

- **Informazioni Corso**
 SCUOLA DI FARMACIA E NUTRACEUTICA
 Corso di Laurea Magistrale in Farmacia
Chimica Farmaceutica e Tossicologica II
 SSD: CHIM/08
 CFU: 10
 IV Anno, II Semestre
 A.A. 2020/21
- **Informazioni Docente**
Anna Artese, Professore Associato nel settore scientifico CHIM/08 Chimica Farmaceutica, presso il Dipartimento di Scienze della Salute dell'Università degli Studi "Magna Graecia" di Catanzaro.
 e-mail: artese@unicz.it Tel. 0961.3694297
 Orario di ricevimento: Lunedì e Venerdì dalle 11.00 alle 13:00 previo appuntamento via e-mail
- **Descrizione del Corso**
 Il corso tratta argomenti di progettazione razionale dei farmaci, metodiche di sintesi e fattori farmacocinetici e farmacodinamici.
- **Obiettivi del Corso e Risultati di apprendimento attesi**
 A conclusione del corso, lo studente disporrà di conoscenze attuali e di utilità pratica sulla progettazione dei farmaci, sulle metodiche di sintesi, sui fattori che possono influenzare l'accesso e l'interazione dei farmaci col target biologico, sia esso recettore o enzima.
- **Programma**
 Relativamente alle classi di farmaci sottoelencati si discuteranno: sintesi e metabolismo, meccanismo d'azione, relazione struttura-attività, strutture recettoriali coinvolte.

FARMACI ATTIVI SUI SISTEMI NERVOSO, MUSCOLARE E TISSUTALE

Anestetici generali

Anestetici volatili: a) inorganici: protossido d'azoto; b) organici: etilene; ciclopropano; cloroformio; cloruro di etile; tricloroetilene; indoklon; isoindoklon; alotano; isoflurano; enflurano; desflurano; metossiflurano; sevoflurano; etere etilico. Anestetici generali endovenosi: propofolo. Barbiturici: tiopentale; tiamilale; butalitale; metoesitale. Derivati dell'1-amino-1-fenilcicloesano: chetamina.

Anestetici locali



Cocaina. Esteri dell'acido p-aminobenzoico: procaina; tetracaina; benzocaina; isogramina; Anilidi: mepivacaina; lidocaina; prilocaina; amilocaina.

Analgesici narcotici

Recettori degli oppioidi: m, d e k. Gli oppioidi endogeni: encefaline, endorfine, dinorfine.

Derivati fenantrenici: morfina; codeina; tebaina. Derivati benzilisoquinolinici: papaverina; noscapina. Derivati della morfina: codeina; diacetilmorfina; ossicodone; ossimorfone; nalorfina; naloxone; naltrexone; 6,14-etanotetraidrocodeina; 6,14-etanotetraidroripivaina. Prodotti di complicazione molecolare: diprenorfina; buprenorfina; etorfina.

Prodotti di semplificazione molecolare: morfinani: butorfanolo; levorfanolo. Derivati benzomorfanici: fenazocina; pentazocina; ciclazocina. Derivati della fenilpiperidina: meperidina; α -prodina (esteri inversi); chetobemidone; profadol; etoceptazina. Analgesici morfinosimili: fentanil e derivati. Derivati a struttura arilalchilaminica: metadone.

Analgesici non narcotici: FANS (farmaci anti-infiammatori non steroidei)

FANS classici: composti arilcarbossilici: acido salicilico; acido acetilsalicilico; benorilato; diflunisale. Derivati dell'acido antranilico: acido mefenamico; acido flufenamico; acido meclofenamico; acido befenamico; glafenina. Composti arilacetici: indometacina; sulindac; benzidamina; zomepirac; clopirac; tolmetin; diclofenac. Composti arilpropionici: flurbiprofene; indoprofene; chetoprofene; acido tiaprofenico; ibuprofene; naprossene; fenbufene; clidanac. Acidi idrossamici: bufexamac; ibuproxam. Derivati basici: diftalone. Derivati pirazolidindionici: aminofenazone (piramidone); nifenazone; sulfamipirina; dipirone. Derivati del pirazolidin-3,5-dione: fenilbutazone. Derivati oxicam: sudoxicam; piroxicam; isoxicam; tenoxicam. Derivati dell'anilina e del p-aminofenolo; fenacetina; paracetamolo. Derivati fenilcinconinici: cincofene.

