UNIVERSITÀ DI PISA

CHIMICA FARMACEUTICA II

MARCO MACCHIA

Anno accademico	2016/17
CdS	FARMACIA
Codice	036CC
CFU	9

Moduli	Settore/i	Tipo	Ore	Docente/i
CHIMICA FARMACEUTICA II	CHIM/08	LEZIONI	63	MARCO MACCHIA SIMONA RAPPOSELLI

Programma (contenuti dell'insegnamento)

Gli argomenti citati in questo programma vengono integralmente svolti nell'ambito di lezioni frontali.

Deprimenti non selettivi del Sistema Nervoso Centrale

ANESTETICI GENERALI: Generalità; Protossido d'azoto, Alotano, Metossiflurano, Enflurano, Desflurano, Isoflurano, Sevoflurano, Chetamina, Propofolo. Meccanismi di azione. Metabolismo degli anestetici volatili.

ANESTETICI LOCALI: Meccanismi d'azione; Tipi di anestesia locale; Relazioni attività- struttura; Cocaina, *Procaina*, Tetracaina, Benzocaina, Cloroprocaina, Esilcaina, Benoxinato, Butacaina, Isogramina, *Lidocaina*, *Mepivacaina*, Bupivacaina, Pramoxina, Diclonina; Metabolismo.

ANALGESICI NARCOTICI: Generalità; peptidi endogeni e di sintesi e recettori; Alcaloidi dell'oppio: Meccanismo di azione, Morfina, Codeina, SAR derivati della morfina; Metabolismo della morfina e codeina; Derivati strutturalmente correlabili alla morfina: Idromorfone, Ossimorfone, Ossicodone, Idrocodone, Buprenorfina. Derivati del morfinano: rapporti struttura-attività, *Levorfanolo*, Destrometorfano, Levometorfano. Derivati del benzomorfano: (SAR) pentazocina. Derivati fenilpiperidinici: (SAR), *meperidina*. Derivati propanolamminici: *Metadone*, LAAM. Teoria bimodale di interazione oppioidi-recettori mu. Analgesici narcotici vari: Tramadolo, Fentanile, Sulfentanile, Alfentanile (generalità), Remifentanile. Antidiarroici: Loperamide.

ANTIINFIAMMATORI NON STEROIDEI, ANALGESICI E ANTIPIRETICI: Generalità. Cascata dell'acido arachidonico. Mediatori dell'infiammazione. Differenze fisiologiche e strutturali delle cicloossigenasi. *Paracetamolo* e suo metabolismo; Fenacetina. Derivati dell'acido salicilico: *Acido acetilsalicilico*, Salicilamide, Salicilati, Diflunisal. Derivati 3,5-pirazolidindionici (SAR): *Fenilbutazone* e suo metabolismo, Ossifembutazone. Derivati pirazolonici: Dipirone. Acidi arilalcanoici (SAR). Acidi arilacetici: Indometacina e suo metabolismo, Sulindac e suo metabolismo, *Diclofenac* e suo metabolismo, Nabumetone (prodrug, metabolismo). Acidi arilpropionici: *Ibuprofene* e suo metabolismo, Naprossene, Ketoprofene, Flurbiprofene e suo metabolismo. Derivati piranocarbossilici: Etodolac (SAR), Chetorolac. Acidi fenamici: Acido mefenamico, acido meclofenamico, acido flufenamico e acido niflumico: proprietà e metabolismo. Oxicam: Piroxicam e suo metabolismo, meloxicam. Derivati arilsolfonammidici: *Nimesulide*, COXIB (SAR): *Celecoxib*, Rofecoxib, valdecoxib, parecoxib, etoricoxib. Meccanismi di azione. Proprietà e tossicità cardiovascolare dei coxib. Approcci per la progettazione di nuovi FANS (NO-FANS). Fisiopatologia dell'emicrania; cenni sulle possibili terapie (alcaloidi dell'ergot, antiemetici). Triptani, meccanismo, SAR, proprietà: sumatriptan, *naratriptan*, rizatriptan, almotriptan, zolmitriptan

IPNOTICI E SEDATIVI: Generalità. Barbiturici: *Fenobarbitale*, Pentobarbitale, Tiopentale, Metabolismo. Cloralio idrato, Glutetimide, Talidomide. Meccanismi di azione.

