

Testi del Syllabus

Resp. Did. **ZAPPALA' MARIA** **Matricola: 008946**

Docente **ZAPPALA' MARIA, 10 CFU**

Anno offerta: **2026/2027**

Insegnamento: **905 - CHIMICA FARMACEUTICA II**

Corso di studio: **7026 - CHIMICA E TECNOLOGIA FARMACEUTICHE**

Anno regolamento: **2023**

CFU: **10**

Anno corso: **4**

Periodo: **PRIMO SEMESTRE**



Testi in italiano

Lingua insegnamento ITALIANO

Contenuti

Progettazione, sintesi, relazioni struttura-attività e meccanismi di azione a livello molecolare delle seguenti classi di farmaci:

Farmaci attivi sul sistema ormonale.

Farmaci che controllano il metabolismo glucidico. Insulina e insuline modificate. Farmaci che aumentano il rilascio d'insulina e farmaci insulino-sensibilizzanti. Inibitori dell'alfa-glucosidasi, incretinomimetici, inibitori della DPP-IV, inibitori di SGLT2. Ormoni steroidei: Ormoni della corteccia surrenale: glucocorticoidi e mineralcorticoidi. Estrogeni steroidei e non steroidei. Antagonisti degli estrogeni, SERM. Farmaci per il trattamento dell'osteoporosi. Inibitori dell'aromatasi. Progestinici ed antiprogestinici. Androgeni e antiandrogeni.

Chemioterapici.

Chemioterapici antineoplastici. Farmaci alchilanti: mostarde azotate, aziridine, metansolfonati, nitrosouree, triazenoimidazoli, derivati idrazinici, complessi del platino. Antimetaboliti: inibitori di DHFR, analoghi di basi puriniche e pirimidiniche. Farmaci intercalanti del DNA e attivi sulle topoisomerasi: dactinomicina, antracicline, bleomicina, epipodofillotossine, camptotecine. Farmaci attivi sul sistema tubulina/microtubuli: alcaloidi della vinca, taxani. Inibitori di protein-chinasi recettoriali e non recettoriali. Farmaci attivi su altre vie di segnale.

Antivirali e antiretrovirali: inibitori della neuroaminidasi, farmaci attivi sulla famiglia degli herpes virus, farmaci anti-HCV. Farmaci anti-HIV: inibitori della trascrittasi inversa a struttura nucleosidica e non-nucleosidica, inibitori della proteasi, inibitori della fusione.

Chemioterapici Antibatterici: sulfamidici, chinoloni, ossazolidindioni.

Antibiotici: inibitori della biosintesi della parete cellulare batterica: penicilline, cefalosporine, beta-lattami non classici, inibitori delle beta-lattamasi, glicopeptidi, cicloserina, fosfomicina, bacitracina. Antibiotici che interferiscono con le funzioni della membrana citoplasmatica:

daptomicina, polimixine. Inibitori della trascrizione: ansamicine. Inibitori della sintesi proteica: tetracicline, aminoglicosidi, cloramfenicolo, macrolidi, lincosamidi. Antimicobatterici: antitubercolari.

Antifungini: antibiotici macrolidopolienici, flucitosina, antifungini azolici, allilammine.

Antiprotozoari. Antimalarici: chinina e aminoalcooli, 4-aminochinoline, 8-aminochinoline, antifolici, artemisinine. Farmaci impiegati nel trattamento di amebiasi, tricomoniasi, toxoplasmosi.

Testi di riferimento

A. Gasco, F. Gualtieri, C. Melchiorre - Chimica Farmaceutica - II Ed. - Casa Editrice Ambrosiana, Milano, 2020
T.L. Lemke, D.A. Williams - Foye's Principi di Chimica Farmaceutica - VII Ed. It. - Piccin, Padova, 2021
G. Costantino, G. Sbardella - Chimica Farmaceutica - 2024, EdiSES srl - Napoli.

