

**DA E-LEARNING - FILE 1-5 DEL MATERIALE DIDATTICO DELLA PROF.SSA DESIDERI**

**Principi di chimica farmaceutica**

Momenti dell'azione di un farmaco: fasi farmaceutica, farmacocinetica e farmacodinamica. Diffusione e trasporto cellulare e tissutale dei farmaci. Vie di assorbimento. Distribuzione. Metabolismo dei farmaci: fase 1 e fase 2, effetto di primo passaggio. Reazioni di ossidazione, riduzione idrolisi. Ossidazione di gruppi metilici, metilaminici. Idrossilazione degli aromatici. Reazioni di coniugazione, solfatazione, coniugazione ippurica e con glutatione. Concetto di recettore, livello d'azione dei farmaci, complesso farmaco-recettore. Agonisti, antagonisti, agonisti parziali. Attività intrinseca. Profarmaco, profarmaco reciproco, farmaco latenziato. Costante di affinità recettoriale, curve dose-risposta. Interazioni idrofobiche. Fattori che favoriscono la formazione del complesso farmaco-recettore. Contributi delle interazioni farmaco-recettore all'energia di legame. Interazioni elettrostatiche: legame idrogeno, legame ionico, interazione catione- $\pi$ , interazioni di van del Waals. Recettore a tre punti per l'adrenalina. Definizioni di eutomero, distomero e rapporto eudismico. Concetto di farmacoforo. Regola del cinque di Lipinski.

