M. Beale Jr. e J.H. Block, Wilson & Gisvold, Chimica farmaceutica. Casa Editrice Ambrosiana.

E. Schroeder, C. Rufer e R. Schmiechen, Chimica farmaceutica, EdiSES

MODALITÀ DI SVOLGIMENTO DELL'INSEGNAMENTO

Lezioni frontali ed esercitazioni in aula

VERIFICA DI APPRENDIMENTO E CRITERI DI VALUTAZIONE

a) Modalità di esame:

L'esame si articola in prova	
scritta e orale	X
solo scritta	
solo orale	
discussione di elaborato progettuale	
altro	

In caso di prova scritta i quesiti sono	A risposta multipla	X
	A risposta libera	X
	Esercizi numerici	X

b) Modalità di valutazione:

Il voto finale in trentesimi da 18 a 30 e lode tiene conto: a) della valutazione della prova scritta, b) della prova orale.