

- 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. 2019/2020
- Informazioni Docente**  
**Giosuè Costa**, Assegnista di Ricerca nel SSD CHIM/08, Chimica farmaceutica,  
 presso il Dipartimento di Scienze della Salute, dell'Università degli Studi  
 "Magna Graecia" di Catanzaro.  
 Email: [gcosta@unicz.it](mailto:gcosta@unicz.it) Tel. +39 0961 3694298  
 Ricevimento: Lunedì dalle ore 11:00 alle ore 14:00
- 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-etanotetraidro-tebaina; 6,14-etanotetraidro-oripivaina. Prodotti di complicazione molecolare: diprenorfina; buprenorfina; etorfina.

Prodotti di semplificazione molecolare: morfina: butorfanolo; levorfanolo. Derivati benzomorfanici: fenazocina; pentazocina; ciclazocina. Derivati della fenilpiperidina: meperidina; a-prodina (esteri inversi); chetobemidone; profadol; etoeptazina. 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-butyl-fenoli.

## DEPRIMENTI SELETTIVI DEL SISTEMA NERVOSO CENTRALE

Ipnocici sedativi

Ipnocici 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: pimozide. 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 triciclici

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; a-metilnorepinefrina; sinefrina (ossedrina); fenilefrina; metaraminolo; metossamina; amfetamina; nafazolina; clonidina.

Inibitori della biosintesi delle catecolamine: metiltirosina; carbidopa; a-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.

Beta-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

Farmaci antiistaminici

Istamina. I recettori dell'istamina. Derivati dell'etilendiamina: fenbenzamina; tripelenamina; clorpiramina; metafenilene; bamipina; clemizolo; antazolina; prometazina; clorfenamina. Derivati del 2-amminoetano: difenidramina; clorfenossamina.

Derivati del 3-aminopropano: ciproptadina; clorfeniramina.

Corticosteroidi

Ildrocortisone; 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 benzilisoquinolinici: 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.

### Broncospasmodolitici

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

## FARMACI ATTIVI SULL'APPARATO GASTROENTERICO

### Farmaci antiulcera

Antagonisti dell'istamina sui recettori H<sub>2</sub>: nizatidina; cimetidina; ranitidina; famotidina.

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

### Farmaci stimolanti la motilità

Metoclopramide; domperidone.

### Farmaci delle malattie infiammatorie dell'intestino

Sulfa-salazina; sulfapiridina; olsalazina; mesalazina; azatioprina.

### Antidiarroici

Loperamide; difenossilato.

## FARMACI ATTIVI SUL SISTEMA CARDIOVASCOLARE

Antiaritmici: 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 ottile; nitroglicerina; eritritetranitrato; 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.

alfa-bloccanti: prazosina; doxazosina.

beta-bloccanti: propranolo; sotalolo.

Vasodilatatori ad azione diretta: diazossido; idralazina; diidralazina; minoxidil; nitroprussiato 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**

- Artico, M., Lezioni di Chimica Farmaceutica e Tossicologica II, voll. I,II,III, Ed. CISU, Roma, Ultima edizione.

- Schroder, E., Chimica Farmaceutica, voll. I, II; Ed. S.E.S., Napo-li, 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:

	<b>Conoscenza e comprensione argomento</b>	<b>Capacità di analisi e sintesi</b>	<b>Utilizzo di referenze</b>
Non idoneo	Importanti carenze. Significative inaccuratezze	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



*Josef*