



**UNIVERSITA' DEGLI STUDI DELLA BASILICATA**  
**DIPARTIMENTO DI SCIENZE**

**Insegnamento CHIMICA FARMACEUTICA E TOSSICOLOGICA I**

**Docenti:** Prof. Pietro Campiglia  
**a.a.** 2015/2016

**Corso di studio:** FARMACIA

**Anno di Corso:** III

**Periodo II**  
**didattico:**

**Tipologia:** B

**Totale Crediti:** 12

**Tipo Esame:** SCRITTO / ORALE

**Valutazione:** VOTO

**Lingua di** Italiano, \_\_\_\_\_  
**insegnamento:**

inizio corso MARZO fine corso GIUGNO

**APPELLI DI ESAME**

Mese	Anno	Appello previsto
Febbraio	2016	X
Marzo	2016	X
Aprile	2016	X
Maggio	2016	X
Giugno	2016	X
Luglio	2016	X
Settembre	2016	X
Ottobre	2016	X
Novembre	2016	X
Dicembre	2016	X
Gennaio	2016	X

**COMMISSIONE ESAME:**

Presidente: CAMPIGLIA PIETRO

Componente: MANFRA MICHELE

Componente: VASSALLO ANTONIO

Componente: DE NISCO MAURO



## **UNIVERSITA' DEGLI STUDI DELLA BASILICATA**

### **DIPARTIMENTO DI SCIENZE**

#### *ORARIO RICEVIMENTO STUDENTI*

	dalle ore	alle ore	presso
LUNEDI'	16.00	18.00	STUDIO
MARTEDI'	10.30	11.30	STUDIO
MERCOLEDI'			
GIOVEDI'			
VENERDI'			

#### **Eventuali prerequisiti**

IL CORSO PREVEDE CHE SIANO IN POSSESSO DELLO STUDENTE CONOSCENZE DI CHIMICA GENERALE, DI CHIMICA ORGANICA, DI BIOLOGIA, BIOCHIMICA, ELEMENTI DI ANATOMIA E FISIOLOGIA

#### **Obiettivi Formativi**

IL CORSO SI PROPONE DI FORNIRE CONOSCENZE RELATIVE ALLA CHIMICA, AL MECCANISMO D'AZIONE, ALLE CORRELAZIONI STRUTTURA ATTIVITÀ, AGLI ASPETTI FARMACOCINETICI E FARMACODINAMICI DI FARMACI AD AZIONE CHEMIOTERAPICA, CON PARTICOLARE RIGUARDO AD ANTITUMORALI, ANTI/VIRALI, E ANTIBATTERICI, ANTIMICOBATTERICI, ANTIPROTOZOARI, ANTIMICOTICI, ANTIELMINTICI. IL CORSO UTILIZZA METODI PER VERIFICARE CHE LE CONOSCENZE ACQUISITE DAGLI STUDENTI SIANO UTILIZZATE IN CONTESTI DIVERSIFICATI. SI PROPONE DI COSTATARE CHE I DISCENDI SVOLGANO UN LAVORO DI MATURAZIONE E APPROFONDIMENTO DEI PROPRI SAPERI PER EFFETTUARE COLLEGAMENTI CON TEMATICHE AFFRONTATE IN ALTRE DISCIPLINE.

IL CORSO HA LA FINALITÀ DI TRASMETTERE IL METODO SCIENTIFICO E LA SUA APPLICAZIONE NELL'ANALISI DI PROBLEMI E NELLA SCELTA DI SOLUZIONI. IL CORSO SI PROPONE DI STIMOLARE GLI STUDENTI ALL'AUTOVALUTAZIONE DELLA PREPARAZIONE PER VERIFICARE L'ADEGUATEZZA DEL METODO DI STUDIO E DELLE CONOSCENZE ACQUISITE

#### **Programma del Corso**

##### PARTE GENERALE

INTRODUZIONE ALLA CHIMICA FARMACEUTICA: DEFINIZIONE DI FARMACO, PRINCIPIO ATTIVO E FORME FARMACEUTICHE.

FARMACODINAMICA. FARMACI E BERSAGLI PER I FARMACI: INIBITORI ENZIMATICI AL SITO ATTIVO E INIBITORI ALLOSTERICI; INIBITORI COMPETITIVI E NON-COMPETITIVI; ANALOGHI DELLO STATO DI TRANSIZIONE; SUBSTRATI SUICIDI. RECETTORI COME BERSAGLI DI FARMACI: AGONISTI PARZIALI, AGONISTI INVERSI. DESENSIBILIZZAZIONE E SENSIBILIZZAZIONE; TOLLERANZA E DIPENDENZA; TIPI E SOTTOTIPI RECETTORIALI; AFFINITÀ, EFFICACIA E POTENZA. ACIDI NUCLEICI COME BERSAGLI DI FARMACI.

