Ministerio de Cultura y Educación
Universidad Nacional de San Luis
Facultad de Química Bioquímica y Farmacia
Departamento: Farmacia
Area: Farmacognosia

(Programa del año 2012)
(Programa en trámite de aprobación)
(Presentado el 08/11/2012 11:07:12)

I - Oferta Académica

Materia	Carrera	Plan	Año	Período
QUIMICA MEDICINAL	FARMACIA	4/04	2012	1° cuatrimestre

II - Equipo Docente

Docente	Función	Cargo	Dedicación
ENRIZ, RICARDO DANIEL	Prof. Responsable	P.Tit. Exc	40 Hs
CEÑAL, JUAN PEDRO JOSE	Prof. Colaborador	P.Adj Exc	40 Hs
JUAREZ, AMERICO OSVALDO	Prof. Colaborador	P.Asoc Exc	40 Hs
SOSA, ANGELA	Prof. Colaborador	P.Asoc Exc	40 Hs
SUVIRE, FERNANDO DANIEL	Prof. Co-Responsable	P.Asoc Exc	40 Hs
GARRO, ADRIANA DEOLINDA	Auxiliar de Laboratorio	A.1ra Semi	20 Hs
MARTINEZ, NOELIA ANABEL	Auxiliar de Laboratorio	A.2da Simp	10 Hs

III - Características del Curso

Credito Horario Semanal				
Teórico/Práctico	**Teóricas**	**Prácticas de Aula**	**Práct. de lab/ camp/ Resid/ PIP, etc.**	**Total**
0 Hs	6 Hs	0 Hs	3 Hs	9 Hs

Tipificación	Periodo
B - Teoria con prácticas de aula y laboratorio	1º Cuatrimestre

Duración			
Desde	**Hasta**	**Cantidad de Semanas**	**Cantidad de Horas**
19/03/2012	21/06/2012	15	100

IV - Fundamentación

FUNDAMENTACION: El extraordinario avance que tiene la Industria Farmacéutica en el descubrimiento y desarrollo de fármacos demanda que los profesionales farmacéuticos posean los conocimientos teóricos y además una práctica, al menos, mínima en las distintas temáticas de la Química Medicinal, para que puedan incorporarse en industrias de éste tipo. La formación del profesional farmacéutico en este tipo de disciplina es indispensable también para su desempeño tanto en áreas de la Farmacia Clínica, como de Farmacia Hospitalaria y Oficina de Farmacia.
Se pretende que este curso tenga una dimensión operativa, es decir, que los futuros farmacéuticos adquieran fundamentos, tácticas, métodos, bibliografía, etc., concretos para que puedan ser utilizados en su futura actividad.
De esta faz operativa del curso nace la idea de la ejecución de un trabajo final con características de ensayo, paralelo y complementario con el desarrollo de la asignatura. Dicho ensayo, intenta ser un medio propicio para la reflexión e integración de conocimientos adquiridos durante el curso de la asignatura y en otras relacionadas con ella, aplicados a un problema concreto de interés en Química Medicinal.

V - Objetivos / Resultados de Aprendizaje

- OBJETIVOS:

En el plano del conocimiento:
1. Que los alumnos adquieran una consistente formación en los distintos aspectos que conforman la Química Medicinal.
2. Que los alumnos adquieran herramientas teórico-prácticas tales que le permitan un eficiente desenvolvimiento en su futura carrera profesional.
3. Que los alumnos sean capaces de plantear y analizar posibles situaciones con sus correspondientes soluciones y adquieran además la capacidad de extrapolación a problemas que se les puedan presentar en su carrera profesional.
En el plano actitudinal:
1. Fomentar la racionalidad com punto de partida de cualquier cuestionamiento.
2. Fomentar la capacidad crítica para la consideración de problemas de la profesión farmacéutica, en general, y de problemas de Química Medicinal en particular.

VI - Contenidos

PROGRAMA ANALITICO

TEMA 1 – ASPECTOS GENERALES DE LA QUIMICA MEDICINAL.
Química Medicinal, definiciones y objetivos. Estado actual de la disciplina y su relación con otros campos de la Química y la Biología. El descubrimiento de nuevas drogas. El legado del pasado: Aproximaciones presentes y posibilidades futuras. La Fase Farmacéutica, la Fase Farmacocinética y Farmacodinámica de una droga.

