
INSEGNAMENTO: Chimica organica dei prodotti bioattivi

ANNO ACCADEMICO: 2017-2018

TIPOLOGIA DI ATTIVITÀ FORMATIVA: attività a scelta

DOCENTE: Maria Funicello

e-mail: maria.funicello@unibas.it

sito web:

scienze.unibas.it/site/home.html.

telefono: 0971/205490

cell. 3204371612

Lingua di insegnamento: italiano

n. CFU: 6

(6 di lezione e 0 di
esercitazioni/laboratorio)

n. ore: 48

(48 lezione e 0 di
esercitazione/laboratorio)Sede: **Potenza**

Dipartimento/Scuola:

Dipartimento di Scienze
CdS**Semestre****I Semestre: dal**
02/10/2017 al
15-
31/01/2018

OBIETTIVI FORMATIVI E RISULTATI DI APPRENDIMENTO

- In questo corso si vuole fornire agli studenti le basi di un approccio chimico organico alla ricerca di nuove strutture farmacologicamente attive sia dal punto di vista di conoscenze dei più comuni target sia delle scelte di strategie sintetiche più efficaci su piccola e media scala per la sintesi di nuove molecole. Non sarà trascurata la chimica delle formulazioni
-

PREREQUISITI

- Conoscenza dei principali contenuti di chimica, in particolare chimica organica
-

CONTENUTI DEL CORSO

1. Concetto di farmaco naturale e di sintesi, organizzazione del team per la ricerca di nuovi lead compounds, viaggio di una nuova struttura dalla sua sintesi ai test di attività biologica; Descrizione e differenze tra la fase pre-clinica e le varie fasi cliniche; impianti pilota e brevetti. Relazioni tra struttura chimica e attività biologica: configurazioni sin e anti, configurazione assoluta.

2. Metodi di variazione della struttura del "lead compound": intervento su dimensioni e rigidità (caso della morfina), introduzione di sostituenti sugli anelli (metile, alogeno, ossidrilico, carbossilico, amminico gruppo), concetto di isostere e bioisostere. Approcci sintetici alla preparazione di un lead: sintesi classica, lineare e convergente. Metodi di purificazione ottica, agenti risolvanti. Categorie di farmaci. Chimica combinatoriale

3. Chemioterapici: batteri, virus e altri microorganismi. Target proteici usuali dei microorganismi. Membrane cellulari di procarioti ed eucarioti. Antifungini: classi caratteristiche e meccanismi d'azione. Antibiotici e antivirali. Caso del virus HIV1: ciclo vitale, punti di blocco, Tipo di terapia e farmaci che bloccano la proteasi virale.

4. Recettori: azioni, tipologie e modulatori. Canali ionici, inibizione competitiva e non competitiva.

5. Farmaci antitumorali: azione, categorie, antimetaboliti, intercalanti, Tomografia ad emissione di positroni per la diagnostica. Caratteristiche degli interferoni. Ciclo cellulare in cellule normali e in cellule tumorali. Il Tassolo: storia, sintesi, biosintesi e sintesi di analoghi.

6. Farmaci del SNC: caratteristiche e meccanismi d'azione. Anti-Alzheimer. Anti- Parkinson. Peptidomimetici e pseudo peptidi. Tipi di "scaffold". Confronto tra BACE 1 e HIV Proteasi: due aspartil proteasi interessate in due malattie molto diverse tra loro. Aggregazione in fibrille. Small molecole attraverso la reazione di Biginelli.

7. Prodrugs: necessità, caratteristiche, applicazioni agli antitumorali, veicoli di prodrugs. ADEPT, ADAPT, GDEPT, VDEPT. Tripartati: caratteristiche e metodi di approccio, trasformazione del farmaco in forma biologicamente attiva.

8. "From bench to market": Definizione di ricerca industriale e di PRDG, funzione in grandi, piccole e medie industrie, qualità standard dei prodotti, produzione dei generici, atom economy e environmental impact, catalisi, intermedi e scale up. Aciclovir: storia e sintesi successive.

9. Chimica delle formulazioni

METODI DIDATTICI

- Lezioni frontali in aula e eventuali seminari di esperti

MODALITÀ DI VERIFICA DELL'APPRENDIMENTO

Esame orale e discussione di una tesina sui prodrugs.

TESTI DI RIFERIMENTO E DI APPROFONDIMENTO, MATERIALE DIDATTICO ON-LINE

1. Gareth Thomas, *Medicinal Chemistry, an introduction*, Wiley Interscience
2. Silverman, R.B. *The Organic Chemistry of Drug Design and Drug Action*; Elsevier Academic Press: Evanston, IL, USA, 2004
3. Cabri, W.; Di Fabio, R. *From bench to market*, Oxford University Press, New York, 2000
4. H.P. Rang, M.M. Dale, J. M. Ritter, P. K. Moore, *Farmacologia*, Casa Editrice Ambrosiana per l'edizione italiana.

METODI E MODALITÀ DI GESTIONE DEI RAPPORTI CON GLI STUDENTI

Contatto via mail e ricevimento in qualsiasi giorno della settimana previo appuntamento

DATE DI ESAME PREVISTE¹

5/2/2018; 5/3/2018; 21/5/2018; 2/7/2018; 5/9/2018; 10/10/2018; 11/12/2018

SEMINARI DI ESPERTI ESTERNI XSI ☐ NO ☐

ALTRE INFORMAZIONI
