

INSEGNAMENTO/MODULO CHIMICA FARMACEUTICA E TOSSICOLOGICA IANNO ACCADEMICO: **2017-2018**TIPOLOGIA DI ATTIVITÀ FORMATIVA: **Caratterizzante**DOCENTE: **Prof.ssa Carmela Saturnino**e-mail: **carmela.saturnino@unibas.it**

sito web:

telefono:

Cellulare:: 3204228501

Lingua di insegnamento: **ITALIANO**n. CFU: **12**
di lezionen. ore: **96**
di lezioneSede: **Potenza**
Dipartimento/Scuola:
Dipartimento di Scienze
CdS **FARMACIA (LM-13)**Semestre:II
(dal **05/03/2018** al
30/06/2018)

OBIETTIVI FORMATIVI E RISULTATI DI APPRENDIMENTO Il corso è volto alla acquisizione delle conoscenze e alla comprensione delle varie fasi di sintesi, dei meccanismi d'azione, dell' ADME di antibiotici, antitumorali, antimicotici, antisettici, disinfettanti, antivirali e antimalarici. Lo studente applicando le competenze acquisite dovrà essere in grado di interpretare e analizzare la struttura dei farmaci e loro attività farmacologica, e le fasi che governano la ricerca in campo chimicofarmaceutico dalla scoperta del lead compound alla immissione in commercio.

PREREQUISITI: è indispensabile la conoscenza della chimica organica

○

CONTENUTI DEL CORSO:**PRIMA PARTE:****Blocco 1 (14h):**

Introduzione alla Chimica Farmaceutica. Aspetti e caratteristiche generali di un farmaco; progettazione mediante Drug Design; definizione di Brevetto; Bioequivalenza; Isosteri e Bioisosteri.

Blocco 2 (20 h):

Farmacocinetica. Studio dell'ADME (Assorbimento, Distribuzione, Metabolismo, Eliminazione) reazioni di metabolismo di FASE 1 e 2; studio della Biodisponibilità; concetto di Profarmaco.

Blocco 3 (4h):

Farmacodinamica: concetti di Agonista e Antagonista (competitivo e non competitivo)

Nomenclatura dei Farmaci

PARTE SPECIALE:**Blocco 4 (10 h):**

Sulfamidici: Succinilsulfatiazolo; Sulfaguanidina; Sulfacemide; Sulfametossazolo; Cotrimossazolo (Sulfametossazolo + Trimetoprim). Meccanismo d'azione; SAR e ADME.

Sintesi: Sulfametossazolo;

Trimetoprim.

Blocco 5 (4h):

Antisettici e Disinfettanti: Fenoli (Cresolo; Esilresorcina); Alcoli (Etanolo; Isopropanolo; Alcol Benzoico; Clorobutanolo); Sali di Ammonio Quaternario (Cloruro di Benzalconio; Cloruro di Cetilpiridinio); Agenti Ossidanti (Iodio, NaClO; H₂O₂ ; KMnO₄); Metalli Pesanti (Argento; Mercurio)

Blocco 6 (8 h):

Antelmintici : Idrocarburi alogenati (Tetracloroetilene); Fenoli (Esilresorcina; Diclorofene; Niclosamide); Coloranti (Pirivinio Pamoato); Sali di Ammonio Quaternario (Befenio); Farmaci vari (Mebendazolo)

Antitubercolari: Isoniazide, suo meccanismo d'azione, farmacocinetica, effetti collaterali. Etionamide; Pirazinamide; Etambutolo; PAS.

Sintesi: Isoniazide, Pirazinamide, Etionamide, Leprostatici: Dapsone; Clofazimina.

Blocco 7 (12 h):

Antisettici delle vie urinarie: Nitroderivati(Nitrofurantoina meccanismo di azione; Nifuratel; Nitrossolina); Chinoloni e derivati (Acido Nalidissico; Acido Ossolinico; Cinossacina; Acido Piromidico; Ciprofluossacina; Flerossacina;

Temafluossacina; Ofloxacina); Inibitori del Peptidoglicano (Cicloserina; Fosfomicina). SAR e meccanismo di azione.

Sintesi: Nitrofurantoina, Acido Nalidissico, Ciprofluossacina

Blocco 8(14 h):

Penicilline: 6-APA; Penicillina G; Penicillina V; Ampicillina; Oxacillina; Meticillina; Cloxacillina; Flucloxacillina. Forma

ritardo (Penicillina G con Procaina o Probenecid); Penicilline ad ampio spettro (Ampicillina; Amoxicillina) Inibitori delle B-lattamasi (Acido Clavulanico; Sulbactam). Nuclei delle penicilline (Penam; Penem; Oxapenam; Oxapenem; Carbapenam). SAR penicilline e loro meccanismo d'azione.

