

Università degli Studi di Roma – La Sapienza
Facoltà di Farmacia e Medicina
Corso di Laurea in Scienze Farmaceutiche Applicate
Scienze Erboristiche
Programma del corso di “Chimica Fitoterapeutica”
AA 2019-2020

PARTE GENERALE

Definizione, natura ed impieghi dei farmaci. Farmaci di origine naturale e sintetica. Le piante come fonte di farmaci e di loro precursori. Genesi, sviluppo, classificazione e nomenclatura dei farmaci. Farmaci orfani. Brevetti sui farmaci. Momenti d'azione dei farmaci: fase farmaceutica, fase farmacocinetica e fase farmacodinamica. Farmacocinetica. Assorbimento dei farmaci. Membrane biologiche. Passaggio dei farmaci attraverso le membrane: trasporto convettivo, diffusione passiva, legge di Fick, influenza della ionizzazione, diffusione facilitata e trasporto attivo. Distribuzione dei farmaci. Metabolismo dei farmaci: reazioni metaboliche della fase I (ossidazioni e riduzioni microsomiali e non microsomiali, reazioni idrolitiche), reazioni metaboliche della fase II (glicuronazione, solfoconiugazione, coniugazione ippurica, sintesi mercapturica, acetilazione e metilazione). Escrezione dei farmaci. Farmacodinamica. Definizione e natura dei recettori dei farmaci. Concetti di agonista ed antagonista. Superfamiglie recettoriali. Meccanismi di trasduzione del segnale. Legami farmaco-recettore: legami covalenti, interazioni elettrostatiche, legami idrofobico ed a trasferimento di carica. Inibitori enzimatici: inibitori reversibili, marcatori per affinità, inibitori basati sul meccanismo. Stereochimica ed attività farmacologica: concetti di eutomero e distomero, rapporto eudismico, modello di Easson-Stedman, conformazione farmacofora.

PARTE SISTEMATICA

FARMACI ANTIINFETTIVI: Generalità e classificazione.

Antiprotozoari. Generalità sui protozoi.

Antimalarici. Ciclo biologico dei parassiti della malaria. Alcaloidi della corteccia di china. Derivati della 4-aminochinolina: cloroquina. Derivati fluorenilmetanolici: lumefantrina. Derivati chinolinometanolici: meflochina. Derivati della 8-aminochinolina: primachina. Artemisinina e suoi derivati.

Antiamoebici. Ciclo biologico dell'ameba nell'uomo. Antiamoebici sistemici: emetina e deidroemetina.

FARMACI ANTINEOPLASTICI Generalità e classificazione. Composti d'origine vegetale: *Alcaloidi della vinca:* vinblastina, vincristina, vinorelbina. *Taxani:* paclitaxel, docetaxel, cabazitaxel. *Derivati della podofillotossina:* etoposide. *Camptotecine:* topotecan, irinotecan

FARMACI ATTIVI SULLA NEUROTRASMISSIONE COLINERGICA

Recettori colinergici: tipologia, localizzazione e funzionamento dei recettori nicotinici e muscarinici. Biosintesi, rilascio e biodegradazione della ACh. Farmaci ad azione diretta e indiretta. Pilocarpina. Agenti colinomimetici ad azione indiretta: AChE e suo meccanismo di idrolisi enzimatica. Inibitori reversibili della AChE: fisostigmina, neostigmina, piridostigmina. Inibitori irreversibili della AChE. Inibitori non classici della AChE: galantamina. Antagonisti muscarinici. Alcaloidi del tropano e loro derivati: atropina, iosciamina, ioscina, omatropina, omatropina metil bromuro, scopolamina butilbromuro, ipratropio. Studi SAR sull'atropina e farmaci da essi derivati. Antagonisti nicotinici: ganglioplegici (esametonio), bloccanti neuromuscolari depolarizzanti (decametonio, sussametonio) e non-depolarizzanti: *d*-tubocurarina, atracurio, pancuronio e vecuronio.

FARMACI ATTIVI SULLA NEUROTRASMISSIONE ADRENERGICA

Recettori adrenergici: tipologia e localizzazione. Principali effetti farmacologici derivanti dalla stimolazione dei vari sottotipi recettoriali. Biosintesi, immagazzinamento, rilascio e catabolismo della nor-adrenalina (NA). Farmaci ad azione diretta e indiretta. Cocaina: caratteristiche strutturali, chimiche e suoi derivati. Principali impieghi terapeutici dei farmaci agenti sul sistema adrenergico. Agonisti ad azione mista: efedrina, pseudo-efedrina. Alcaloidi della Rauwolfia: derivati naturali e semisintetici. Yoimbina. Alcaloidi dell'ergot: ammidi semplici (ergometrina, metilergometrina, metisergide, LSD); derivati peptidici: ergotamina, ergocristina, ergocriptina, ergocorniina, bromocriptina. Principali impieghi terapeutici.

ALCALOIDI XANTINICI Caffaina, teofillina, teobromina e analoghi: caratteristiche strutturali e loro ottenimento, proprietà farmacologiche.

ANALGESICI OPIOIDI Alcaloidi dell'oppio a struttura fenantrenica. Morfina: caratteristiche strutturali e farmacologiche. Recettori degli oppioidi: classificazione, localizzazione e caratteristiche biochimiche e farmacologiche. Studi SAR sulla morfina e suoi derivati. Codeina. Oppiacei derivanti da complicazione e semplificazione molecolari. Oppioidi endogeni: encefaline, endorfine, dinorfine. Alcaloidi dell'oppio a struttura isochinolinica: papaverina e noscapina.

GLUCOSIDI ANTRACHINONICI e

Senosidi: caratteristiche strutturali, ottenimento e proprietà farmacologiche. Iperico: caratteristiche strutturali dei costituenti biologicamente attivi, ottenimento e proprietà farmacologiche.

TESTI CONSIGLIATI

- G.L. Patrick: Chimica Farmaceutica, EdiSES