

	<i>italiano</i>	<i>inglese</i>
DENOMINAZIONE INSEGNAMENTO	Chimica farmaceutica II	Medicinal chemistry II
Modulo (se pertinente)	---	---
Lingua Insegnamento	Italiano	Italian
Obiettivi formativi	L'insegnamento si propone di fornire allo studente le conoscenze relative alla progettazione razionale, alla sintesi, alle relazioni struttura-attività e ai meccanismi d'azione a livello molecolare dei principali farmaci chemioterapici e dei farmaci attivi sul sistema ormonale. 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 d'azione a livello molecolare; • comprendere la relazione tra le proprietà chimico-fisiche e il profilo ADMET 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 molecolare 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; • argomentare in modo appropriato i vari passaggi del processo di sintesi dei farmaci studiati.	The course aims to provide students with knowledge of the rational design, synthesis, structure-activity relationships and mechanisms of action at the molecular level of the main chemotherapeutic drugs and drugs that act on the endocrine system. Knowledge and understanding By the end of the course, students will be able to: • understand the structure of the main drugs under study, including their structure-activity relationships and mechanisms of action at the molecular level; • understand the relationship between the physicochemical properties and the ADMET profile of the main drugs under study; • understand strategies for the design, development and optimisation of the drugs studied; • be familiar with the chemical synthesis of the main drugs belonging to the various classes under study. Ability to apply knowledge and understanding By the end of the course, students will be able to: • analyse the molecules studied from the perspective of their molecular mechanism of action, identifying their pharmacophore, modes of interaction with the target and the main structure-activity relationships; • critically discuss molecular optimisation strategies aimed at improving pharmacokinetic and pharmacodynamic properties; • appropriately explain the various steps in the synthesis

		process of the drugs under study.
Metodi Didattici	Lezioni in aula (9 CFU = 54 h) e seminari (1 CFU = 12 h). Strumenti a supporto della didattica: PC e videoproiettore/LIM per presentazioni in PowerPoint. Le lezioni frontali hanno l'obiettivo di fornire agli studenti le conoscenze teoriche relative agli argomenti previsti dal programma del corso. Le attività seminariali sono finalizzate all'approfondimento di tematiche propedeutiche e di supporto alla comprensione degli argomenti trattati durante le lezioni. Esse incoraggiano inoltre la partecipazione attiva degli studenti attraverso l'analisi di specifici aspetti chimico-farmaceutici e la discussione critica dei percorsi di sintesi di alcuni dei farmaci oggetto del corso. 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.	Classroom lectures (9 ECTS credits = 54 hours) and seminars (1 ECTS credit = 12 hours). Teaching aids include a personal computer and a video projector/interactive whiteboard (IWB) for PowerPoint presentations. The lectures are intended to provide students with the theoretical knowledge related to the topics included in the course syllabus. Seminar activities are aimed at the in-depth study of preparatory topics and at supporting the understanding of the subjects covered during the lectures. They also encourage the active participation of students through the analysis of specific medicinal chemistry topics and the critical discussion of the synthetic pathways of selected drugs covered in the course. Attendance at teaching activities is mandatory. Students may be absent for no more than 50% of the total number of 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 recording system adopted by the University.
Prerequisiti	Propedeuticità: Chimica farmaceutica generale.	Prerequisites: General Medicinal Chemistry.
Verifiche dell'apprendimento	La verifica dell'apprendimento consiste in un esame orale finalizzato ad accertare il raggiungimento degli obiettivi formativi dell'insegnamento e il livello di acquisizione delle conoscenze e delle competenze previste. L'esame orale prevede la discussione di almeno tre argomenti tra quelli trattati nel corso. Durante il 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 incluse nel programma. Sarà inoltre valutata la conoscenza	Assessment of learning is based on an oral examination aimed at verifying the achievement of the course learning objectives and the level of acquisition of the expected knowledge and skills. The oral examination consists of the discussion of at least three topics covered during the course. During the examination, 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