TEMA 2 – MECANISMO MOLECULAR DE LA ACCION DE DROGAS Y ESTRATEGIAS PARA EL DESCUBRIMIENTO DE COMPUESTOS LIDERES.
Principales blancos de las drogas. Distintos mecanismos de acción. Inducción a la respuesta de una droga. Receptores como blancos principales de la acción de drogas. Conceptos generales sobre Teoría de Receptores. Estrategia para la búsqueda de nuevos compuestos líderes. Perfeccionamiento de drogas existentes. Búsqueda sistemática. Utilización de información biológica. Búsqueda planeada y racional. Los productos naturales utilizados como fármacos y como base para el desarrollo de nuevos líderes. Ejemplos.

TEMA 3 – LA MODIFICACION MOLECULAR COMO METODO DE BUSQUEDA DE NUEVOS FARMACOS.
Modalidades del procedimiento de modificación molecular. Variación molecular en series homólogas: vinílogos, benzólogos. Variaciones moleculares basadas en reemplazos isostéricos. Transformaciones de anillos. Aproximación del análogo. Aproximación disyuntiva (simplificación molecular). Aproximación conjuntiva (complejación molecular). Drogas gemelas idénticas y no idénticas. Drogas gemelas no idénticas de actividad dual. Estrategias generales para un primer estudio de la relación Estructura Química - Actividad (SAR). Reglas de aplicación.

TEMA 4 – ASPECTOS CUALITATIVOS Y CUANTITATIVOS DE LA RELACION ESTRUCTURA - ACTIVIDAD.
Efectos del reemplazo de sustituyentes. Efectos en la solubilidad. Efectos conformacionales. Efectos electrónicos. Efectos sobre el metabolismo. El rol de los grupos funcionales en las interacciones droga receptor. Fuerzas intermoleculares que operan en las interacciones fármaco receptor. Conceptos generales para entender el estudio de la relación Estructura Química - Actividad en forma cuantitativa (QSAR). Diseño de drogas asistido por computadoras (Modelización Molecular).

TEMA 5 – ASPECTOS ESTEREOQUÍMICOS DE LA ACCION DE DROGAS.
Restricción conformacional e impedimento estérico. Aplicación a ligandos pequeños y a péptidos. ¿Cuándo se constituye la Conformación Bioactiva? Colapso hidrofóbico. La importancia del isomerismo óptico en el diseño de fármacos. Aspectos farmacocinéticos y legales.

TEMA 6 – MODIFICACIONES QUIMICAS QUE INFLUENCIAN LAS PROPIEDADES FARMACOCINETICAS DE LAS DROGAS.
Pasaje de drogas a través de membranas. Procesos pasivos y mediados por transportadores Absorción según la vía de administración. Biodisponibilidad. Distribución y eliminación de drogas Prodrogas y bioprecursores. Aplicaciones prácticas de prodrogas. Bioprecursores, el concepto de metabolito activo y su aplicación prospectiva. Transportadores macromolecula-

res para alcanzar el sitio de acción.

TEMA 7 – PROBLEMAS PARA LA FORMULACION QUIMICA Y FARMACEUTICA.
Preparación de compuestos solubles en agua. Estrategia de solubilización. Solubilización de drogas con solventes orgánicos. Soluciones químicas y fisicoquímicas a problemas de formulación. El problema de las formas cristalinas mesomórficas. Cambios en la formulación para evitar efectos no deseados. Irritación gastrointestinal. Inyecciones dolorosas. Eliminación de propiedades organolépticas no deseadas.

TEMA 8 – ASPECTOS ECONOMICOS Y LEGALES DEL DESARROLLO DE NUEVAS DROGAS.
Del descubrimiento a la factibilidad del mercado. Elementos presentes en el desarrollo. Estudios Preclínicos y Clínicos. Desarrollo farmacéutico industrial y médico económico. El consumo y producción de fármacos. Las drogas más utilizadas. Factores sociales y económicos. El futuro de la industria farmacéutica.