Deprimenti selettivi del Sistema Nervoso Centrale

ANTICONVULSIVANTI: Generalità; Rapporti attività-struttura; Barbiturici: Fenobarbitale, Mefobarbitale. *Idantoine*: Fenitoina, Mefenitoina, Etotoina. Ossazolidindioni: Trimetadione. *Succinimmidi*: Fensussimide, Etosussimide. Primidone. Benzodiazepine: *Diazepam*, Clonazepam, Clorazepato dipotassico. Acido valproico, *Carbamazepina*. Meccanismi di azione.

FARMACI ANTIPARKINSON: Generalità; Anticolinergici: Benztropina, Triesifenidile. Antiistaminici: Difenidramina, Orfenadrina. Dopaminergici: *Levodopa*, Carbidopa, Benserazide, Selegillina. Amantadina. Apomorfina, pergolide, Rotigotina. Meccanismi di azione, Metabolismo, Inibitori COMT: tolcapone, entacapone.

MIORILASSANTI AD AZIONE CENTRALE: Generalità; Mefenesina, (Diazepam), baclofen, dantrolene sodico (generalità).

CURARO E CURAROSIMILI: Generalità; d-Tubocurarina (generalità, conoscenze generali sulla struttura), Metocurina ioduro (generalità, conoscenze generali sulla struttura), Succinilcolina cloruro, Decametonio cloruro, Pancuronio bromuro (generalità, conoscenze generali sulla struttura), Atracurio besilato (generalità, conoscenze generali sulla struttura).

ANALETTICI: Generalità; Meccanismi di azione; Stricnina (generalità), Pentilentetrazolo (generalità). Derivati purinici: *Caffeina*, Teobromina, Teofillina, Pentossifillina, Etofillina, Diprofillina. Dimeflina.

PSICOANALETTICI: Generalità. Timolettici: Rapporti attività-struttura; *Imipramina*, Desipramina, Amitriptilina, Nortriptilina, SSRIs: *Fluoxetina*, Paroxetina, Sertralina, Citalopram (generalità, conoscenze generali sulla struttura); SNRI: Reboxetina. Trazodone. Timeretici: Generalità; Fenelzina, Tranilcipromina, Deprenile o Selegillina, Moclobemide (generalità). Nootropi: Generalità; Aniracetam.

PSICOLETTICI:.Generalità. Meccanismi di azione. Neurolettici: Fenotiazine: *Promazina*, *Clorpromazina*, *Perfenazina*, *Flufenazina*. Tioxanteni: *Clorprotixene*. Butirrofenoni: *Aloperidolo*, Trifluperidolo, Spiperone. Difenilbutilpiperidine: Penfluridolo. Dibenzazepine: Clozapina, Loxapina. Benzamidi: Metoclopramide, Sulpiride. Ansiolitici: Benzodiazepine: Clordiazepossido e suo metabolismo, (Diazepam), Ossazepam, *Nitrazepam*, *Nimetazepam*, Lorazepam, Flurazepam, Triazolam; Rapporti attività-struttura; Meccanismo di azione. Azaspirodecandioni: Buspirone.