	delle strategie di sviluppo dei farmaci trattati e dei principali percorsi sintetici utilizzati per la loro preparazione. Il voto finale, espresso in trentesimi, tiene conto del livello di conoscenza e di approfondimento degli argomenti trattati, della capacità di valutazione critica e della chiarezza e appropriatezza dell'esposizione.	therapeutic applications of the drug classes included in the syllabus. Students will also be assessed on their understanding of the drug development strategies discussed during the course and of the main synthetic pathways employed for their preparation. The final grade, expressed on a 30-point scale, is based on the student's level of knowledge and depth of understanding of the topics covered, as well as on their critical evaluation skills and the clarity and appropriateness of their presentation.
Programma del corso (Contenuti)	Progettazione, sintesi, relazioni struttura-attività e meccanismi di azione a livello molecolare delle classi di farmaci elencate di seguito. Farmaci chemioterapici - Chemioterapici e antibiotici antibatterici: Sulfamidici. Chino- loni. Ossazolidinoni. Antibiotici inibitori della biosintesi della parete cellulare batterica: penicilline, cefalosporine, beta-lattami non clas- sici, glicopeptidi, cicloserina, fosfomicina, bacitracine. Inibitori delle beta-lattamasi. Antibiotici che interferiscono con le funzioni della membrana citoplasmatica. Antibiotici inibitori della trascrizione: ri- famicine. Antibiotici inibitori della sintesi proteica: tetraciclina, ami- noglicosidi, cloramfenicolo e derivati, macrolidi. - Chemioterapici antimicobatterici: farmaci antitubercolari. - Chemioterapici antifungini: antibiotici macrolidopoliarici, anti- fungini azolici, allilammine, flucitosina. - Chemioterapici antiprotozoari. Farmaci antimalarici: chinina e aminoalcoli, 4-aminochinoline, 8-aminochinoline, inibitori della DHFR, artemisinina. Farmaci impiegati nel trattamento di amebiasi, trichomoniasi, toxoplasmosi. - Chemioterapici antivirali. Farmaci attivi su virus della famiglia Herpesviridae. Inibitori della neuroaminidasi. Farmaci anti-HCV. Farmaci anti-HIV: inibitori della trascrittasi inversa a struttura nu- cleosidica e non-nucleosidica, inibitori della proteasi, inibitori dell'integrasi, inibitori della fusione e dell'ingresso.	Design, synthesis, SAR, mechanisms of action at the molec- ular level and use of the following drug classes. Chemotherapeutic drugs. Antibacterial chemotherapeutics and antibiotics. Sulfona- mides. Quinolones. Oxazolidinones. Antibiotics inhibitors of bacterial cell-wall biosynthesis: penicillins, cephalospor- ins, non-classical beta-lactams. Beta-lactamases inhibitors. Polypeptide antibiotics. Transcription inhibitors: ri- famycins. Protein synthesis inhibitors: tetracyclines, ami- noglycosides, chloramphenicol, macrolides. Antimycobac- terial agents: antitubercular drugs. Anti-fungal agents: an- tibiotics (polyenes), squalene-epoxydase inhibitors, azole derivatives. Antiprotozoal agents. Drugs used in the treat- ment of malaria, amebiasis, trichomoniasis, toxoplasmo- sis. Antiviral agents: anti-herpes virus drugs, neuramini- dase inhibitors, anti-HCV drugs. Anti-HIV drugs: NRTIs and NNRTIs, protease, integrase and fusion inhibitors. Anti- cancer drugs. Alkylating agents: nitrogen mustards and others. Antimetabolites: DHFR inhibitors, purine and py- rimidine antimetabolites. Intercalating agents. Topois- omerase inhibitors. Antimitotic agents. Protein kinase in- hibitors. Drugs affecting the hormonal system.

