

Muscia, Gisela Celeste

Química farmacéutica

Carrera de Farmacia

Programa anual 2022

Cita sugerida: Muscia GC. Química farmacéutica [programas] [internet]. [Buenos Aires]: Instituto Universitario Hospital Italiano de Buenos Aires. Carrera de Farmacia; 2022 [citado AAAA MM DD]. Disponible en: <https://trovare.hospitalitaliano.org.ar/descargas/planes/20231113110424/programa-quimica-farmaceutica-2022.pdf>

Este documento integra la colección Planes de Estudio y Programas de Trovare Repositorio del Institucional del Instituto Universitario Hospital Italiano de Buenos Aires y del Hospital Italiano de Buenos Aires. Su utilización debe ser acompañada por la cita bibliográfica con reconocimiento de la fuente.

Para más información visite el sitio <http://trovare.hospitalitaliano.org.ar/>





Carrera: Farmacia

Materia: **Química farmacéutica**

Año: 2022

1. **Año de la carrera:** 3º
2. **Duración:** Anual
3. **Carga horaria total:** 228 hs.
 - a. **Carga horaria teórica total:** 127 hs.
 - b. **Carga horaria práctica total:** 101 hs.
 - i. **Carga horaria práctica de P1:** 86 hs.
 - ii. **Carga horaria práctica de P2:** 15 hs.
 - iii. **Carga horaria práctica de P3:** 0 horas
 - c. **Carga horaria total virtual:** 228 hs. (100%)
4. **Carga horaria semanal:** 6 hs. (modalidad virtual)
5. **Equipo docente:**

Cargo	Nombre y apellido
Prof. Asociada a cargo	Gisela Celeste Muscia

6. **Objetivos:**

- Reconocer la importancia de la Química Farmacéutica en la formación del Graduado en Farmacia.
- Aplicar los conceptos adquiridos en el curso de Química Orgánica a la Síntesis de fármacos.
- Conocer el fundamento del análisis retrosintético, las desconexiones más importantes y su aplicación para el diseño de métodos de preparación de compuestos moderadamente complejos a partir de otros más sencillos.
- Reconocer la importancia de la estereoquímica en la actividad farmacológica de los fármacos, así como los métodos de obtención de fármacos enantioméricamente puros.
- Conocer las rutas sintéticas más importantes para la preparación de las principales familias de compuestos con actividad farmacológica.
- Lograr que el estudiante profundice los conceptos involucrados en la materia Química Farmacéutica, desarrolle una actitud crítica y una concepción creativa y de interdisciplinariedad, que sirva como

7. Contenidos:

Unidad 1: Introducción y Fundamentos de la Química Farmacéutica

- Desarrollo histórico de la Química Farmacéutica.
- Conceptos y objetivos.
- Relación con otras disciplinas.
- Clasificación de los fármacos.
- Fases de desarrollo de un fármaco nuevo. Desarrollo de una patente.
- Fármacos Genéricos.

Unidad 2: Propiedades fisicoquímicas y estructurales de los fármacos

- Composición de las membranas biológicas.
- Tipos de transporte a través de las membranas.
- Propiedades fisicoquímicas: solubilidad en agua, grado de ionización, coeficiente de reparto. Reglas de Lipinsky. Fijación de proteínas plasmáticas.
- Estereoquímica de los fármacos: conformación y actividad.
- Enantiómeros: configuración y actividad.

Unidad 3: Mecanismo de acción de los fármacos

- Mecanismos específicos e inespecíficos.
- Conceptos generales de farmacocinética y farmacodinamia.
- Interacción fármaco diana biológica. Tipos de dianas biológicas.
- Proteínas, enzimas y receptores de membrana.
- Concepto de afinidad y actividad intrínseca.

Unidad 4: Metabolismo de los fármacos desde el punto de vista estructural.

