

CORSO DI STUDIO: **BIOTECNOLOGIE INDUSTRIALI E FARMACEUTICHE**

ANNO ACCADEMICO: **2023-2024**

DENOMINAZIONE DELL'INSEGNAMENTO: **CHIMICA FARMACEUTICA (MEDICINAL
CHEMISTRY, 6 CFU)**

Principali informazioni sull'insegnamento	
Anno di corso	I anno
Periodo di erogazione	I semestre dal 01/10/23 al 19/01/24
Crediti formativi universitari (CFU/ETCS):	8
SSD	CHIM/08 – Chimica Farmaceutica
Lingua di erogazione	Italiano
Modalità di frequenza	Frequenza dell'insegnamento facoltativa

Docente	
Nome e cognome	Alessia Carocci
Indirizzo mail	alessia.carocci@uniba.it
Telefono	080/5442744
Sede	Dipartimento di Farmacia-Scienze del Farmaco, III piano, stanza 430
Sede virtuale	Codice Teams: 0a4ug8r
Ricevimento	Mercoledì 11:00–12:00 per appuntamento

Organizzazione della didattica			
Ore			
Totali	Didattica frontale	Esercitazioni	Studio individuale
150	40	15	95
CFU/ETCS			
6	5	1	

Obiettivi formativi	L'obiettivo del corso è quello di fornire agli studenti gli strumenti per comprendere la relazione tra la struttura chimica delle varie classi di farmaci e la loro attività biologica nonché il meccanismo chimico alla base della loro interazione con i componenti dell'ambiente biologico. Attraverso queste conoscenze, lo studente sarà in grado di identificare i gruppi funzionali e le proprietà strutturali dei farmaci importanti per la loro azione, prevederne le proprietà chimiche e chimico-fisiche desumibili dalla loro struttura e discutere le possibili conseguenze sulle proprietà biologiche e il metabolismo.
Prerequisiti	Conoscenze di base di chimica organica e biochimica. Conoscenza delle strutture e della reattività chimica di molecole organiche, con particolare attenzione agli eterocicli. Conoscenza della struttura e funzione delle principali macromolecole di interesse biologico (enzimi, proteine, DNA etc)

<p>Metodi didattici</p>	<p>Didattica frontale. Le lezioni saranno svolte con il supporto del video proiettore per la presentazione delle slide in power point. Esercitazioni in aula durante le quali sarà valutato l'apprendimento attraverso quiz a risposta multipla.</p>
<p>Risultati di apprendimento previsti</p> <p>DD1 Conoscenza e capacità di comprensione</p> <p>DD2 Conoscenza e capacità di comprensione applicate</p> <p>DD3-5 Competenze trasversali</p>	<p>Descrittore di Dublino 1: Alla fine del corso lo studente dovrà conoscere i concetti base della Chimica Farmaceutica riguardanti le interazioni farmaco-bersaglio molecolare e la farmacocinetica. Dovrà essere in grado di comprendere gli aspetti fondamentali riguardanti i meccanismi d'azione a livello molecolare e le relazioni struttura-attività delle classi di farmaci citate nel programma.</p> <p>Descrittore di Dublino 2: Alla fine del corso lo studente dovrà essere in grado di scrivere la formula di struttura dei principali farmaci delle classi riportate nel programma, prevedere le proprietà chimiche e chimico-fisiche, discuterne le possibili conseguenze sulle proprietà biologiche, prevedere/giustificare le possibili trasformazioni metaboliche.</p> <p>Descrittore di Dublino 3:</p> <ul style="list-style-type: none"> • <i>Autonomia di giudizio</i> <p>Al termine del corso lo studente dovrà dimostrare di saper commentare relazioni struttura-attività e prevedere il comportamento del farmaco nelle varie fasi della sua azione, dalla somministrazione all'eliminazione sulla base delle sue proprietà strutturali, chimiche e chimico-fisiche. Esercitazioni in aula riguardanti esempi specifici aiuteranno lo studente a sviluppare questa abilità.</p> <p>Descrittore di Dublino 4:</p> <ul style="list-style-type: none"> • <i>Abilità comunicative</i> <p>Al termine del corso lo studente dovrà aver acquisito la capacità di esporre con chiarezza i contenuti del corso utilizzando un linguaggio tecnico specifico.</p> <p>Descrittore di Dublino 5:</p> <ul style="list-style-type: none"> • <i>Capacità di apprendere in modo autonomo</i> <p>Al termine del corso lo studente avrà acquisito una buona autonomia nella comprensione dei materiali di studio e didattici inerenti al corso e la capacità di desumere relazioni tra struttura e proprietà chimiche, chimico-fisiche, farmacocinetiche e farmacodinamiche relativamente a casi specifici presentati nel corso di esercitazioni. Lo studente svilupperà capacità di apprendimento per intraprendere studi successivi con un alto grado di autonomia.</p>

