
INSEGNAMENTO: CHIMICA ORGANICA DEI PRODOTTI BIOATTIVI

ANNO ACCADEMICO: 2019-2020

TIPOLOGIA DI ATTIVITÀ FORMATIVA: A SCELTA

DOCENTE: Maria Funicello

e-mail: maria.funicello@unibas.itsito web: scienze.unibas.it/site/home.html.

telefono: 0971/205490

cell. 3204371612

Lingua di insegnamento: italiano

n. CFU: 6

(6 di lezione e 0 di
esercitazioni/laboratorio)

n. ore: 48

(48 lezione)

Sede: **Potenza**

Dipartimento/Scuola:

Dipartimento di Scienze

CdS

Semestre: 1**Dal 01.10.2019****al 20 gennaio****2020**

OBIETTIVI FORMATIVI E RISULTATI DI APPRENDIMENTO

L'obiettivo principale del corso consiste nel fornire agli studenti le basi per affrontare la conoscenza e la progettazione di nuove molecole candidate a diventare farmaci.

Le principali conoscenze fornite saranno le seguenti:

- Elementi di base nella progettazione di nuovi farmaci
- Caratteristiche fondamentali delle categorie di farmaci e del loro assemblaggio
- Conoscenze di base per affrontare la sintesi chimica senza trascurare gli aspetti stereochimici

Le principali abilità che si potranno conseguire sono:

- Analizzare le strutture potenzialmente bioattive e l'interazione struttura-attività
 - Valutare gli approcci sintetici migliori e i potenziali analoghi
 - Utilizzare le conoscenze acquisite per progettare lo scale-up
-

PREREQUISITI

Necessita aver acquisito ed assimilato le principali conoscenze di chimica organica strumentale e sintetica fornite dai corsi di base e caratterizzanti del settore disciplinare CHIM/06, svolti nel corso della laurea di I livello

CONTENUTI DEL CORSO

1. Concetto di farmaco naturale e di sintesi, organizzazione del team per la ricerca di nuovi lead compounds, viaggio di una nuova struttura dalla sua sintesi ai test di attività biologica; Descrizione e differenze tra la fase pre-clinica e le varie fasi cliniche; impianti pilota e brevetti. Relazioni tra struttura chimica e attività biologica: configurazioni sin e anti, configurazione assoluta. (0.5 CFU)

2. Metodi di variazione della struttura del "lead compound": intervento su dimensioni e rigidità (caso della morfina), introduzione di sostituenti sugli anelli (metile, alogeno, ossidrilico, carbossilico, amminico gruppo), concetto di isostere e bioisostere. Approcci sintetici alla preparazione di un lead: sintesi classica, lineare e convergente. Metodi di purificazione ottica, agenti risolvanti. Categorie di farmaci. Chimica combinatoriale (1 CFU)

3. Chemioterapici: batteri, virus e altri microorganismi. Target proteici usuali dei microorganismi. Membrane cellulari di procari ed eucarioti. Antifungini: classi caratteristiche e meccanismi d'azione. Antibiotici e antivirali. Caso del virus HIV1: ciclo vitale, punti di blocco, Tipo di terapia e farmaci che bloccano la proteasi virale. Recettori: azioni, tipologie e modulatori. Canali ionici, inibizione competitiva e non competitiva. (0.5 CFU)

4. Farmaci antitumorali: azione, categorie, antimetaboliti, intercalanti, Tomografia ad emissione di positroni per la diagnostica. Caratteristiche degli interferoni. Ciclo cellulare in cellule normali e in cellule tumorali.

Farmaci del SNC: caratteristiche e meccanismi d'azione. Anti-Alzheimer. Anti- Parkinson. Peptidomimetici e pseudo peptidi. Tipi di "scaffold". Confronto tra BACE 1 e HIV Proteasi: due aspartil proteasi interessate in due malattie molto diverse tra loro. Aggregazione in fibrille. Small molecole attraverso la reazione di Biginelli. (1 CFU)

5. Prodrugs: necessità, caratteristiche, applicazioni agli antitumorali, veicoli di prodrugs. ADEPT, ADAPT, GDEPT, VDEPT. Tripartati: caratteristiche e metodi di approccio, trasformazione del farmaco in forma biologicamente attiva. (1.5 CFU)

6. "From bench to market": Definizione di ricerca industriale e di PRDG, funzione in grandi, piccole e medie industrie, qualità standard dei prodotti, produzione dei generici, atom economy e environmental impact, catalisi, intermedi e scale up. Aciclovir: storia e sintesi successive. (1 CFU)

7. Chimica delle formulazioni. (0.5 CFU)

METODI DIDATTICI

Il corso è strutturato nel seguente modo:

- Lezioni in aula su tutti gli argomenti in programma (36 ore)
- Visita ad aziende del settore (4 ore)
- Esercitazioni in aula (4 ore)
- Seminari esperti (4 ore)

MODALITÀ DI VERIFICA DELL'APPRENDIMENTO

La verifica dell'apprendimento avviene nel seguente modo:

- Presentazione di un elaborato su un argomento di avanguardia svolto durante il corso
- Discussione sugli argomenti trattati nell'elaborato
- Valutazione della capacità di collegare e confrontare aspetti diversi trattati durante il corso.

TESTI DI RIFERIMENTO E DI APPROFONDIMENTO, MATERIALE DIDATTICO ON-LINE

1. Gareth Thomas, *Medicinal Chemistry, an introduction*, Wiley Interscience

2. Silverman, R.B. *The Organic Chemistry of Drug Design and Drug Action*; Elsevier Academic Press: Evanston, IL, USA, 2004

3. Cabri, W.; Di Fabio, R. *From bench to market*, Oxford University Press, New York, 2000

4. H.P. Rang, M.M. Dale, J. M. Ritter, P. K. Moore, *Farmacologia*, Casa Editrice Ambrosiana per l'edizione italiana.

METODI E MODALITÀ DI GESTIONE DEI RAPPORTI CON GLI STUDENTI

Contatto via mail e ricevimento in qualsiasi giorno della settimana previo appuntamento

DATE DI ESAME PREVISTE¹: 20/2/2020; 20/3/2020; 15/5/2020; 19/6/2020; 17/7/2020;15/10/2020; 19/11/2020; 18/12/2020

SEMINARI DI ESPERTI ESTERNI XSI NO

ALTRE INFORMAZIONI