Obiettivi formativi

L'insegnamento si propone di fornire allo studente le conoscenze relative alla progettazione razionale, alla sintesi, alle relazioni struttura-attività, ai meccanismi d'azione a livello molecolare e agli impieghi terapeutici dei principali farmaci chemioterapici e dei farmaci attivi sul sistema ormonale. Il corso approfondisce inoltre gli approcci e le metodologie applicati alla ricerca e allo sviluppo di nuovi farmaci.

Conoscenza e capacità di comprensione

Al termine dell'insegnamento lo studente dovrà:

- conoscere la struttura dei principali farmaci oggetto di studio comprendendone le relazioni struttura-attività e i meccanismi molecolari d'azione;
- comprendere la relazione tra le proprietà chimico-fisiche e le proprietà farmacocinetiche dei principali farmaci oggetto di studio;
- comprendere strategie di progettazione, sviluppo e ottimizzazione dei farmaci studiati;
- conoscere la sintesi chimica dei principali farmaci appartenenti alle diverse classi oggetto di studio.

Capacità di applicare conoscenza e comprensione

Al termine dell'insegnamento lo studente sarà in grado di:

- analizzare le molecole studiate dal punto di vista del meccanismo d'azione, identificandone il farmacoforo, le modalità di interazione con il target e le principali relazioni struttura-attività;
- discutere criticamente strategie di ottimizzazione molecolare finalizzate al miglioramento delle proprietà farmacocinetiche e farmacodinamiche;
- applicare le conoscenze acquisite alla valutazione critica di candidati farmaco in ambito di ricerca e sviluppo;
- argomentare in modo appropriato i vari passaggi del processo di sintesi dei farmaci studiati.

Prerequisiti

Lo studente deve possedere conoscenze di fisiologia umana, patologia umana, e dei principi generali di chimica farmaceutica

Propedeuticità: Chimica organica II; Fisiologia e patologia; Chimica farmaceutica generale

Metodi didattici

L'insegnamento è articolato in 9 CFU di lezioni frontali e 1 CFU di attività seminariali. Le lezioni frontali sono finalizzate all'acquisizione delle conoscenze teoriche relative agli argomenti previsti dal programma. Le attività seminariali sono dedicate all'approfondimento di tematiche propedeutiche e di supporto alla comprensione degli argomenti trattati nel corso. Le attività seminariali prevedono inoltre il coinvolgimento attivo degli studenti mediante l'approfondimento di specifici aspetti chimico-farmaceutici e l'analisi critica dei percorsi di sintesi di principi attivi di interesse terapeutico. Il supporto all'attività didattica è rappresentato da presentazioni in formato PowerPoint utilizzate durante le lezioni frontali e le attività seminariali.

La frequenza alle attività didattiche è obbligatoria. Sono consentite assenze per non più del 50% delle ore complessivamente previste per l'insegnamento. L'assolvimento dell'obbligo di frequenza costituisce requisito per l'ammissione all'esame di profitto. La frequenza è accertata mediante il sistema informatico di rilevazione delle presenze adottato dall'Ateneo.

Altre informazioni

L'insegnamento di Chimica Farmaceutica II contribuisce al perseguimento dei seguenti Obiettivi di Sviluppo Sostenibile (Sustainable Development Goals - SDGs) dell'Agenda ONU 2030:

SDG 3 - Salute e benessere: il corso fornisce le conoscenze relative alle basi molecolari dell'azione dei farmaci e ai principi che regolano la scoperta, la progettazione e lo sviluppo di nuovi agenti terapeutici destinati alla prevenzione, al trattamento e al controllo delle patologie. SDG 4 - Istruzione di qualità: il corso promuove l'acquisizione di conoscenze avanzate e competenze scientifiche nell'ambito della chimica farmaceutica, contribuendo alla formazione di professionisti qualificati e favorendo l'apprendimento continuo e l'aggiornamento professionale.

SDG 9 - Imprese, innovazione e infrastrutture: il corso approfondisce le metodologie di progettazione razionale dei farmaci (drug design) e i processi di ricerca, sviluppo e innovazione che caratterizzano il settore farmaceutico e biotecnologico, stimolando un approccio orientato all'innovazione scientifica e tecnologica.