<p>Contenuti di insegnamento (Programma)</p>	<p>PARTE GENERALE</p> <ul style="list-style-type: none"> • Introduzione alla Chimica Farmaceutica. Definizione e obiettivi. Nomenclatura e classificazione dei farmaci. I bersagli molecolari dei farmaci. Interazioni farmaco-bersaglio. • Proprietà dei farmaci ed attività biologica. Proprietà chimico-fisiche dei farmaci: proprietà acido-base; ionizzazione; solubilità; lipofilia. Caratteristiche strutturali: isomeria conformazionale e configurazionale. Analoghi rigidi. Atropisomeria. • Farmacocinetica. Assorbimento dei farmaci. Distribuzione. Metabolismo dei farmaci: reazioni di I e II fase. Escrezione. Profarmaci, farmaci soft e farmaci hard. Interazione tra farmaci. • Farmacodinamica. Interazione farmaco-recettore: agonisti, antagonisti, agonisti inversi; modulatori allosterici. Inibizione enzimatica: inibitori competitivi e non competitivi inibitori allosterici, inibitori irreversibili. Altri bersagli molecolari. <p>PARTE SISTEMATICA</p> <ul style="list-style-type: none"> • Agenti antibatterici. Antimetaboliti: sulfamidici. Antibiotici β-lattamici: penicilline, cefalosporine. • Farmaci attivi sul sistema nervoso colinergico. Acetilcolina: struttura, relazioni struttura-attività e legame al recettore. Agonisti del recettore colinergico: agonisti muscarinici e nicotinici. Antagonisti muscarinici e nicotinici. Acetilcolinesterasi e anticolinesterasici. • Farmaci attivi sul sistema nervoso adrenergico. Agonisti endogeni. Agonisti e antagonisti adrenergici. Altri farmaci che influenzano la trasmissione adrenergica. • Farmaci attivi sulla trasmissione dopaminergica. Dopamina: biosintesi, proprietà molecolari e recettori dopaminergici. Agonisti dopaminergici per il trattamento del morbo di Parkinson. Agonisti dopaminergici indiretti: inibitori MAO e COMT. Antagonisti dopaminergici: neurolettici di prima generazione e neurolettici atipici. • Analgesici oppioidi. Morfina, recettori oppioidi, relazioni struttura-attività. Analoghi della morfina. Agonisti e antagonisti oppioidi. Peptidi oppioidi e oppioidi endogeni. Teoria di legame delle encefaline. • Farmaci per i disturbi d'ansia, sedativi e ipnotici. Alcoli, aldeidi, Barbiturici, benzodiazepine, agonisti parziali 5-HT_{1A}, farmaci "zeta", agonisti dei recettori della melatonina. • Farmaci antidepressivi e antipsicotici. Inibitori delle monoaminossidasi, antidepressivi triciclici, inibitori della ricaptazione delle ammine biogene. Antagonisti dei recettori serotoninergici. Antipsicotici di prima e seconda generazione. • Farmaci del sistema cardiovascolare. Farmaci antiaritmici, farmaci antianginosi. Farmaci calcio-antagonisti. Farmaci che agiscono sul sistema renina-angiotensina (ACE inibitori, antagonisti del recettore dell'angiotensina II, inibitori della renina).
<p>Testi di riferimento</p>	<p>Graham L. Patrick; Introduzione alla Chimica farmaceutica (EdiSES) Gasco, Gualtieri, Melchiorre: Chimica Farmaceutica (Casa Editrice Ambrosiana)</p>
<p>Note ai testi di riferimento</p>	<p>Slides relative alla presentazione delle lezioni</p>
<p>Materiali didattici</p>	<p>Le slides delle lezioni frontali saranno reperibili sulla classe Teams di cui è riportato sopra il codice.</p>

