

# Caratteristiche dei farmaci

- **Natura fisica**
  - Solidi, liquidi o gassosi → via di somministrazione
  - Composti organici: carboidrati, proteine, lipidi, acidi nucleici
  - Composti inorganici: Li, Fe, metalli pesanti
- **Dimensione**: PM tra 100 – 1000
- **Reattività e legami farmaco-recettore**
  - Legami covalenti
  - Legami elettrostatici: ionici, legami a idrogeno, dipolo, van der Waals
  - Legami idrofobici
- **Conformazione**
  - Chiralità → enantiomeri → interazione con recettore, metabolismo, trasporto

# Denominazione comune internazionale dei farmaci (DCI)

- Nome di fantasia – marchio registrato
- *International Non Proprietary Name* (INN)
  - Universale
  - Svincolato da dinamiche commerciali
  - Radice o parte convenzionale
    - Suffisso –prazolo
    - Iniziale es –
    - Sillaba – gli -
- Codice ATC (anatomico – terapeutico – chimico)

# L'esempio di apremilast

- Suffisso **-ast** come antiasmatici (monteluk**ast**)
- Infisso **-mi-** come inibitori fosfodiesterasi IV (roflum**il**ast, antiasmatico)
- Ma apremilast è approvato come farmaco per la psoriasi!

# INN per anticorpi monoclonali

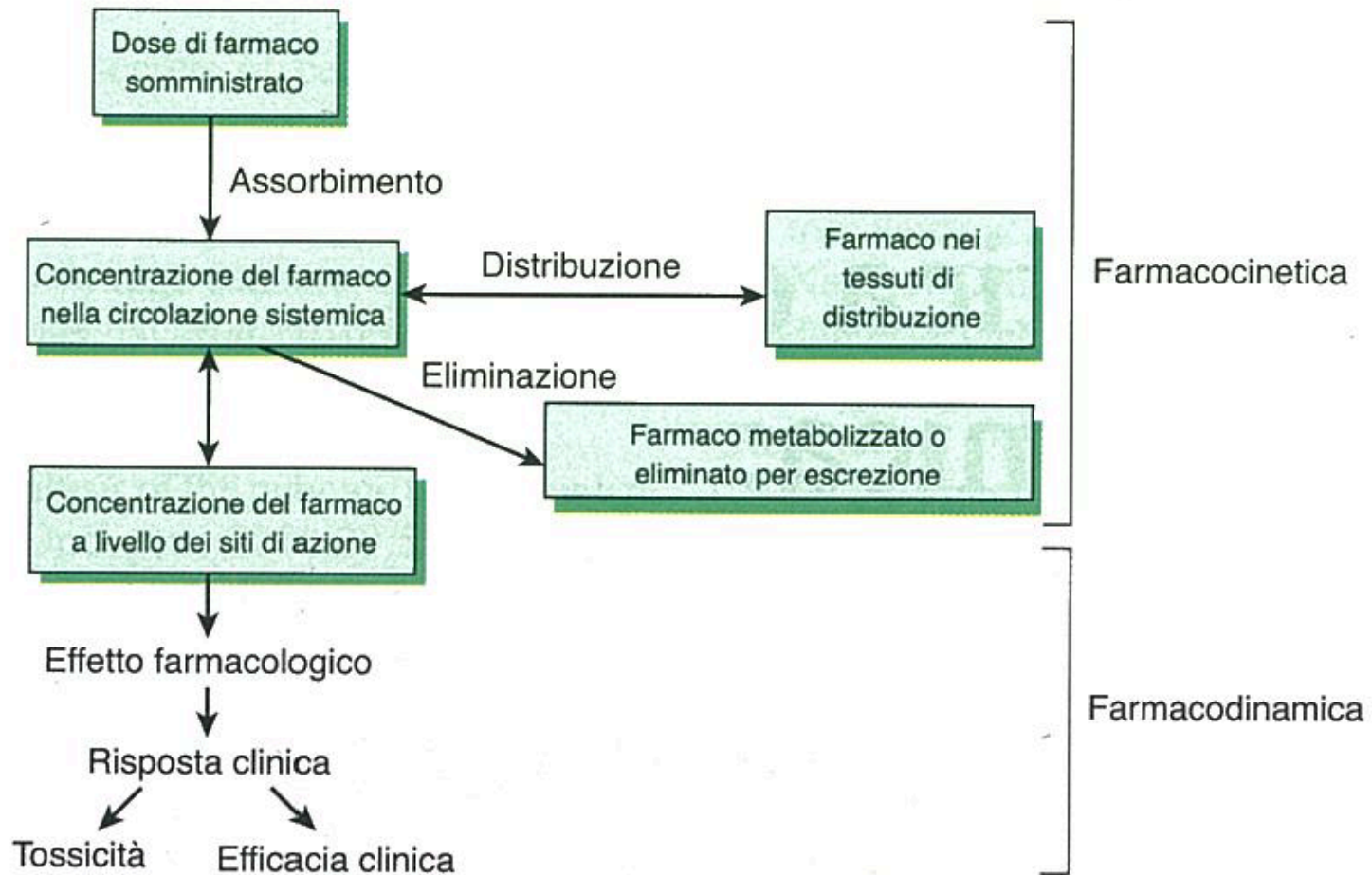
Tipo	Suffisso	% proteine murine	Esempi
Murino	omab	100	Blinatumomab, solitomab
Chimerico	ximab	25	Abciximab, basiliximab, cetuximab, infliximab, rituximab
Umanizzato	zumab	5 - 10	Bevacizumab, efalizumab, omalizumab, ranibizumab, trastuzumab
Umano	umab	0	Adalimumab, belimumab, denosumab, ipilimumab, nivolumab, ofatumumab, secukinumab