- Procesos metabólicos de Fase I: oxidaciones microsómicas, no microsómicas, reducciones, hidrólisis.
- Procesos metabólicos de Fase II: glucuronización, conjugaciones, reacciones de acetilación y metilación.
- Productos del metabolismo: generación de otros activos, generación de productos tóxicos. Modulación del metabolismo del fármaco.
- Diseño de fármacos biorreversibles. Profármacos. Concepto y tipos. Aplicaciones. Profármacos en cascada. Ejemplos. Profármacos ligados a biopolímeros.

- Bioprecusores: por oxidación, reducción y mixtos.
- Fármacos duros y blandos: conceptos y tipos.

Unidad 5: Diseño de fármacos I

- Descubrimiento tradicional y actual de nuevos fármacos.
- Observación de los efectos biológicos de los productos naturales o sintéticos.
- Búsqueda de prototipos cabeza de serie: cribado de productos naturales, cribado sistemático. Muestrotescas.

Uso de fármacos existentes como líderes.

- Síntesis, aislamiento y purificación. Síntesis combinatoria.
- Productos drug like.

Unidad 6: Diseño de fármacos II

- Estrategias de Farmacomodulación. Optimización de prototipos.
- Relación estructura actividad, Aproximación disyuntiva. Identificación de grupos farmacóforos. Variación estructural modulativa. Apertura de anillo. Formación de anillo. Variación del tamaño de anillo.
- Reorganización de anillos. Homología. Vinología. Isomerización. Bioisostería. Ley de Grimm. Otros métodos.
- Peptidomiméticos.

Unidad 7: Diseño de fármacos III

- Diseño de fármacos cuantitativos. QSAR. Definición. Parámetros y relaciones cuantitativas estructura actividad.
- Parámetros electrónicos. Constante de Hammett. Parámetros hidrofóbicos. Coeficiente de reparto y constante de sustituyente. Parámetros estéricos. Diagrama de Craig. Ecuación de Hansch.
- Nuevas tecnologías en el diseño de fármacos. QSAR en 3D. Modelización molecular. Mecánica molecular. Mecánica Cuántica. Difracción por rayos X y resonancia magnética nuclear.

Unidad 8: Fármacos moduladores de acetilcolina

- Neurotransmisores y sinapsis. Procesos bioquímicos.
- Sinapsis colinérgica. Receptores colinérgicos.
- Estructura conformacional de la acetilcolina.
- Fármacos agonistas del receptor muscarínico.
- Fármacos antagonistas del receptor muscarínico.
- Fármacos antagonistas del receptor nicotínico.
- Fármacos inhibidores de la enzima acetilcolinesterasa.

Unidad 9: Fármacos moduladores de las aminas biógenas

- Procesos bioquímicos relacionados a noradrenalina y dopamina.
- Fármacos relacionados a la biosíntesis, almacenamiento y liberación.
- Fármacos moduladores de la recaptación y del metabolismo noradrenérgico. Inhibidores de la MAO y COMT.
- Tipos de receptores adrenérgicos. Fármacos agonistas y antagonistas.
- Análisis conformacionales de la dopamina.
- Agonistas y antagonistas dopaminérgicos. Antiparkinsonianos. Neurolépticos tricíclicos. Butirofenonas y análogos.

Unidad 10: Fármacos moduladores de la serotonina

- Procesos bioquímicos relacionados a biosíntesis, almacenamiento y recaptación de serotonina.
- Fármacos inhibidores de la biosíntesis.
- Fármacos inhibidores de la liberación.
- Fármacos inhibidores de la recaptación.
- Tipos de receptores. Fármacos agonistas directos y fármacos antagonistas.

Unidad 11: Fármacos moduladores de los aminoácidos neurotransmisores

- Procesos bioquímicos relacionados a aminoácidos neurotransmisores.
- Aminoácidos excitadores.
- Aminoácidos inhibidores: Ácido gama amino butírico - GABA.
- Moduladores presinápticos.
- Moduladores postsinápticos.
- Benzodiazepinas y barbitúricos.