Valutazione	
Modalità di verifica dell'apprendimento	L'esame prevede una prova orale finalizzata ad accertare il livello di conoscenza e capacità di comprensione raggiunto dallo studente relativamente ai contenuti teorici indicati nel programma per il raggiungimento della sufficienza. Si valuterà inoltre la capacità espositiva degli argomenti oggetto del colloquio, l'autonomia di giudizio e ragionamento critico relativamente allo studio effettuato e la capacità di collegare tra loro gli argomenti trattati.
Criteri di valutazione	<ul style="list-style-type: none"> • <i>Conoscenza e capacità di comprensione:</i> Conoscenza dei concetti base della Chimica Farmaceutica riguardanti le interazioni farmaco-bersaglio molecolare, la farmacocinetica e la scoperta di farmaci. Capacità di comprendere i meccanismi molecolari alla base dell'azione dei farmaci e le relazioni struttura-attività delle classi di farmaci riportate nel programma. • <i>Conoscenza e capacità di comprensione applicate:</i> Capacità di scrivere la formula di struttura dei principali farmaci delle classi riportate nel programma a partire dai loro nomi e viceversa, prevederne le proprietà chimiche e chimico-fisiche, discuterne le possibili conseguenze sulle proprietà biologiche, prevedere/giustificare le possibili trasformazioni metaboliche. • <i>Autonomia di giudizio:</i> Capacità di argomentare su meccanismo d'azione, correlazioni struttura-attività, profilo farmacocinetico e farmacodinamico delle classi di farmaci studiate. • <i>Abilità comunicative:</i> Chiarezza e completezza nell'esposizione orale dei contenuti del corso. • <i>Capacità di apprendere:</i> Capacità di operare collegamenti nell'ambito dei contenuti del corso e degli insegnamenti affini.
Criteri di misurazione dell'apprendimento e di attribuzione del voto finale	Il voto finale è attribuito in trentesimi, sulla base delle conoscenze e della capacità di comprensione. L'esame si intende superato quando il voto è maggiore o uguale a 18. Per conseguire una valutazione elevata lo studente deve avere sviluppato autonomia di giudizio e adeguata capacità di argomentazione ed esposizione.

COURSE OF STUDY: INDUSTRIAL AND PHARMACEUTICAL BIOTECHNOLOGIES

ACADEMIC YEAR: 2023-2024

ACADEMIC SUBJECT: MEDICINAL CHEMISTRY (6 CFU)

ACADEMIC YEAR

General information	
Year of the course	I
Academic calendar (starting and ending date)	I semester from October 1 th , 2023 to January 19 th , 2024
Credits (CFU/ETCS):	6
SSD	CHIM/08 – Medicinal Chemistry
Language	Italian
Mode of attendance	Optional attendance

Professor/ Lecturer	
Name and Surname	ALESSIA CAROCCI
E-mail	alessia.carocci@uniba.it
Telephone	080/5442744
Department and address	Department of Pharmacy-Drug Sciences, 3rd floor, room 430
Virtual room	Teams code: 0a4ug8r
Office Hours	11:00–12:00 Wednesday by appointment

Work schedule			
Hours			
Total	Lectures	Hands-on (laboratory, workshops, working groups, seminars, field trips)	Out-of-class study hours/ Self-study hours
150	40	15	95
CFU/ETCS			
6	5	1	

Learning Objectives	The aim of the course is to provide students with the tools to understand the relationship between the structure of the different classes of drugs and their biological activity as well as the chemical mechanism underlying their interaction with the components of the biological environment. Through this knowledge, the student will be able to identify the functional groups and structural properties of drugs important for their action and predict the chemical and physic-chemical properties elicited from their structure, discussing the possible consequences on biological properties and metabolism.
Course prerequisites	Basic knowledge of organic chemistry and biochemistry. Knowledge of the structures and chemical reactivity of organic molecules, with particular attention to heterocycles. Knowledge of the structure and function of the main macromolecules of biological interest (enzymes, proteins, DNA).

Teaching strategie	Lectures. The lessons will be held with the support of the video projector for the power point presentations. Classroom exercises during which learning will be assessed through multiple choice questions.
Expected learning outcomes in terms of	
Knowledge and understanding on:	At the end of the course the student will have to know the basic concepts of Medicinal Chemistry concerning drug-molecular target interactions and pharmacokinetics. The student should be able to understand the fundamental aspects concerning the mechanisms of action at the molecular level and the structure-activity relationships of the drug classes described in the program.

Applying knowledge and understanding on:	At the end of the course the student must be able to write the structural formula of the main drugs of the classes listed in the program, predict their chemical and chemical-physical properties, discuss their possible consequences on biological properties, predict / justify the metabolic transformations.
Soft skills	<ul style="list-style-type: none"> • <i>Making informed judgments and choices</i> At the end of the course, the student must be able to comment on structure-activity relationships and predict the behavior of the drug in the various stages of its action, from administration to elimination based on its structural, chemical and chemical-physical properties. • <i>Communicating knowledge and understanding</i> At the end of the course the student must have acquired the ability to clearly present the contents of the course using a specific language. • <i>Capacities to continue learning</i> At the end of the course the student must have acquired a good autonomy in reading and understanding the study and teaching materials inherent to the course and the ability to infer relationships between structure and chemical, chemical-physical, pharmacokinetic and pharmacodynamic properties in specific cases.

