

Argomenti generali oggetto della prova orale di Chimica farmaceutica I. Qualora la domanda fosse riferita ad un farmaco specifico deve essere descritta la struttura chimica. Meccanismo di azione ed impiego terapeutico.

- 1) Percorso per attivare un farmaco, descrivere le fasi di Ricerca e Sviluppo
- 2) Regola di Lipinski. Descrivere il concetto di coefficiente di ripartizione (P) e logP
- 3) Proprietà acido-base dei farmaci, riportare un esempio di farmaco con caratteristiche acido, basiche, neutre ed anfotero.
- 4) Distribuzione dei farmaci: proteine del plasma coinvolte. Concetto di coefficiente di distribuzione.
- 5) Descrivere le vie principali di assorbimento dei farmaci. Meccanismi di assorbimento dei farmaci attraverso le membrane biologiche.
- 6) Concetto di isosteria e biososteria. Regola dello spostamento degli idruri di Grimm. Teoria di Erlenmeyer.
- 7) Reazioni di metabolizzazione della fase I. Classificazione ed esempi. Enzimi coinvolti e localizzazione.
- 8) Reazioni di coniugazione (metabolizzazione della fase II). Classificazione ed esempi. Enzimi coinvolti e localizzazione.
- 9) Biosintesi acido tetraidrofolico. Enzimi coinvolti ed inibitori del cammino biosintetico di sintesi dell'acido tetraidrofolico
- 10) Sulfamidici, Rapporto struttura-attività biologica, formula generale. Indicare pKa ottimale. Sulfadiazina argentica, sulfametossazolo, sulfadossina.
- 11) Inibitori della diidrofolato reduttasi (DHFR), strutture ed impiego terapeutico. Indicare le relative associazioni.
- 12) Combinazioni sinergiche di sulfamidici con inibitori della diidrofolato reduttasi (DHFR) e loro impiego terapeutico. Cotrimossazolo. Fansidar
- 13) Nitrofurani. Strutture principali, classificazione e meccanismo di azione. Nitrofurantoina, Furazolidone.
- 14) Nitroimidazoli. Struttura metronidazolo, impiego terapeutico e meccanismo di azione. Metronidazolo
- 15) Linezolid: struttura, meccanismo di azione, impiego terapeutico.
- 16) Chinoloni di prima e seconda generazione (non fluorurati). Strutture, meccanismo e spettro di azione ed impiego terapeutico. Acido nalidissico, acido piromidico, acido pipemidico, cinoxacina
- 17) Chinoloni di terza generazione (fluorurati). Strutture principali, meccanismo e spettro antimicrobico di azione ed impiego terapeutico. Ciprofloxacina, Ofloxacina. Levofloxacina.
- 18) Strutture della Moxifloxacina e gatifloxacina, meccanismo di azione e spettro antibatterico. Struttura generale dei chinoloni, rapporto struttura-attività biologica.
- 19) Cloramfenicolo. Struttura della configurazione attiva, rapporto struttura-attività, pro-farmaci, meccanismo di azione ed impiego terapeutico.
- 20) Tetracicline di origine naturale, strutture e descrizione caratteristiche chimiche (se la molecola è acida, basica o anfotera). Indicare le pKa. Tetraciclina, clortetraciclina, ossitetraciclina
- 21) Tetracicline di sintesi e semisintesi. Strutture, impiego terapeutico e meccanismo di azione. Ossiciclina, metaciclina, sanciclina, minociclina
- 22) Stabilità in ambiente acido e basico delle tetracicline.
- 23) Tetracicline di terza generazione (Tigeciclina). Preparazione e termini fondamentali.
- 24) Penicillina G e penicillina V. Strutture, meccanismo di azione, preparazione.
- 25) Struttura e meccanismo di azione della fosfomicina.

- 26) Instabilità in ambiente acido della Penicillina G. Descrivere la degradazione in ambiente acido. Descrivere la struttura delle principali penicilline acido-stabili
- 27) Sensibilità delle penicilline alle beta-lattamasi. Descrivere come si ottengono penicilline beta-lattamasi resistenti. Disegnare le strutture delle penicilline beta-lattamasi resistenti acido stabili.
- 28) Penicilline ad ampio spettro. Classificazione, riportare almeno un esempio per ciascuna classe.
- 29) Augmentin. Descrivere la composizione e meccanismo di azione dei componenti.
- 30) Profarmaci dell'ampicillina. Descrivere i composti più importanti ed i processi di bioattivazione dei profarmaci.
- 31) Penicilline: associazioni tra penicilline ad ampio spettro ed inibitori delle beta-lattamasi.
- 32) Cefalosporine: struttura cefalosporina C e cefamicina C. Meccanismo di azione ed instabilità in ambiente acido e basico.