TEMA 9.- COMPUESTOS DE INTERES I.
Fármacos antifúngicos utilizados actualmente. Mecanismos de acción. Problemas por falta de especificidad. La necesidad de desarrollar nuevos agentes. Potenciales target. Moléculas de adhesión celular. Familias. Receptores y ligandos. Mecanismo de acción. Potenciales aplicaciones terapéuticas.

TEMA 10 – COMPUESTOS INHIBIDORES DE LA SECRECION GASTRICA
Las úlceras péptidas: definición, causas, tratamiento. Liberación del ácido gástrico. Antagonistas H2 Histamina y receptores histamínicos. N-Guanilhistamina. Teoria de quelación, Burinamida, Metiamida, Cimetidina: Actividad Biológica, Relación Estructura-Actividad. Metabolismo. Isómeros conformacionales. Desolvatación. El grupo nitroceteneaminal. Ranitidina, Famotidina y nizatidina. Comparación de antagonistas H1 y H2 Inhibidores de la Bomba de Protones. Las células parietales y la bomba de protones. Mecanismo de inhibición. Metabolismo de los IBPs. Diseño de omeprazol y esomeprazol. Helicobacter pilori y el uso de agentes antibacteriamos. Tratamiento.

TEMA 11 – COMPUESTOS DE INTERES III.
Quimioprevención del cáncer. Principales agentes. Mecanismo de acción. Quimioterapia del cáncer. Principales familias de drogas quimioterapéuticas. Nuevas medicinas genéticas. Concepto de drogas inductoras de tríplices y drogas antisentido. Interferones. Concepto. Tipos de interferones. Efectos terapéuticos de los interferones.

TEMA 12 – CONCEPTOS GENERALES SOBRE SINTESIS ORGANICA.
Síntesis lineales y convergentes, rendimientos. Planificación de una síntesis orgánica: concepto de retrosíntesis. Sintones y equivalentes sintéticos. Manejo de grupos protectores.

TEMA 13 – EJEMPLOS DE REACCIONES EN QUIMICA ORGANICA.
Alquilaciones: enolatos, control cinético y termodinámico. Ejemplos de homólogos y enolatos: enaminas. Reacciones de carbonos nucleofílicos con grupos carbonilo: carbaniones estabilizados. Condensación aldólica y reacciones relacionadas como ejemplo retrosintético. Concepto de síntesis quiral. Reacciones diasteroselectivas y enatioselectivas. Síntesis de fármacos.

VII - Plan de Trabajos Prácticos

PROGRAMA DE TRABAJOS PRACTICOS

Trabajo Práctico Nº 1: INTERACCIONES DROGAS-RECEPTOR
Trabajo Práctico Nº 2: DESCUBRIMIENTO DE DROGAS. DISEÑO Y DESARROLLO
Trabajo Práctico Nº 3: MODIFICACION MOLECULAR.
Trabajo Práctico Nº 4: PROFARMACOS.
Trabajo Práctico Nº 5: TOXICIDAD AGUDA
Trabajo Práctico Nº 6: SINTESIS DE ACIDO BARBITURICO.
Trabajo Práctico Nº 7: SINTESIS DE BIGNELLI. APROXIMACIÓN DE REACCIONES MULTICOMPONENTES EN UN SOLO PASO

VIII - Regimen de Aprobación

Sistema de Evaluación:

Para alumnos regulares:

El alumno conocerá con anticipación el trabajo práctico a realizar, el cual será indicado con antelación en el avisador de la cátedra, por lo que se recomienda al alumno leer periodicamente la cartelera.

El alumno deberá concurrir a realizar el TP con un mínimo de conocimientos, tanto del apoyo teórico como de las actividades prácticas a realizar. Para ello el alumno será evaluado, previo al trabajo práctico con una examinación escrita.

Para ser considerado alumno regular se deberá aprobar el 100% de los trabajos prácticos programados. El alumno deberá aprobar, al menos el 75% de los TP en una 1º instancia y el resto deberá aprobarlo en una 2º instancia de recuperación.

La evaluación de los conocimientos adquiridos se llevará a cabo mediante 3 examinaciones parciales, que se tomarán después de finalizado cada tema.