# Classificazione ATC

- Distingue i farmaci in categorie di vario livello:
  - Primo livello: Anatomico → Lettera
    - N-Sistema nervoso
  - Secondo livello: Terapeutico → Numero due cifre
    - N06-Psicostimolanti
  - Terzo livello: Terapeutico → Lettera
    - N06A-Antidepressivi
  - Quarto livello: Terapeutico → Lettera
    - N06AA-Inibitori non selettivi della ricaptazione delle monoamine
  - Quinto livello: Chimico → Numero due cifre
    - N06AA04-Clomipramina

# Dose somministrata – concentrazione plasmatica – effetto farmacologico

- Relazione dose – effetto



# Farmacocinetica

-processi successivi alla somministrazione-

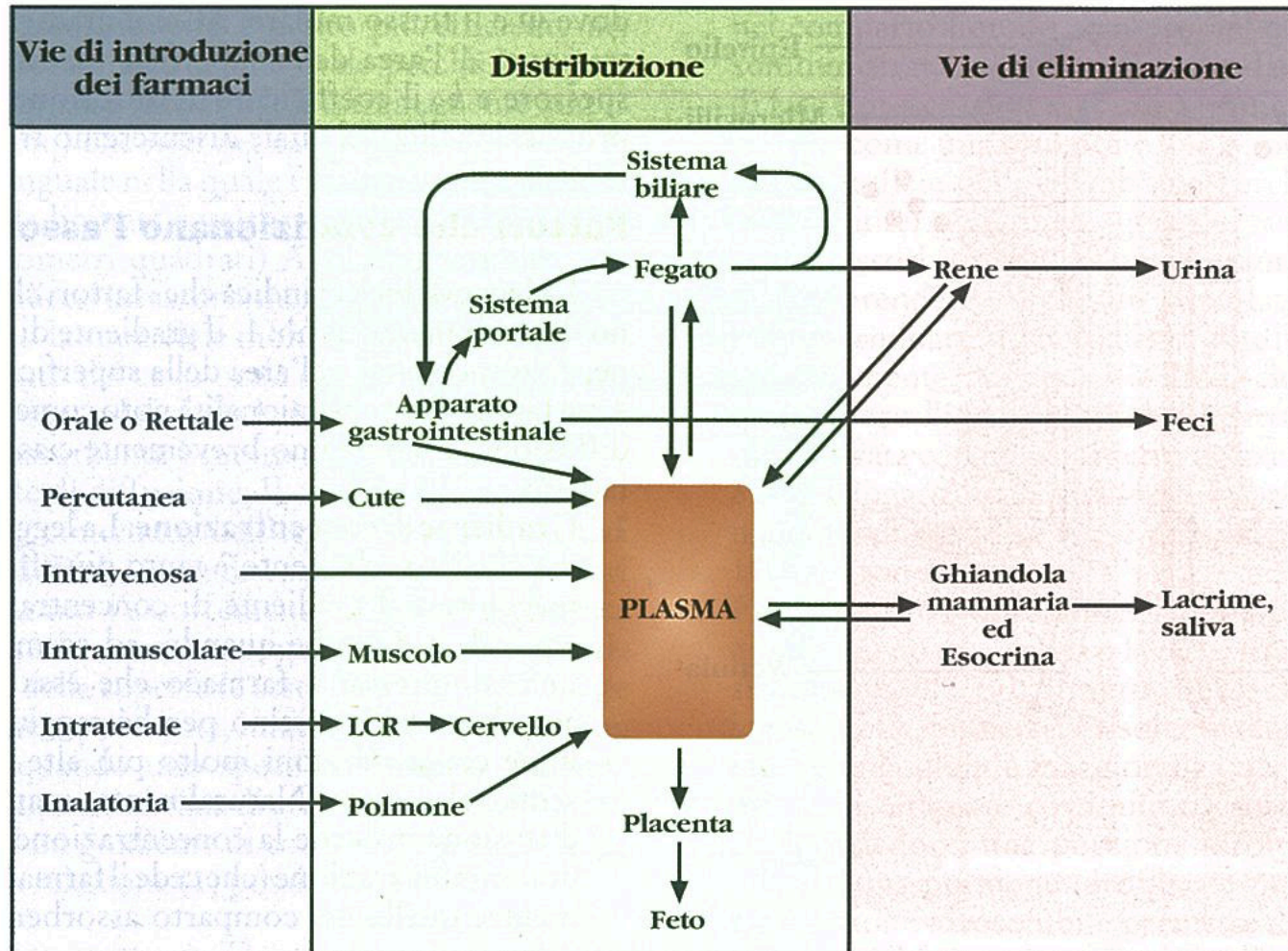


Figura 1.1. Le tappe della farmacocinetica.

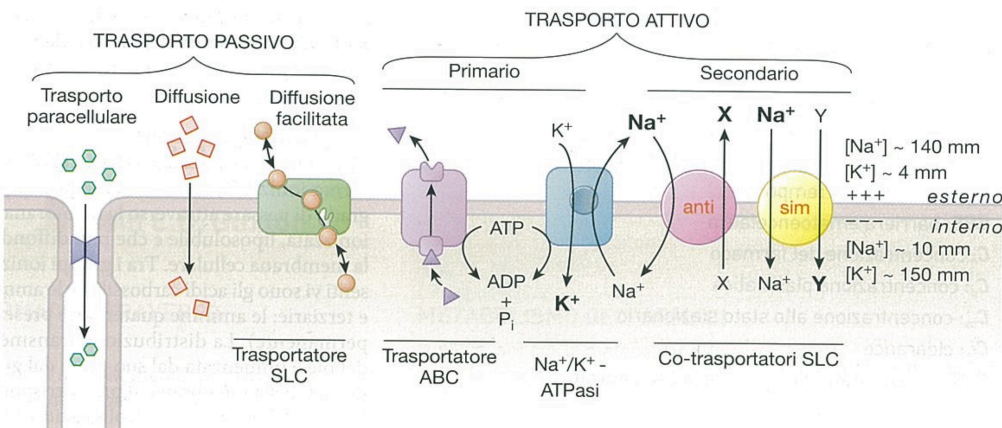
# Parametri farmacocinetici

- Parametri farmacocinetici per **stabilire**:
  - Intervallo delle concentrazioni terapeutiche;
  - L'indice terapeutico (dose tossica/dose efficace);
  - Massima dose tollerabile.
- Parametri farmacocinetici per **identificare** i fattori:
  - Fisiologici;
  - Genetici;
  - Patologici;
  - Ambientali.
- Monitoraggio terapeutico → ottimizzazione del trattamento farmacologico