- 33) Cefalosporine di prima generazione: strutture della Cefaloridina, cefalexina e cefazolina. Vie di somministrazione e meccanismo di azione. Spettro di azione e sensibilità alle beta-lattamasi
- 34) Cefalosporine di seconda generazione. Strutture chimiche Cefamicina C, cefossitina, cefuroxima. Spettro e meccanismo di azione.
- 35) Cefalosporine di terza e quarta generazione a struttura 2-amminotiazolica. Spettro e meccanismo di azione. Spiegare l'effetto del gruppo 2-amminotiazolico e della funzionalità metossiminica.
- 36) Rapporto struttura-attività nelle cefalosporine. Riportare un esempio per ogni generazione (prima, seconda e terza).
- 37) Antibiotici beta-lattamici che contengono il nucleo del carbapenem (tienamicina ed analoghi della tienamicina quali imipenem, meropenem ed ertapenem). Strutture chimiche, Meccanismo e spettro di azione e via di somministrazione.
- 38) Antibiotici a struttura monobactamica: aztreonam. Struttura, meccanismo di azione, spettro antimicrobico, via di somministrazione.
- 39) Inibitori suicidi (acido clavulanico, sulbactam e tazobactam). Strutture, meccanismo di azione ed associazioni.
- 40) Antibiotici peptidici: descrivere la struttura generale, impiego terapeutico, meccanismo e spettro di azione della Daptomicina, Vancomicina e Teicoplanina.
- 41) Farmaci antilebbra. Disegnare le strutture dei farmaci principali, associazioni, meccanismo di azione, protocollo terapeutico.
- 42) Macrolidi: descrivere la struttura generale, impiego terapeutico e meccanismo di azione. Partendo dall'eritromicina descrivere le molecole metabolicamente stabili a pH gastrico ed i relativi nomi. Instabilità in ambiente gastrico dell'eritromicina. Eritromicina, claritromicina,azitromicina.
- 43) Macrolidi: descrivere la struttura generale dei macrolidi (eritromicina) e ketolidi (telitromicina). Differenze strutturali tra macrolidi e chetolidi. Telitromicina
- 44) Lincosamidi: Lincomicina e clindamicina. Meccanismo di azione. Strptogramine: termini e meccanismo di azione.
- 45) Amminoglicosidici: struttura generale, descrizione componenti (amminociclitoli ed amminozuccheri). Descrizioni amminociclitoli. Gentamicina: componenti, impiego terapeutico e meccanismo di azione. Tobramicina.
- 46) Descrivere la struttura generale delle Rifamicine o ansamicine. Struttura Rifamicine più importanti (B, S e SV) e della rifampicina (solo anello naftofuranonico con i relativi sostituenti).
- 47) Rifampicina e relativi derivati (rifapentina, rifabutina, rifalazil). Struttura del solo anello naftofuranonico con i relativi sostituenti, impiego terapeutico, meccanismo di azione
- 48) Idrazide dell'acido isonicotinico. Sintesi, metabolismo, meccanismo di azione, impiego terapeutico.
- 49) Etambutolo e pirazinamide. Strutture, uso terapeutico, meccanismo di azione.

- 50) Composti naturali a struttura chinolinica usati per la terapia della malaria. Scrivere le strutture, descrizione dei componenti, indicare i centri di asimmetria delle molecole. Descrivere il meccanismo di azione
- 51) Chinina e Meflochina. Scrivere le strutture, commentare le differenze strutturali. Meccanismo di azione dei composti ed impiego terapeutico.
- 52) Derivati 4-ed 8-ammino chinolinici usati come antimalarici. Disegnare le strutture principali, e commentare il meccanismo di azione. Cloroquina, amodiachina, idrossicloroquina, primachina.
- 53) Inibitori della diidrofolato reductasi agenti sul plasmodio della malaria. Strutture ed associazioni. Pirimetamina, proguanil e cicloguanil. Malarone, Fansidar.
- 54) Artemisine: impiego terapeutico, descrizione struttura chimica generale, derivati naturali e di semisintesi. Associazioni e meccanismo azione. Artemisinina, diidroartemisinina, artemetere ed artesunato.
- 55) Lumefantrina ed atovaquone. Meccanismo di azione dei farmaci, impiego terapeutico, associazioni.
- 56) Antibiotici naturali ad azione antifungina. Struttura generale, meccanismo di azione ed impiego terapeutico degli antibiotici a struttura polienica (micosi superficiali o sistemiche). Nistatina ed amfotericina B.
- 57) 5-fluorocitosina: uso terapeutico, meccanismo di azione ed associazioni.
- 58) Griseofulvina: struttura, impiego terapeutico, rapporto struttura-attività.
- 59) Antifungini a struttura imidazolica per uso topico ed orale ed a struttura ossietilimidazolica. Strutture, meccanismo di azione. Clotrimazolo, econazolo, miconazolo e chetoconazolo.