	- Chemioterapici antineoplastici. Farmaci alchilanti: mostarde azotate, aziridine, metansolfonati, nitrosouree, triazenoimidazoli, derivati idrazinici, complessi del platino. Antimetaboliti: inibitori della DHFR, analoghi di basi puriniche e pirimidiniche. Farmaci intercalanti del DNA e inibitori delle 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 segnalazione. 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: arilsolfoniluree, glinidi, biguanidi, tiazolidindioni. Inibitori dell'alfa-glucosidasi. Incretinomimetici e inibitori della DPP-IV. Inibitori di SGLT2. - Ormoni steroidei. Estrogeni steroidei e non steroidei. Antagonisti degli estrogeni, SERM. Inibitori dell'aromatasi. Farmaci per il trattamento dell'osteoporosi. Progestinici ed antiprogestinici. Androgeni e antiandrogeni. Ormoni della corteccia surrenale: glucocorticoidi e mineralcorticoidi.	Insulin and other drugs used in the treatment of diabetes: sulphonylureas and other insulin secretagogues, biguanides, thiazolidinediones, alpha-glucosidase inhibitors, incretin mimetics, DPP-IV inhibitors, SGLT2 inhibitors. Steroid hormones: estrogens e non-steroid estrogens, estrogen antagonists, SERMs; aromatase inhibitors; drugs for osteoporosis; progestins and progesteron antagonists; androgens and androgen antagonists. Glucocorticoids and mineralocorticoids.
Testi di Riferimento	1. A. Gasco, F. Gualtieri, C. Melchiorre - Chimica Farmaceutica - II ed., Casa Editrice Ambrosiana, 2020. 2. T. L. Lemke, D. A. Williams - Foye's Principi di Chimica Farmaceutica – VII Ed. It., Piccin, Padova, 2021. 3. G.L. Patrick - Chimica Farmaceutica - III ed., EdiSES, 2015.	1. A. Gasco, F. Gualtieri, C. Melchiorre - Chimica Farmaceutica - II ed., Casa Editrice Ambrosiana, 2020. 2. T. L. Lemke, D. A. Williams - Foye's Principi di Chimica Farmaceutica – VII Ed. It., Piccin, Padova, 2021. 3. G.L. Patrick - Chimica Farmaceutica - III ed., EdiSES, 2015.
Altro	L'insegnamento di Chimica Farmaceutica II contribuisce al perseguimento dei seguenti Obiettivi di Sviluppo Sostenibile (SDGs) dell'Agenda ONU 2030: • SDG 3 – Salute e benessere: attraverso la comprensione delle basi molecolari dell'azione dei farmaci, delle relazioni tra struttura chimica e attività biologica e delle strategie di sviluppo di nuovi agenti terapeutici destinati alla prevenzione e al trattamento delle malattie.	The course in Medicinal Chemistry II contributes to the achievement of the following Sustainable Development Goals (SDGs) of the United Nations 2030 Agenda: • SDG 3 – Good Health and Well-being: through the understanding of the molecular basis of drug action, the relationships between chemical structure and biological activity, and the strategies involved in the development of new

	• SDG 4 – Istruzione di qualità: mediante l'acquisizione di conoscenze avanzate e competenze specifiche nel campo della chimica farmaceutica, richieste per la formazione di professionisti qualificati nei settori della Farmacia e della Farmacia Industriale. • SDG 9 – Imprese, innovazione e infrastrutture: attraverso lo studio delle strategie di progettazione, sintesi e sviluppo di nuovi farmaci.	therapeutic agents for the prevention and treatment of diseases. • SDG 4 – Quality Education: through the acquisition of advanced knowledge and specialized skills in the field of medicinal chemistry, which are essential for the education and training of qualified professionals in the areas of Pharmacy and Industrial Pharmacy. • SDG 9 – Industry, Innovation and Infrastructure: through the study of strategies for the design, synthesis, and development of new drugs.
--	--	---