**DA E-LEARNING - 7 FILE SCELTI TRA QUELLI ELENCATI NEL MATERIALE DIDATTICO DEL PROF. SILVESTRI**

- 1. Antibiotici inibitori della biosintesi del peptidoglicano.** Penicilline. *Penicilline naturali*. Benzilpenicillina, penicillina V. *Penicilline semisintetiche*. Caratteristiche chimiche, spettro d'azione, resistenza alle lattamasi ed acido-stabilità. Oxacillina, meticillina, ampicillina, amoxicillina. Ureidopenicilline: azlocillina, piperacillina. Pro-ampicilline: bacampicillina, pivampicillina e meccanismo di conversione ad ampicillina. *Inibitori della lattamasi*: acido clavulanico, sulbactam. Meccanismo d'azione delle beta-lattamine (modello di sovrapposizione con il frammento D-Ala-D-Ala). Cefalosporine. *Cefalosporine naturali*. Cefalosporina C. *Cefalosporine semisintetiche*. Cefazolina, cefurossima, cefotassima, ceftazidima, cefepima, ceftarolina. Pro-cefalosporine. Cefamicine. Cefossitina. Biogenesi.
- 2. Antibiotici inibitori del ribosoma.** Antibiotici aminoglicosidici. Kanamicine, streptomina e diidrostreptomina. Antibiotici macrolidici. *Macrolidi antibatterici*. Eritromicina, oleandomicina, troleandomicina. *Tetracicline*. *Tetracicline naturali*. tetraciclina, demeclociclina. *Tetracicline semisintetiche*. rolitetraciclina. **Altri Antibiotici**. Fosfomicina. Meccanismo d'azione. Ansamicine. Rifampicina, rifapentina, rifabutina.
- 3. Antiprotozoari.** Malaria, ciclo del Plasmodium. Alcaloidi della china: proprietà, stereochimica e meccanismo. Cloroquina, idrossicloroquina, primachina. Artemisinina e suoi derivati.
- 4. Antitumorali.** Farmaci che agiscono sugli acidi nucleici. *Mostarde azotate*: ciclofosfamide, ifosfamide. *Complessi organoplatino*: cisplatino. Inibitori della topoisomerasi. dactinomicina, doxorubicina, irinotecano, etoposide. Antimetaboliti.. Inibitori della mitosi. alcaloidi della Vinca, combretastatina, tassani (paclitaxel), epotiloni.
- 5. Analgesici narcotici.** Recettori oppioidi. Alcaloidi dell'oppio, morfina, codeina, papaverina, alcaloidi multicitrici, agonisti e antagonisti.
- 6. Analgesici non-narcotici.** Azioni terapeutiche, cicloossigenasi *para-Aminofenoli*: Paracetamolo. *Salicilati*. Acido acetilsalicilico e salicilati
- 7. Colinergici.** Acetilcolina, recettori colinergici. *Agonisti diretti*. Betanecolo, carbacolo. *Inibitori AchE reversibili*. Fisostigmina, neostigmina, piridostigmina, *Inibitori AchE per l'Alzheimer*: tacrina, donezepam, galantamina. *Antagonisti muscarinici*. Atropina, scopolamina, *Bloccatori neuromuscolari depolarizzanti*: decametonio, succinilcolina. *Bloccatori neuromuscolari non-depolarizzanti*: d-tubocurarina, atracurio besilato.
- 8. Anestetici locali.** Cocaina, benzocaina, procaina, lidocaina. Caratteristiche strutturali, chimiche e suoi derivati.
- 9. Purganti.** Classificazione. Purganti di massa. *Idrofili naturali*: agar, psillio. *Idrofili semisintetici*: metilcellulosa e carbossimetilcellulosa. *Osmotici salini*: sodio solfato, magnesio solfato, fosfato bisodico, cremore tartaro, sale di Seignette, magnesio ossido e magnesio citrato. *Polialcoli*: glicerina, mannite, sorbite. Purganti lubrificanti. *Emollienti oleosi*: olio di mandorle dolci, olio di oliva, paraffina liquida. *Fecal softeners*: diottilsolfosuccinato sodico. Purganti irritanti e di contatto. *Attivi sul tenue*: olio di ricino. *Attivi sul crasso naturali*: cascara, rabarbaro, senna, aloe, frangula. *Attivi sul crasso sintetici*: bisacodile, picosolfato sodico. Astringenti e antidiarroeici. Acido tannico, loperamide, difenossilato. Adsorbenti e Defroticanti. Pectina, carbone medicinale, caolino, polimetilsilossano.
- 10. Prevenzione cardiovascolare.** Proteine della soia, riso rosso fermentato (meccanismo delle statine), berberina, polifenoli dell'uva e dell'olivo, acidi grassi polinsaturi, principi attivi del Theobroma cacao, epicatechine, resveratrolo.
- 11. Diabete e obesità.** Curcumina, fibre alimentari, amido resistente, acido lipoico, berberina.
- 12. Patologie dell'occhio.** Carotenoidi, DHA, luteina e zeaxantina, picnogenolo, olivello spinoso.
- 13. Ipertrofia prostatica.** Sereneoa, isoflavoni, pigo africano, pomodoro, epilobio.
- 14. Menopausa.** Fitoestrogeni, cohosh nero, ligani, resveratrolo, piperina.
- 15. Artrosi cronica.** Glucosamina, controintina solfato, collagene, acido grassi omega-3, alghe, karitè, boswellia.
- 16. Stress ossidativo.** Polifenoli, tè verde, gingerolo, quercetina.
- 17. Nutraceutici nello sport.** Amminiacidi ramificati, creatina, L-carnitina, carnosina, L-teanina, D,L-cistina, ubidecarenone
- 18. Chemioprevenzione tumorale.**

**Testi di studio**

A. Gasco, F. Gualtieri, C. Melchiorre, *Chimica Farmaceutica*, 1a Ed, CEA Ed.

**Calendario degli Appelli 2021.** Appelli ordinari 2021: 30 giugno, 28 luglio, 29 settembre, 26 gennaio; Appelli: 31 marzo, 28 aprile, 3 giugno, 27 ottobre, 24 novembre, 16 dicembre.

**Orario di ricevimento per gli studenti del corso e per i tirocinanti**

Mercoledì 14-17.