Inibitori selettivi delle COX-2: sulfoanilidi: nimesulide; flosulide. Derivati isobenzofuranici. Eterociclidiarilici vicinali: celecoxib; rofecoxib; valdecoxib; parecoxibsodium. Analoghi diarilici: composti cis-stilbenici. Composti modificati: meloxicam; composti ottenuti dall'indometacina; composti ottenuti dallo zomepirac; composti ottenuti dall'aspirina. *Terz*-butil-fenoli.

DEPRIMENTI SELETTIVI DEL SISTEMA NERVOSO CENTRALE

Ipnotici sedativi

Ipnotici azotati ciclici. 1,4-Benzodiazepine: BDZ per uso anestetico: flunitrazepam. BDZ long-acting: diazepam; bromazepam; clordesmetildiazepam; flurazepam; clordiazepossido; fletazepam; quazepam. BDZ ad emivita intermedia: nitrazepam; nimetazepam; clorazepato potassio. BDZ short-acting: oxazepam; temazepam; lorazepam. BDZ ad emivita



brevissima: triazolam; estazolam. Barbiturici. Azione prolungata: barbitale; fenobarbitale. Azione media-breve: alobarbitale; ciclobarbitale. Azione breve: pentobarbitale; eptabarbitale. Azione molto breve: tiopentale; metoesitale.

Antiepilettici

Epilessia: definizione, fattori eziologici e classificazione. Aminoacidi e neurotrasmettitori. Antiepilettici inorganici: bromuro sodico, potassico e ammonico; bromuro di calcio.

Barbiturici: fenobarbital; fenacetamide; primidone. Idantoine: fenitoina; mefenitoina; etotoina. Succinimidi: etosussimide; metosussimide; fensussimide. Ossazolidindioni: parametadione; trimetadione; dimetadione. Derivati 4-chetochinazolinici: metaqualone.

Benzodiazepine: diazepam; clorazepato potassio; nitrazepam; clonazepam.

Aminoacidi: gabapentin; vigabatrin.

Amidi: progabide; carbamazepina; oxcarbazepina; felbammato; levetiracetam.

Amine: flunarizina; lamotrigina.

Sulfamidici: acetazolamide; topiramato; zonisamide. Altre strutture: acido valproico; AMPA-antagonisti; ftalazine.

Antiparkinson

Morbo di Parkinson: definizione, fattori eziologici. Anticolinergici: orfenadrina; benzatropina; triesilfenidile; profenamina; metissene; prociclidina; difenidramina.

Farmaci dopaminergici: precursori della dopamina: levodopa. Inibitori delle decarbossilasi: carbidopa; benserazide.

Farmaci stimolanti la liberazione di dopamina: amantidina. Agonisti della dopamina: ropirinolo; apomorfina. Inibitori della MAOB: selegilina.

Psicolettici

Neurolettici. Fenotiazine: clorpromazina; flufenazina; tioridazina; protipendile; metoclopramide; sulpiride; tiapride. Tioxanteni: clorprotixene.

Butirrofenoni: droperidolo; aloperidolo; trifluperidolo. Dibenzazepine: clozapina. Diidroantraceni. Diidroindolindoni: molindone.

Difenilbutilpiperidine: pimozone. Benzammidi: metoclopramide; remoxipride; sulpiride; sultopride. Alcaloidi della Rauwolfia: reserpina.

Ansiolitici

Trasmissione GABAergica; biosintesi e catabolismo del GABA; I recettori del GABA. I recettori delle benzodiazepine. Relazioni struttura-attività.

1,4-Benzodiazepine: clordiazepossido; diazepam; prazepam; demoxepam; nordiazepam; ossazepam; bromazepam; clonazepam; clorazepato; clotiazepam; flurazepam; flunitrazepam; nitrazepam; nordiazepam.

Flumazenil.



FARMACI STIMOLANTI DEL SNC

Timolettici

Dibenzoazepine: imipramina; desipramina; lofepramina; trimipramina; clomipramina; opipramolo; dibenzepina.

Dibenzocicloeptatrieni: amitriptilina; nortriptilina; protriptilina; doxepina; dosulepina. Mianserina. Melitracene. Clorprotixene. Dimetacrina.

Antidepressivi non tricyclici

Trazodone; viloxazina; bupropione.

Inibitori selettivi del reuptake della serotonina (SSRI): citalopram; paroxetina; fluoxetina.

Inibitori selettivi del reuptake delle amine: venlafaxina; zimelidina.

Timeretici

Idrazin-derivati: iproniazide; isocarboxazide; fenelzina; feniprazina; fenossipropazina.

Ammino-derivati: tranilcipromina; pargilina; etriptamina.

Stimolanti psicomotorilanoressigeni

Amfetamina; fentermina; clorfentermina.