- 60) Antifungini a struttura triazolica, Strutture, meccanismo di azione. Fluconazolo, itraconazolo, voriconazolo e posaconazolo.
- 61) Antifungini a struttura peptidica. Descrivere le strutture generali e le differenze tra i derivati naturali e di semisintesi. Meccanismo di azione. Echinocandine
- 62) Antifungini a struttura morfolinica e allilamminica. Scrivere le strutture e descrivere i meccanismi di azione. Terbinafina ed amorolfina.
- 63) Antivirali a struttura nucleosidica. Scrivere le strutture degli analoghi aciclici analoghi della 2-desossi guanosina (modificati sulla parte zuccherina). Descrivere il meccanismo di azione. Descrivere se attivi su virus a RNA o DNA. Aciclovir, ganciclovir, penciclovir, famciclovir,
- 64) Antivirali a struttura nucleosidica. Scrivere le strutture degli analoghi modificati sulla base purinica o pirimidinica (Idoxuridina, Trifluridina). Descrivere il meccanismo di azione. Indicare se sono attivi contro virus a DNA o RNA.
- 65) Antivirali attivi nei confronti del virus dell'influenza. Struttura amantadina e rimantadina. Descrizione dei target biologici e meccanismi di azione.
- 66) Antivirali attivi nei confronti del virus dell'influenza. Inibitori delle neuraminidasi. Descrizione dei target biologici, Meccanismi di azione. Zanamivir ed Oseltamivir.
- 67) Farmaci attivi nei confronti dei retrovirus. Classificazione, target biologici, meccanismi di azione dei composti più importanti appartenenti alle classi NNRTI ed NRTI. Struttura AZT e meccanismo di azione. Struttura Lamivudina, didanosina, stavudina, adefovir, tenofovir. Nevirapina, efavirenz.
- 68) Farmaci attivi nei confronti dei retrovirus. Meccanismo di azione inibitori proteasi. Struttura stato di transizione tetraedrico e isosteri. Descrivere meccanismo di azione inibitori adesione (CCR5) e fusione (gp41).
- 69) Farmaci attivi nei confronti del HSV (virus herpes simplex) e VZV (virus varicella zoster) e relativi profarmaci. Aciclovir, ganciclovir, penciclovir, famciclovir, cidofovir, adefovir.

- 70) Alchilanti. Mostarde azotate. Disegnare le strutture principali (mecloretamina, clorambucile, ciclofosfamide, spiegare il meccanismo di azione ed il target biologico. Struttura busulfano e tiotepa, meccanismo di azione.
- 71) Antitumorali a struttura triazenica. Dacarbazina e temozolamide. Meccanismo di azione.
- 72) Derivati del platino. Impiego terapeutico, strutture principali, meccanismo di azione. Cis-platino, carboplatino, oxaliplatino.
- 73) N-nitroso uree- Impiego terapeutico, disegnare le strutture dei composti principali (carmustina), meccanismo di azione.
- 74) Antimetaboliti. Antagonisti della DHFR (diidrofollato-reduttasi), strutture principali, struttura acido folico. Metotrexato, pemetrexed e raltitrexed
- 75) Antimetaboliti. Analoghi delle basi pirimidiniche. Struttura 5-fluorouracile, meccanismo di azione. Struttura dell'ARA-C (citarabina), gemcitabina, azacitidina.
- 76) Antimetaboliti analoghi delle purine. Struttura 6-mercaptopurina e tioguanosina, meccanismo di azione e bersagli biologici.
- 77) Farmaci intercalanti: meccanismo di azione. Bleomicina: descrizione struttura e meccanismo di azione.
- 78) Inibitori delle topoisomerasi I e II quali farmaci tumorali. Descrivere i composti naturali e derivati di semisintesi. Irinoteca, topotecan, dactinomina
- 79) Inibitori topoisomerasi II: Antracicline, mitoxantrone, etoposide e teniposide.
- 80) Farmaci agenti sul fuso mitotico. Composti naturali e di semisintesi agenti sui processi di polimerizzazione e depolimerizzazione della tubulina.
- 81) Strutture chimiche androgeni naturali. Profarmaci ed impiego terapeutico. Modifiche effettuate per aumentare la stabilità metabolica (profarmaci testosterone, mesterolone, metiltestosterone).
- 82) Strutture ormoni ad attività anabolizzante derivanti dal testosterone (ossimetolone, ossandrolone, stanazololo).
- 83) Farmaci usati per il tumore della prostata. Strutture chimiche dei principali antagonisti degli androgeni a struttura steroidea (ciproterone) e non-steroidea (bicalutamide). Inibitori della 5-alfa-reduttasi (finasteride).