Modalità di verifica dell'apprendimento

La verifica dell'apprendimento viene effettuata mediante un esame orale finalizzato ad accertare il raggiungimento degli obiettivi formativi dell'insegnamento e il livello di acquisizione delle conoscenze e competenze previste.

L'esame orale prevede la discussione di almeno tre argomenti tra quelli trattati nel corso. Nel corso del colloquio lo studente dovrà dimostrare di conoscere la struttura chimica dei farmaci, i relativi meccanismi molecolari d'azione, le relazioni tra struttura chimica, attività biologica e proprietà farmacocinetiche, nonché gli impieghi terapeutici delle classi di farmaci oggetto del programma. Sarà inoltre valutata la conoscenza delle strategie di progettazione e ottimizzazione dei farmaci e dei principali percorsi sintetici impiegati per la loro preparazione.

Il voto finale, espresso in trentesimi, sarà attribuito sulla base del grado di conoscenza degli argomenti, della capacità di ragionamento e di collegamento tra i diversi contenuti del corso, della correttezza terminologica e dell'autonomia di giudizio dimostrate durante l'esame.

Obiettivi per lo sviluppo sostenibile

Codice	Descrizione
--------	-------------



Testi in inglese

	Italian
	Design, synthesis, structure-activity relationships, mechanisms of action at the molecular level of the following drug classes: Drugs affecting the hormonal systems. Insulin and drugs used to treat diabetes. Insulin and modified insulins. Drugs that increase insulin release and insulin-sensitizing drugs. Alpha-glucosidase inhibitors, incretinomimetics, DPP-IV inhibitors, SGLT2 inhibitors. Steroid hormones. Adrenal cortex hormones: glucocorticosteroids and mineralocorticosteroids. Steroidal and non-steroidal estrogens. Estrogen antagonists, SERMs. Aromatase inhibitors. Drugs for the treatment of osteoporosis. Progestins and antiprogestins. Androgens and antiandrogens. Chemotherapeutic Agents.

Anticancer drugs. Alkylating drugs: nitrogen mustards, aziridines, methanesulphonates, nitrosoureas, triazeno-imidazoles, hydrazine derivatives, platinum complexes. Antimetabolites: DHFR inhibitors, purine and pyrimidine base analogues. DNA intercalating drugs and active on topoisomerases: dactinomycin, anthracyclines, bleomycin, epipodophyllotoxins, camptothecins. Drugs active on the tubulin/microtubule system: vinca alkaloids, taxanes. Receptor and non-receptor protein kinase inhibitors. Drugs active on other signaling pathways.

Antiviral agents: neuraminidase inhibitors, drugs active on the herpes virus family, anti-HCV drugs. Anti-HIV drugs: NRTIs and NNRTIs, protease and fusion inhibitors.

Antibacterial agents: sulfonamides, quinolones, oxazolidine-diones.

Antibiotics. Inhibitors of cell-wall biosynthesis: penicillins, cephalosporins, non-classical beta-lactams, beta-lactamases inhibitors, glycopeptides, cycloserine, fosfomycin, bacitracin. Antibiotics that interfere with the functions of the cytoplasmic membrane: daptomycin, polymyxins. Transcription inhibitors: ansamycines. Protein synthesis inhibitors: tetracyclines, aminoglycosides, chloramphenicol, macrolides, lincosamides. Antimycobacterial agents: antituberculars.

Anti-fungal agents: polyene antibiotics, squalene-epoxydase inhibitors, flucytosine, azole derivatives.

Antiprotozoal agents. Antimalarials: quinine and amino alcohols, 4-aminoquinolines, 8-aminoquinolines, DHFR-inhibitors, artemisinins. Drugs used in the treatment of amoebiasis, trichomoniasis, toxoplasmosis.