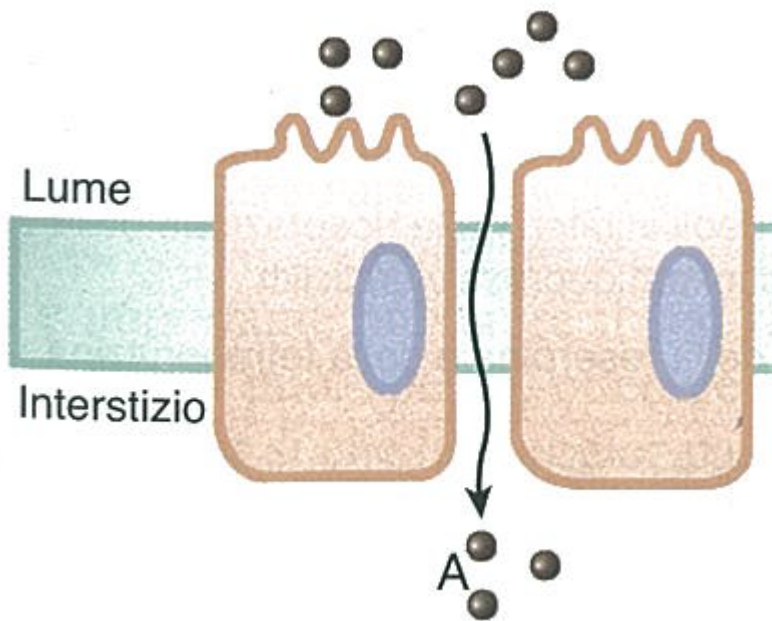


# Passaggio attraverso le membrane

- Diffusione passiva
  - Attraverso i canali acquosi
  - Attraverso membrane lipidiche
- Diffusione facilitata
- Trasporto attivo
- Endocitosi
- Grandezza e forma della molecola;
- Solubilità nel sito di assorbimento;
- Grado di ionizzazione;
- Liposolubilità relativa delle forme ionizzata e non-ionizzata

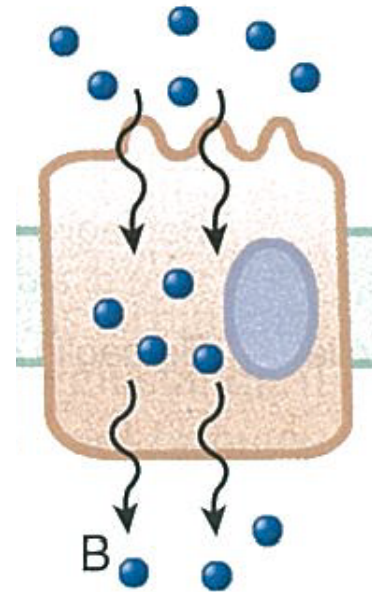


# Diffusione passiva attraverso i canali acquosi



- Attraverso giunzioni serrate di epitelii ed endoteli
- Regolata da gradiente concentrazione
- Farmaci legati a proteine plasmatiche di grandi dimensioni (es. albumina) non passano

# Diffusione passiva attraverso membrane lipidiche



- Regolata da gradiente di concentrazione
- Proporzionale al coefficiente di partizione lipidi/acqua
- Per farmaci < 1000 Dalton
- Descritto dalla Legge di Fick

Legge di Fick:

$$\text{Flusso} = \frac{(C1-C2) \times A \times C_p}{S}$$

$$C1 > C2$$

A = Area

C<sub>p</sub> = coefficiente di permeazione

S = spessore