Sintesi: 6-APA

Cefalosporine: 7-ACA; 1° Generazione (Cefalexina; Cefalotina, Cefazolina); 2° Generazione (Cefaclor; Cefuroxima) 3° Generazione (Ceftriaxone) 4° generazione (Cefepima). Nuclei cefalosporine (3-Cefem ; Cefem). SAR cefalosporine e loro meccanismo di azione.

Sintesi: semisintesi delle Cefalosporine, Cefaclor

Blocco 9 (14h)

Monobattami: Aztreonam. SAR monobattami.

Altri Antibiotici: Cicloserina e suo meccanismo d'azione.

Tetracicline: Naturali (Clortetraciclina; Ossitetraciclina; Demeclociclina) Semisintetiche (Metaciclina; Doxiciclina; Minociclina). Meccanismo d'azione, diffusione, farmacocinetica, effetti collaterali e interazione con farmaci e alimenti. Residui di tetracicline negli alimenti. Nuove applicazioni. Tigeciclina.

Sintesi: Minociclina

Macrolidi: Gruppo dell'Eritromicina (Eritromicina) Gruppo della Josamicina Gruppo dei Semisintetici (Claritromicina; Fluritromicina; Azitromicina), meccanismo di degradazione a pH acido, meccanismo d'azione ed effetti collaterali.

Amfenicoli: Cloramfenicolo: meccanismo d'azione ed effetti collaterali. Bioisosteri del CAF(Tiamfenicolo;

Cetofenicolo). Pro farmaci del CAF(Palmitato; Succinato Sodico; Azidamfenicolo).

Ossazolidinoni: Linezolid e suo meccanismo d'azione.

Lincosamidi: Lincomicina e suo meccanismo d'azione.

Antibiotici aminoglicosidici: Naturali (Streptomycin, Neomicina) Semisintetici

Blocco 10 (6 h)

Antimicotici: Macrolidi Polieneici; Azolici (Clotrimazolo, Flutrimazolo, Econazolo, Miconazolo, Ketoconazolo); Inibitori squalene-epossidasi (Terbinafina) Derivati della morfina (Amorolfina) Antibiotici (Griseofulvina) Flucitosina.

Meccanismo d'azione

Sintesi: Clotrimazolo, Flutrimazolo, Miconazolo, Fluconazolo

Blocco 11 (10 h)

Antitumorali: 1. Agenti alchilanti :

- Mostarde azotate (Clorometina, Clorambucile, Melfalan, Ciclofosamide)
- Aziridine (Tiotepa)
- Metansolfonati (Busulfan)
- Nitrosouree (Carmustina, Lomustina)
- Idrazine (Dacarbazina)
- Cisplatino e derivati

2. Antimetaboliti (Metotressato)

3. Agenti Intercalanti (Mitoxantrone)

4. Antimitotici

5. Farmaci vari

Blocco 12 (4 h)

Antivirali: Aciclovir, Cidofovir, Ribavirina.

METODI DIDATTICI lezioni frontali in aula.

○

MODALITÀ DI VERIFICA DELL'APPRENDIMENTO La verifica dell'apprendimento avverrà attraverso almeno 2 prove scritte che consistono nella somministrazione di un questionario con quesiti a risposte aperte. I questionari dovranno essere compilati nel tempo massimo di 1 ora. I quesiti avranno come oggetto argomenti inerenti il programma del corso.

TESTI DI RIFERIMENTO E DI APPROFONDIMENTO, MATERIALE DIDATTICO ON-LINE: tutto il materiale didattico (libri ed ecc), sarà comunicato il primo giorno del corso.

○

METODI E MODALITÀ DI GESTIONE DEI RAPPORTI CON GLI STUDENTI: *I contatti saranno mantenuti costantemente tramite piattaforme telematiche*

DATE DI ESAME PREVISTE¹: 19/02(2018, 12/03/2018, 21/05/2018, 18/06/2018, 02/07/2018, 08/10/2018, 19/11/2018

SEMINARI DI ESPERTI ESTERNI SI ☒ NO ☐

ALTRE INFORMAZIONI

¹ Potrebbero subire variazioni: consultare la pagina web del docente o del Dipartimento per eventuali aggiornamenti