FARMACOCINETICA ASSORBIMENTO, DISTRIBUZIONE, METABOLISMO, ELIMINAZIONE, SOMMINISTRAZIONE, DOSAGGIO, FORMULAZIONE, VEICOLAZIONE

LA RICERCA IN CAMPO FARMACEUTICO: IDENTIFICAZIONE DI UN PROTOTIPO; PROGETTAZIONE DEI FARMACI: OTTIMIZZAZIONE DELLE INTERAZIONI CON IL BERSAGLIO; OTTIMIZZAZIONE DELL'ACCESSO AL BERSAGLIO; PROGETTAZIONE DEL FARMACO FINALIZZATA ALLA RIDUZIONE DELLA TOSSICITÀ.





## **UNIVERSITA' DEGLI STUDI DELLA BASILICATA**

### **DIPARTIMENTO DI SCIENZE**

PROFARMACI. ASSOCIAZIONI DI FARMACI. L'INTRODUZIONE DEI FARMACI SUL MERCATO: SAGGI PRECLINICI E CLINICI; SAGGI DI TOSSICITÀ; STUDI SUL METABOLISMO DEI FARMACI. CHIMICA COMPUTAZIONALE E RICERCA FARMACEUTICA.

STRUTTURA, MECCANISMO D'AZIONE, CORRELAZIONE STRUTTURA-ATTIVITÀ, ASPETTI FARMACOCINETICI E FARMACODINAMICI, SINTESI DI COMPOSTI SELEZIONATI RELATIVI ALLE SEGUENTI CLASSI TERAPEUTICHE: ANTIBATTERICI AD USO TOPICO. ANTIBATTERICI DI SINTESI AD USO SISTEMICO. ANTIBIOTICI CHE INTERFERISCONO CON LA SINTESI PROTEICA. ANTIBIOTICI CHE INTERFERISCONO CON LA SINTESI DELLA PARETE CELLULARE; INIBITORI DELLE BETA LATTAMASI. ANTIBIOTICI GLICOPEPTIDICI E POLIPEPTIDICI, ANSAMICINE. FARMACI ANTIMICOBATTERICI. FARMACI ANTIMICOTICI: INIBITORI DELLA SINTESI DELL'ERGOSTEROLO AZOLICI E ALLILAMMINICI; ANTIMICOTICI ATTIVI SULLA MEMBRANA DELLA CELLULA FUNGINA. FARMACI ANTIPROTOZOARI: ANTIMALARICI CHINOLINICI, ANTIMETABOLITI, DERIVATI DELL'ARTEMISINA. FARMACI ANTIVIRALI: ANTIERPETICI; ANTI EPATITE B E C; ANTI HIV; ANTINFLUENZALI. FARMACI ANTITUMORALI: CON AZIONE SUL DNA ED ENZIMI CORRELATI; ANTIMETABOLITI: INIBITORI DEL FOLATO; INIBITORI NUCLEOSIDICI PIRIMIDINICI E PURINICI; ANTITUMORALI DI ORIGINE NATURALE; ANTITUMORALI DI ULTIMA GENERAZIONE

#### **Metodi didattici**

LEZIONI FRONTALI

#### **Modalità di verifica dell'apprendimento**

Esame finale: scritto

#### **Testi di Riferimento**

- D.A. Williams, T.L. Lemke, *Foye's Principi Di Chimica Farmaceutica*, Piccin.
- G.L. Patrick, *Introduzione Alla Chimica Farmaceutica*, Edises, II edizione
- GRECO GIOVANNI LEZIONI DI CHIMICA FARMACEUTICA E TOSSICOLOGICA I – LOGHIA
- Wilson&Gisvold *Chimica Farmaceutica* .Ed.CEA
- *Goodman & Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics*, Twelfth Edition, McGraw-Hill Medical Publishing Division (2011).
- *Wilson and Gisvold's Textbook of Organic Medicinal and Pharmaceutical Chemistry*-Lippincott Williams & Wilkins
- Kleemann, Engel, Kutscher, Reichert, *Pharmaceutical Substances*, 5<sup>th</sup> ed., ThiemeVerlag.
- *Burger's Medicinal Chemistry, Drug Discovery and Development*. 7<sup>th</sup> edition. Wiley. *Journal of Medicinal Chemistry*, ACS.