UNIVERSITÀ DI PISA

Sistema Nervoso Autonomo
SIMPATOMIMETICI: Generalità; Recettori adrenergici; Relazioni attività-struttura; Feniletanolammine: *Sintesi generale*; Norepinefrina, Epinefrina, Isoproterenolo, Terbutalina, Fenilefrina, Efedrina, Pseudoefedrina, Norefedrina e Norpseudoefedrina (cenni), Salbutamolo. Imidazoline: *Nafazolina*, Ossimetazolina, Clonidina.
ANTAGONISTI a-ADRENERGICI: Generalità; Tolazolina, Prazosina, Yohimbina (generalità); Alcaloidi dell'Ergot: Ergotamina (generalità, conoscenze generali sulla struttura); Farmaci della disfunzione erettile: Sildenafil, Vardenafil, Tadalafil.
ANTAGONISTI b-ADRENERGICI: Generalità; *Sintesi generale arilossipropanolammine*; Rapporti attività-struttura; Propranololo, Pindololo, Acebutololo, Atenololo.
PARASIMPATOMIMETICI: Generalità. Recettori colinergici. Agonisti muscarinici: *Acetilcolina*, Metacolina, *Carbacolo*. Inibitori dell'acetilcolinesterasi: *Neostigmina*, Piridostigmina, Rivastigmina, Donezepil, Galantamina (per Galantamina generalità). Esteri organofosforici (generalità).
ANTIMUSCARINICI: Generalità. Atropina, Propantelina.
ANTISTAMINICI: Generalità. Rapporti struttura-attività. Difenidramina, Prometazina, *Ciproeptadina*, Astemizolo, Cetirizina, Loratadina (per loratadina generalità), Mizolastina (per mizolastina generalità).
FARMACI ANTIULCERA: Generalità. Antagonisti H2: *Cimetidina*, Ranitidina. Inibitori dell'(H+/K+)-ATPasi: Omeprazolo. Meccanismi di azione.
Cuore e circolazione sanguigna
CARDIOTONICI: Glucosidi cardiaci: Generalità; Lanatoside A. Meccanismo di azione.
CORONARODILATATORI: Generalità. Nitrito di amile, Nitroglicerina, Isosorbide dinitrato, *Pentaeritrolo tetranitrato*, Dipiridamolo. Meccanismi di azione.
ANTIANGINOSI ANTAGONISTI DEI CANALI DEL CALCIO: Generalità. *Nifedipina*, Amlodipina, Diltiazem, Verapamile. Meccanismi di azione.
ANTIARITMICI: Generalità. Procainamide, (Propranololo e beta bloccanti), Amiodarone (generalità), (Antagonisti dei Canali del Calcio). Meccanismi di azione.
FARMACI ANTILIPEMICI: Generalità. Mevastatina, Lovastatina, Simvastatina, altre statine (cenni). Sequestranti Biliari, colestiramina e colestrano. Clofibrato e analoghi. Esteri etilici del DHA e dell'EPA.
Integratori (nutraceutici). Acidi monoinsaturi (MUFA) e polinsaturi (PUFA) (generalità); Omega 3, Omega 6 e Omega 9 (generalità); Acido Docosaesaenoico (DHA), Acido eicosapentaenoico (EPA); Acido oleico. Idrossitirosolo. Beta glucani (generalità). Fitosteroli (generalità). Riso rosso e monacolina K (generalità).
FARMACI ANTIOBESITA': Orlistat, Sibutramina (generalità); meccanismi di azione.
ANTIIPERTENSIVI: Generalità. (Clonidina, Prazosina, Antagonisti b-adrenergici). Metildopa. (Antagonisti dei Canali del Calcio). Inibitori del sistema renina-angiotensina: *Captopril*, Enalapril, altri ACE inibitori (cenni). Meccanismi di azione. Antagonisti dell'angiotensina II: Losartan, Valsartan, Candesartan.
DIURETICI: Generalità. Furosemide, Acido etacrinico, Spironolattone. Meccanismi di azione.
Vitamine
VITAMINE LIPOSOLUBILI: A, D, E, K.
VITAMINE IDROSOLUBILI: B1, B2, B6, B12, PP, C.

Nota: Dei farmaci indicati in corsivo è richiesta la conoscenza di una via sintetica. I farmaci riportati in parentesi sono stati citati in altre categorie farmacologiche.

Bibliografia e materiale didattico
Testi consigliati
G.L. Patrick. Chimica farmaceutica (III Edizione). 2015, EdiSES, Napoli
T.L. Lemke, D.A. Williams. Foye's Principi di Chimica Farmaceutica. Sesta Edizione Italiana, 2014, Piccin Editore, Padova.

Modalità d'esame
Orale

Ultimo aggiornamento 14/11/2016 17:27