A. Gasco, F. Gualtieri, C. Melchiorre - Chimica Farmaceutica - II Ed. - Casa Editrice Ambrosiana, Milano, 2020

T.L. Lemke, D.A. Williams - Foye's Principi di Chimica Farmaceutica - VII Ed. It. - Piccin, Padova, 2021

G. Costantino, G. Sbardella - Chimica Farmaceutica - 2024, EdiSES srl - Napoli.

The course aims to provide students with knowledge related to the rational design, synthesis, structure-activity relationships, molecular mechanisms of action, and therapeutic applications of the main chemotherapeutic agents and drugs acting on the hormonal system. The course also explores the approaches and methodologies applied to the research and development of new drugs.

Knowledge and understanding

At the end of the course, students will be expected to:

- know the structure of the main drugs covered in the course, understanding their structure-activity relationships and molecular mechanisms of action;
- understand the relationship between the physicochemical properties and the pharmacokinetic properties of the main drugs studied;
- understand the strategies for the design, development, and optimization of the drugs studied;
- know the chemical synthesis of the main drugs belonging to the different classes covered in the course.

Applying knowledge and understanding At the end of the course, students will be able to:

- analyze the studied molecules in terms of their mechanisms of action, identifying their pharmacophore, binding mode to the target, and main structure-activity relationships;
- critically discuss molecular optimization strategies aimed at improving pharmacokinetic and pharmacodynamic properties;
- apply the acquired knowledge to the critical evaluation of drug candidates in the context of research and development;
- appropriately explain the various steps involved in the synthesis process of the studied drugs.

	The student must have knowledge of human physiology, human pathology, and general principles of medicinal chemistry. Required exams: Organic chemistry II; Physiology and pathology; General medicinal chemistry
	The course consists of 9 ECTS credits for lectures and 1 ECTS credit for seminar activities. The lectures are aimed at providing students with theoretical knowledge related to the topics covered in the course syllabus. The seminar activities are devoted to the in-depth study of preparatory and supporting topics that facilitate the understanding of the subjects addressed during the course. They also involve the active participation of students through the analysis of specific pharmaceutical chemistry topics and the critical evaluation of synthetic pathways leading to therapeutically relevant active pharmaceutical ingredients. Teaching support is provided through PowerPoint presentations used during both lectures and seminar activities. Attendance at all teaching activities is mandatory. Absences are permitted for no more than 50% of the total hours scheduled for the course. Fulfilment of the attendance requirement is a prerequisite for admission to the final examination. Attendance is monitored through the electronic attendance tracking system adopted by the University.
	The Medicinal Chemistry II course contributes to the achievement of the following Sustainable Development Goals (SDGs) of the United Nations 2030 Agenda: SDG 3 - Good Health and Well-Being: the course provides knowledge of the molecular basis of drug action and the principles governing the discovery, design, and development of new therapeutic agents for the prevention, treatment, and control of diseases. SDG 4 - Quality Education: the course promotes the acquisition of advanced knowledge and scientific skills in the field of pharmaceutical chemistry, contributing to the education of highly qualified professionals and fostering lifelong learning and continuous professional development. SDG 9 - Industry, Innovation and Infrastructure: the course explores rational drug design methodologies and the research, development, and innovation processes that characterize the pharmaceutical and biotechnology sectors, encouraging an approach oriented toward scientific and technological innovation.
	Assessment of learning outcomes is carried out through an oral examination aimed at verifying the achievement of the course learning objectives and the level of knowledge and skills acquired by the student. The oral examination consists of the discussion of at least three topics covered during the course. During the interview, students are expected to demonstrate knowledge of the chemical structures of drugs, their molecular mechanisms of action, the relationships between chemical structure, biological activity, and pharmacokinetic properties, as well as the therapeutic applications of the drug classes included in the syllabus. Students will also be assessed on their understanding of drug design and optimization strategies and of the main synthetic pathways employed in the preparation of therapeutically relevant compounds. The final grade, expressed on a 30-point scale, will be awarded on the basis of the student's level of knowledge of the subjects covered, ability to reason and establish connections among different course topics, correct use of scientific terminology, and capacity for independent critical judgment demonstrated during the examination.

Obiettivi per lo sviluppo sostenibile

Codice	Descrizione
--------	-------------