Derivati purinici: teofillina; caffeina; teobromina.

Psicodislettici

Derivati feniletilaminici: mescalina. Derivati indolici: psilocibina; psilocina; bufotenina; Derivati carbolinici: armalina; ibogaina. Derivati dell'acido lisergico: LSD. Derivati della Cannabis sativa: cannabinolo; THC; cannabidiolo.

FARMACI DEL SISTEMA NERVOSO AUTONOMO

Generalità. Biosintesi delle catecolamine e metabolismo. I recettori adrenergici. Meccanismo d'azione dei farmaci adrenergici. Sintesi di noradrenalina, dopamina e adrenalina.

Farmaci adrenergici

Agonisti adrenergici: pseudoefedrina; α -metilnorepinefrina; sinefrina (ossedrina); fenilefrina; metaraminolo; metossamina; amfetamina; nafazolina; clonidina.

Inibitori della biosintesi delle catecolamine: metiltirosina; carbidopa; α -metil-dopa.

Inibitori del rilascio del neurotrasmettitore: bretilio; guanetidina; guanadrel; reserpina. Antagonisti adrenergici: tolazolina; fentolamina; prazosina; terazosina; doxazosina; trimazosina; indoramina; yohimbina; rilmenidina; azapetina; diidroergocristina; sildenafil; bunololo; metilpropanololo; nadololo; pindololo; timololo; propanololo; pronetalolo.

β -stimolanti: dobutamina; salbutamolo; metaproterenolo; isoprenalina; ritodrina.



Farmaci colinergici

Acetilcolina. I recettori dell'acetilcolina: muscarinico e nicotinico.

Antagonisti nicotinici

Antagonisti nicotinici gangliari: derivati bis-onici o bis-quaternari (esametonio); derivati amminici. Antagonisti nicotinici muscolari: succinilcolina; tubocurarina; gallamina.

Agonisti muscarinici

Carbacolo; metacolina; betanecolo; pilocarpina.

Farmaci antimuscarinici

Alcaloidi della belladonna: iosciamina. Esteri di aminoalcoli: eucatropina. Eteri di aminoalcoli e aminoalcoli: benztropina. Aminoamidi: isopropamide ioduro.

Farmaci papaverinici: papaverina.

Farmaci attivi sulle colinesterasi

Anti-AchE reversibili: fisostigmina; neostigmina; piridostigmina; edrofonio; tacrina.

Anti-AchE irreversibili: parathion; malathion; paraoxon.

FARMACI ATTIVI SUL SISTEMA MUSCOLARE

Rilassanti muscolari centrali

Mefenesina; metamizolo; amitriptilina; tiocolchicoside; baclofen; prindolo; tizanidina.

Rilassanti muscolari periferici

d-Tubocurarina.

Bloccanti neuromuscolari depolarizzanti

Decametonio; succinilcolina.

FARMACI ATTIVI NELLE IMMUNOREAZIONI PATOGENE

Corticosteroidi

Idrocortisone; cortisone; prednisone; metilprednisolone; prednisolone; triamcinolone; fluocortolone.

FARMACI ATTIVI SULL'APPARATO RESPIRATORIO

Antitussivi

Farmaci ad azione centrale: efedrina. Derivati della morfina: codeina; codetilina; idrocodone; diidrocodeina; destrometorfano; normetadone; clofedanolo; difepanolo.

Derivati benzilisochinolinici: noscapina. Farmaci ad azione centrale e periferica.



Derivati dell'acido fenilacetico: osseladina; pentossiverina. Derivati fenotiazinici: dimetossanato; pipazetato; clobutinolo. Altre strutture: dropropizina.

Espettoranti

Secretomotori: guifenessina. Mucolitici: bromessina; ambrossolo; sobrerolo; eprazinone; carbocisteina; acetilcisteina. Antiistaminici ad attività espettorante: difenidramina; doxilamina; feniramina.

Broncospasmodici

Parasimpaticolitici: ipratropio bromuro. β -simpaticomimetici: isoprenalina; terbutalina; salbutamolo; ropreterolo.

FARMACI ATTIVI SULL'APPARATO GASTROENTERICO

Farmaci antiulcera

Antagonisti dell'istamina sui recettori H₂: nizatidina; cimetidina; ranitidina; famotidina.

Farmaci antigastrinici: proglumide. Inibitori della pompa H⁺/K⁺ ATP-asi: omeprazolo.

Farmaci stimolanti la motilità

Metoclopramide; domperidone.

Farmaci delle malattie infiammatorie dell'intestino

Sulfasalazina; sulfapiridina; olsalazina; mesalazina; azatioprina.