Tendrán derecho a una recuperación por parcial en 1º instancia y solo uno de ellos podrá ser recuperado en 2º instancia. De acuerdo Ord.13.

La aprobación de la asignatura se realizará mediante una examinación final oral que versará sobre los contenidos adquiridos tanto de TP como teóricos. La misma se llevará a cabo en los turnos de exámenes previamente fijados por las autoridades universitarias.

IX - Bibliografía Básica

[1] BIBLIOGRAFIA

[2] 1. Wermuth, C.G. The Practice of Medicinal Chemistry. Academic Press, 1996.

[3] 2. Siwerman, R.B. The Organic Chemistry of Drug Design. Academic Press, 1992.

[4] 3. Avendaño, C. Introducción a la Química Farmacéutica. Mc Graw Hill. Interamericana de España. Primera edición (Segunda reimpresión, 1994).

[5] 4. Ganellin, C.R. and Roberts, S.M. Medicinal Chemistry. Academic Press, 1981.

[6] 5. Goodman & Gilman;. Rall T.W.; Nies, A.S.; Taylor, P.; The Pharmacologic Basis of Therapeutics. Novena edición. Pergamon 1997.

[7] 6. Green, T. Protective Groups in Organic Synthesis. Wiley – Interscience, 1981.

[8] 7. Warren, S. Organic Synthesis: The disconnection Approach. John Wiley & Sons, 1982.

X - Bibliografia Complementaria

XI - Resumen de Objetivos

- OBJETIVOS:

En el plano del conocimiento:

1. Que los alumnos adquieran una consistente formación en los distintos aspectos que conforman la Química Medicinal.
2. Que los alumnos adquieran herramientas teórico-prácticas tales que le permitan un eficiente desenvolvimiento en su futura carrera profesional.
3. Que los alumnos sean capaces de plantear y analizar posibles situaciones con sus correspondientes soluciones y adquieran además la capacidad de extrapolación a problemas que se les puedan presentar en su carrera profesional.

En el plano actitudinal:

1. Fomentar la racionalidad com punto de partida de cualquier cuestionamiento.
2. Fomentar la capacidad crítica para la consideración de problemas de la profesión farmacéutica, en general, y de problemas de Química Medicinal en particular.

XII - Resumen del Programa

TEMA 1 – ASPECTOS GENERALES DE LA QUIMICA MEDICINAL.

TEMA 2 – MECANISMO MOLECULAR DE LA ACCION DE DROGAS Y ESTRATEGIAS PARA EL DESCUBRIMIENTO DE COMPUESTOS LIDERES.

TEMA 3 – LA MODIFICACION MOLECULAR COMO METODO DE BUSQUEDA DE NUEVOS FARMACOS.

TEMA 4 – ASPECTOS CUALITATIVOS Y CUANTITATIVOS DE LA RELACION ESTRUCTURA - ACTIVIDAD

TEMA 5 – ASPECTOS ESTEREOQUÍMICOS DE LA ACCION DE DROGAS.

TEMA 6 – MODIFICACIONES QUIMICAS QUE INFLUENCIAN LAS PROPIEDADES FARMACOCINETICAS DE LAS DROGAS.

TEMA 7 – PROBLEMAS PARA LA FORMULACION QUIMICA Y FARMACEUTICA.

TEMA 8 – ASPECTOS ECONOMICOS Y LEGALES DEL DESARROLLO DE NUEVAS DROGAS.

TEMA 9.- COMPUESTOS DE INTERES I.
Fármacos antifúngicos utilizados actualmente.

TEMA 10 – COMPUESTOS INHIBIDORES DE LA SECRECION GASTRICA

TEMA 11 – COMPUESTOS DE INTERES III.
Quimioprevención del cáncer. Principales agentes.

TEMA 12 – CONCEPTOS GENERALES SOBRE SINTESIS ORGANICA.

TEMA 13 – EJEMPLOS DE REACCIONES EN QUIMICA ORGANICA.

XIII - Imprevistos

XIV - Otros

ELEVACIÓN y APROBACIÓN DE ESTE PROGRAMA	
	Profesor Responsable
Firma:	
Aclaración:	
Fecha:	