- 84) Antibiotici caratterizzati da un macrociclo lattonico. Descrizione strutture, impiego terapeutico, meccanismo di azione.
- 85) Strutture chimiche degli estrogeni di origine naturali e relativi profarmaci. Derivati semisintetici dell'estradiolo. Estraderm.
- 86) Farmaci usati per la cura del tumore al seno dipendente dagli estrogeni. Strutture chimiche dei composti più rappresentativi appartenenti agli antagonisti "impeded", antagonisti trifenilmetilenici (tamossifene, ralossifene, fulvestrant) ed inibitori dell'aromatasi (exemestano, anastrozolo e letrozolo).
- 87) Strutture chimiche dei mineralcorticoidi e glicocorticoidi naturali. Profarmaci glicocorticoidi naturali, meccanismo di azione, impiego terapeutico
- 88) Strutture chimiche dei derivati di semisintesi dei glicocorticoidi naturali. Composti derivanti dall'insaturazione in posizione 1-2, dall'introduzione di un sostituito in 6-alfa e 9-alfa.
- 89) Derivati del cortisone ed idrocortisone modificati in posizione 16 con un gruppo ossidrilico o metilico. Rapporto struttura attività nei glicocorticoidi. Modifiche effettuate per aumentare la stabilità metabolica. Ormoni Glicocorticoidi: naturali, prednisone, prednisolone, triamcinolone, desametasone, betametasone, beclometasone, aclometasone, clobetasone, clobetasolo. Meccanismo d'azione, modifiche strutturali.

- 90) Struttura del Progesterone e suoi derivati sostituiti in posizione 17. Derivati progestinici derivanti dal testosterone e 19-nor testosterone (scrivere le strutture di alcuni esempi). Idrossiprogesterone acetato, medrossiprogesterone acetato,
- 91) Derivati del 19-nor testosterone usati come contraccettivi. Descrivere i vari tipi di pillola anticoncezionale. Riportare le strutture chimiche dei progestinici più rappresentativi presenti nella pillola anticoncezionale (Noretinodrel, norgestrel, noetisterone, etinodiolo, Levonorgestrel, Gestodene, desogestrel, profarmaci del Levonorgestrel).
- 92) Drospiridone e Mifepristone.
- 93) Glicosidi cardioattivi. Meccanismo di azione, struttura generale glicosidi digitalici. Preparazione della Digitossina e Digossina via degradazione del lanatoside A e C. Struttura Digitossigenina e Digossigenina.
- 94) Diuretici osmotici (mannitolo) ed agenti come inibitori dell'anidasi carbonica. Struttura acetazolamide, meccanismo di azione. Dorzolamide e brinzolamide.
- 95) Diuretici a struttura benzotiadiazinica e chinazonica. Meccanismo di azione. Struttura metolazone, clorotiazide, idroclorotiazide, clortalidone.
- 96) Diuretici dell'ansa. Struttura e meccanismo di azione della furosemide, torasemide e acido etacrinico
- 97) Diuretici risparmiatori di potassio. Strutture amiloride, spronolattone, canrenone ed eplerenone. Meccanismo di azione.
- 98) Ormoni mineralcorticoidi: struttura termine naturale, agonista (Fludrocortisone) e antagonisti del recettore per i mineralcorticoidi. Impiego terapeutico e meccanismo di azione.
- 99) Glucocorticoidi per via intranasale e inalatoria.
- 100) Formulazioni insulina: rapida, breve, intermedia (isofano NPH), ultralenta
- 101) Sulfaniluree di prima e seconda generazione. Descrivere il meccanismo di azione. Tolbutamide, clorpropamide. Glibenclamide. Impiego terapeutico
- 102) Biguanidi e tiazolidindioni. Struttura metformina e rosiglitazone. Meccanismo di azione. Impiego terapeutico.
- 103) Acarbosio, miglitolo e : descrivere la struttura, meccanismo di azione ed uso terapeutico
- 104) Incretine. Importanza ed approccio terapeutico sul sistema incretinico. Analoghi GLP-1 (exenatide e liraglutide) ed inibitori DPP-4 (Sitagliptina e Vildagliptina) .
- 105) Struttura generale delle prostaglandine, prostacicle, trombossani e leucotrieni. Struttura generale PGA, PGB, PGC, PGD, PGE e PGF. Struttura PGE2 e PGF2 α . Spiegare la nomenclatura della PGF2 α .
- 106) Biosintesi PGF2 e prostacicline a partire dall'acido arachidonico.
- 107) Struttura PGE2, PGE1, PGF2 α , metabolizzazione ed analoghi metabolicamente stabili (Misoprostolo, Gemeprost, e Carboprost). Effetti biologici della PGE2 e PGF2. Meccanismo di azione prostaglandine e loro ruolo fisiologico. Epoprostenolo, Iloprost,