Antidiarroici

Loperamide; difenossilato.

FARMACI ATTIVI SUL SISTEMA CARDIOVASCOLARE

Antiarritmici: chinidina (chinina); procainamide; diisopiramide; mexiletina; lidocaina; tocainide; fenitoina; propanololo; sotalolo; amiodarone; verapamil; nifedipina; diltiazem.

Vasodilatatori delle coronarie: propranololo; nitrito di etile; nitrito di isoamile; nitrito di otile; nitroglicerina; eritrietilnitrato; isosorbidedinitrato; khellina; carbocromene; amiodarone; benzodiarone; lidoflazina; esobendina; dilazep.

Diidropiridine: nifedipina; nitrendipina; nicardipina; lacidipina; verapamil; diltiazem.

Cardiotonici: digitossigenina; gitossigenina; digossigenina; strofantidina; scillarenina.

Antiipertensivi: Farmaci che agiscono con meccanismo neuronale: metildopa; clonidina; guanoxabenz; guanfacina; bromuro di esametonio; reserpina.

α -bloccanti: prazosina; doxazosina.

β -bloccanti: propranololo; sotalolo.



Vasodilatatori ad azione diretta: diazossido; idralazina; diidralazina; minoxidil; nitroprusiato sodico.

Ace-inibitori: captopril; enalapril; enalaprilato; lisinopril; chinalapril; ramipril; perindopril; cilazapril; benzapril; zofenopril; alacepril.

Sartani: losartan; eprosartan; candesartan; telmisartan; irbesartan; valsartan; ripisartan.

Diuretici: acetazolamide; clofenamide; diclofenamide; mefruside; tiazidi e idrotiazidi; clorotiazide; idroclorotiazide; idroflumetiazide; bendroflumetiazide; clortalidone; furosemide; ac. etacrinico; spironolattone; triamterene; amiloride; teofillina; mannite.

Ipolipidemizzanti: clofibrato; benzafibrato; gemfibrozil; lovastatina; mevastatina; simvastatina; pravastatina; fluvastatina.

Stima dell'impegno orario richiesto per lo studio individuale del programma
170 ore

Metodi Insegnamento utilizzati

Lezioni frontali: 80 ore

Risorse per l'apprendimento

- Gasco, A.; Gualtieri, F.; Melchiorre, C. Chimica Farmaceutica, Casa Editrice Ambrosiana, Zanichelli, Bologna, Seconda Edizione.

- Schroder, E. Chimica Farmaceutica, voll. I, II; Ed. S.E.S., Napoli, Ultima edizione.

- Foye, W. O. Principi di Chimica Farmaceutica, Piccin Editore, Padova, Ultima edizione.

Attività di supporto

Il docente può essere contattato anche al di fuori degli orari di ricevimento per delucidazioni, via email, previa prenotazione.

Modalità di frequenza

La frequenza è obbligatoria.

Le modalità sono indicate dall'art.8 del Regolamento didattico d'Ateneo.

Modalità di accertamento

Le modalità generali sono indicate nel regolamento didattico di Ateneo all'art.22 consultabile al link

[http://www.unicz.it/pdf/regolamento didattico ateneo dr681.pdf](http://www.unicz.it/pdf/regolamento%20didattico%20ateneo%20dr681.pdf)



L'esame finale si articola in due fasi propedeutiche. La prima prova consiste in un esame scritto costituito da 10 domande a risposta aperta e valutato in trentesimi. La prova finale prevede un esame orale. La valutazione finale, espressa in trentesimi, tiene conto dei risultati conseguiti in tutte le fasi dell'esame secondo quanto riportato di seguito:

	Conoscenza e comprensione argomento	Capacità di analisi e sintesi	Utilizzo di referenze
Non idoneo	Importanti carenze. Significative inaccurately	Irrilevanti. Frequenti generalizzazioni. Incapacità di sintesi	Completamente inappropriato
18-20	A livello soglia. Imperfezioni evidenti	Capacità appena sufficienti	Appena appropriato
21-23	Conoscenza routinaria	E' in grado di analisi e sintesi corrette. Argomenta in modo logico e coerente	Utilizza le referenze standard
24-26	Conoscenza buona	Ha capacità di a. e s. buone gli argomenti sono espressi coerentemente	Utilizza le referenze standard
27-29	Conoscenza più che buona	Ha notevoli capacità di a. e s.	Ha approfondito gli argomenti
30-30L	Conoscenza ottima	Ha notevoli capacità di a. e s.	Importanti approfondimenti



Il docente
Prof.ssa Anna Artese

Anna Artese