Altre informazioni:

Propedeuticità consigliate:

CHIMICA ORGANICA





**UNIVERSITA' DEGLI STUDI DELLA BASILICATA**  
**DIPARTIMENTO DI SCIENZE**

**COURSE MEDICINAL CHEMISTRY**

**Course of PHARMACY**  
**studies:**

**AcademicYear:** 2015-16

**ECTS:** 12

**TeachingMethods:** Lectures — e-learning

**Evaluation TEST**

**Methods:**

**Evaluation:** 18 (score on 30 points / qualification)

**Semester:** II

**Language:** ITALIAN (and ...)

Course beginning on MARCH ending on JUNE

**Previous requirements: Chemistry, organic-chemistry, biology, biochemistry, anatomy and physiology**

**Learning Outcomes:**

The course aims to provide students with Knowledge concerning the strategy drug Design, synthesis and study of mechanism of action at the molecular level and chemical toxicology aspects and structure and activity relationships and biological activity of drugs. Also will be discussed potential structural changes dictated by metabolic processes that allow to modulate the profile of a drug to its therapeutic use. It is expected that the students acquire the essential elements for designing drugs on a rational basis

**Syllabus:**

GENERAL INTRODUCTION TO THE PHARMACEUTICAL CHEMISTRY: DEFINITION OF DRUG AND PHARMACEUTICAL DRUG. PHARMACODYNAMICS. DRUGS AND DRUG TARGETS: ENZYME INHIBITORS TO THE ACTIVE SITE AND ALLOSTERIC INHIBITORS, COMPETITIVE AND NON-COMPETITIVE INHIBITORS, TRANSITION STATE ANALOGS; SUICIDE SUBSTRATES. RECEPTORS AS DRUG TARGETS: PARTIAL AGONISTS, INVERSE AGONISTS. DESENSITIZATION AND SENSITIZATION, TOLERANCE AND DEPENDENCE. AFFINITY, EFFICACY AND POTENCY. NUCLEIC ACIDS AS DRUG TARGETS. PHARMACOKINETICS: ABSORPTION, DISTRIBUTION, METABOLISM, ELIMINATION. THE RESEARCH IN THE PHARMACEUTICAL INDUSTRY: IDENTIFICATION OF A LEAD; DRUG DESIGN: OPTIMIZATION OF THE INTERACTION WITH THE TARGET; OPTIMIZATION OF ACCESS TO THE





## **UNIVERSITA' DEGLI STUDI DELLA BASILICATA**

### **DIPARTIMENTO DI SCIENZE**

TARGET; DESIGN AIMED AT THE REDUCTION OF DRUG TOXICITY. PRODRUGS. ASSOCIATIONS OF DRUGS. THE INTRODUCTION OF DRUGS ON THE MARKET: PRECLINICAL AND CLINICAL ASSAYS; TOXICITY ASSAYS; STUDIES OF DRUG METABOLISM. COMPUTATIONAL CHEMISTRY AND PHARMACEUTICAL RESEARCH. STRUCTURE, MECHANISM OF ACTION, STRUCTURE-ACTIVITY RELATIONSHIP, PHARMACOKINETICS AND PHARMACODYNAMICS, SYNTHESIS OF COMPOUNDS SELECTED FOR THE FOLLOWING THERAPEUTIC CLASSES: ANTIBACTERIALS FOR TOPICAL USE. SYNTHETIC ANTIBACTERIAL FOR SYSTEMIC USE. ANTIBIOTICS THAT INTERFERE WITH PROTEIN SYNTHESIS. ANTIBIOTICS ACTING ON THE CELL WALL SYNTHESIS; BETA-LACTAMASE INHIBITORS; GLYCOPEPTIDE ANTIBIOTICS AND POLYPEPTIDE ANSAMICINE. ANTIMYCOBACTERIAL DRUGS. ANTIFUNGAL AGENTS: INHIBITORS OF THE SYNTHESIS OF ERGOSTEROL; ANTIFUNGAL ACTIVE ON THE FUNGAL CELL MEMBRANE. ANTIPROTOZOAL DRUGS: QUINOLINE, ANTIMALARIAL AGENTS, ARTEMISININ DERIVATIVES. ANTIVIRAL DRUGS: ANTI-HERPES, ANTI-HEPATITIS, ANTI-HIV, ANTI-INFLUENZA. ANTICANCER DRUGS: ANTICANCER TARGETING DNA AND RELATED ENZYMES; ANTIMETABOLITES: INHIBITORS OF FOLATE; ANTITUMOR NATURAL PRODUCTS; NEW GENERATION ANTICANCER DRUGS.

#### **Suggested textbooks**

- D.A. Williams, T.L. Lemke, *Foye's Principi Di Chimica Farmaceutica*, Piccin.
- G.L. Patrick, *Introduzione Alla Chimica Farmaceutica*, Edises, II edizione
- GRECO GIOVANNI LEZIONI DI CHIMICA FARMACEUTICA E TOSSICOLOGICA I – LOGHIA
- Wilson&Gisvold *Chimica Farmaceutica* .Ed.CEA
- *Goodman & Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics*, Twelfth Edition, McGraw-Hill Medical Publishing Division (2011).
- *Wilson and Gisvold's Textbook of Organic Medicinal and Pharmaceutical Chemistry*-Lippincott
- Williams & Wilkins
- Kleemann, Engel, Kutscher, Reichert, *Pharmaceutical Substances*, 5th ed., ThiemeVerlag.
- *Burger's Medicinal Chemistry, Drug Discovery and Development*. 7th edition. Wiley. *Journal of Medicinal Chemistry*, ACS.

#### **Further information:**