Syllabus	
Content knowledge	<p>GENERAL PART</p> <ul style="list-style-type: none"> • Introduction to Medicinal Chemistry. Definition and objectives. Nomenclature and classification of drugs. The molecular targets of drugs. Drug-target interactions. • Properties of drugs and biological activity. Physic-chemical properties of drugs: acid-base properties; ionization; solubility; lipophilicity. Structural characteristics: conformational and configurational isomerism. Rigid analogues. Atropisomerism. • Pharmacokinetics. Absorption of drugs. Distribution. Drug metabolism: phase I and II reactions. Excretion. Prodrugs, soft drugs, and hard drugs. Interaction between drugs. • Pharmacodynamics. Drug-receptor interaction: agonists, antagonists, inverse agonists; allosteric modulators. Enzyme inhibition: competitive and non-competitive inhibitors allosteric inhibitors, irreversible inhibitors. Other molecular targets. <p>SYSTEMATIC PART</p> <ul style="list-style-type: none"> • Antibacterial agents. Antimetabolites: sulfonamides. β-lactam antibiotics: penicillins, cephalosporins. • Drugs active on the cholinergic nervous system. Acetylcholine: structure, structure-activity relationships, and receptor binding. Cholinergic receptor agonists: muscarinic and nicotinic agonists. Muscarinic and nicotinic antagonists. Acetylcholinesterase and anticholinesterases. • Drugs active on the adrenergic nervous system. Endogenous agonists. Adrenergic agonists and antagonists. Other drugs affecting adrenergic transmission. • Drugs active on dopaminergic transmission. Dopamine: biosynthesis, molecular properties, and dopaminergic receptors. Dopaminergic agonists for the treatment of Parkinson's disease. Indirect dopaminergic agonists: MAO and COMT inhibitors. Dopaminergic antagonists: first generation neuroleptics and atypical neuroleptics. • Opioid analgesics. Morphine, opioid receptors, structure-activity relationships. Morphine analogues. Opioid agonists and antagonists. Opioid peptides and endogenous opioids. Binding theory of enkephalins. • Drugs for anxiety disorders, sedatives, and hypnotics. Alcohols, aldehydes, barbiturates, benzodiazepines, partial 5-HT_{1A} agonists, "zeta" drugs, melatonin receptor agonists. • Antidepressant and antipsychotic drugs.

	<p>Monoamine oxidase inhibitors, tricyclic antidepressants, biogenic amine reuptake inhibitors. Serotonergic receptor antagonists. First and second-generation antipsychotics.</p> <p>• Drugs of the cardiovascular system. Antiarrhythmic drugs, antianginal drugs. Calcium channel blockers. Drugs that act on the renin-angiotensin system (ACE inhibitors, angiotensin II receptor antagonists, renin inhibitors).</p>
Texts and readings	Graham L. Patrick; Introduzione alla Chimica farmaceutica (EdiSES) Gasco, Gualtieri, Melchiorre: Chimica Farmaceutica (Casa Editrice Ambrosiana)
Notes, additional materials	Slides related to the presentation of the lessons.
Repository	The slides of the lectures will be available on the Teams class whose code is shown above.

Assessment	
Assessment methods	The exam includes an oral test aimed at ascertaining the level of knowledge and understanding achieved by the student in relation to the theoretical contents indicated in the program for the achievement of the sufficiency. The ability to present the topics covered by the interview, the autonomy of judgment and critical reasoning in relation to the study carried out and the ability to link the topics covered will also be assessed.
Assessment criteria	<ul style="list-style-type: none"> • <i>Knowledge and understanding</i> Knowledge of the basic concepts of Medicinal Chemistry concerning drug-molecular target interactions and pharmacokinetics. Ability to understand the molecular mechanisms underlying the action of drugs and the structure-activity relationships of the classes of the drugs reported in the program. • <i>Applying knowledge and understanding</i> Ability to write the structural formula of the main drugs of the classes listed in the program, predict their chemical and physico-chemical properties, discuss their possible consequences on biological properties, predict / justify possible metabolic transformations. • <i>Autonomy of judgment</i> Ability to argue on the mechanism of action, structure-activity relationships, pharmacokinetic and pharmacodynamic profile of the classes of the drugs studied. • <i>Communicating knowledge and understanding</i> Clarity and completeness in the oral presentation of the course contents. • <i>Capacities to continue learning</i> Ability to make connections within the course contents and with related courses.
Final exam and grading criteria	The final grade is awarded out of thirty, based on knowledge and understanding. The exam is passed when the grade is greater than or equal to 18. To achieve a high evaluation, the student must have developed autonomy of judgment and adequate capacity for argumentation and presentation.