Unidad 12: Fármacos moduladores de péptidos neurotransmisores

- Encefalinas y endorfinas.
- Receptores analgésicos múltiples.
- Fármacos agonistas y antagonistas.
- Morfina y desarrollo de análogos. Farmacomodulación de la estructura de morfina.
- Análogos de encefalinas.
- Perspectivas de futuro en el diseño de analgésicos opiáceos.
- Antagonistas de receptores opioides periféricos: antidiarreicos.
- Breve revisión de los conceptos dependencia, tolerancia y adicción.

Unidad 13: Fármacos moduladores de la histamina y adenosina

- Biosíntesis y farmacología de la histamina.
- Tipos de receptores.
- Desarrollo de antihistamínicos anti H1.
- Farmacomodulación para la obtención de derivados con otras acciones.
- Desarrollo de anti H1 de segunda generación.
- Enfoque racional en el diseño de un fármaco: cimetidina.
- Desarrollo de fármacos anti H2 antiulcerosos.
- Estereoisomería y nuevos fármacos. Nuevas patentes.

Unidad 14: Fármacos inhibidores enzimáticos relacionados al ácido araquidónico

- Inflamación y dolor. Mecanismo de acción.
- Prostaglandinas y análogos.
- Inhibidores de la ciclooxigenasa.
- Clasificación de los antiinflamatorios no esteroideos AINES.
- Inhibidores selectivos de la ciclooxigenasa 2.
- Análogos de leucotrienos. Antiasmáticos.

Unidad 15: Inhibidores de la biosíntesis de la pared celular bacteriana

- Pared bacteriana, estructura.
- Desarrollo histórico de la penicilina.. Síntesis. Mecanismo de acción.
- Resistencia a penicilinas. Espectro de acción reducido.
- Farmacomodulación de la penicilina.
- Farmacomodulación de las cefalosporinas.
- Nuevos antibióticos beta lactámicos. Monobactamas.
- Inhibidores de beta lactamasas. Ácido clavulánico.
- Otros inhibidores de la biosíntesis de la pared celular bacteriana. Vancomicina.

Unidad 16: Inhibidores de la síntesis proteica bacteriana

- Aminoglucósidos.
- Macrólidos.
- Tetraciclinas.
- Cloranfenicol.

Unidad 17: Inhibidores de la biosíntesis del ácido tetrahidrofólico

- Sulfonamidas. Síntesis y mecanismo de acción.

- Inhibidores de la dihidrofolato reductasa: antineoplásicos.

Unidad 18: Fármacos que actúan sobre los ácidos nucleicos

- Fármacos selectivos sobre el ADN.
- Fármacos selectivos sobre el ARN.
- Antimetabolitos del ácido nucleico.
- Análogos de bases nitrogenadas.
- Análogos de nucleósidos.
- Inhibidores no nucleosídicos de la transcriptasa reversa del virus VIH-1.

8. Metodología de enseñanza:

La materia se desarrollará en modalidad virtual, a excepción de los exámenes que serán presenciales. La cursada estará compuesta por clases teóricas y de resolución de ejercicios. Se dictará en forma anual durante 30 semanas. Se cursará desde las 8 hasta las 14 horas.

Actividades de formación práctica: 80 horas totales

Actividades P1: 68 horas. Resolución de ejercicios de forma de consolidar los conocimientos adquiridos en las clases teóricas. Los alumnos realizarán la resolución de ejercicios de forma individual y luego mediante una puesta en común discutimos los resultados obtenidos.

Actividades P2: 12 horas. Hacia el final de la cursada los alumnos deberán presentar una breve exposición con diapositivas de power point, de un tema elegido por ellos de algunas de las familias químicas de fármacos vistas durante la cursada. Realizarán la búsqueda bibliográfica de un artículo científico. Esta actividad será integradora y permitirá a los alumnos realizar un recorrido transversal de la materia.

9. Evaluación:

Condiciones para mantener la regularidad y modalidad de evaluación:

- Asistencia a las clases teóricas del 75%.
- Los exámenes regulatorios serán evaluados de forma presencial, al igual que la instancia de final.
- Se requiere la aprobación de 4 exámenes de regularidad para ser considerado “alumno regular”. En caso de desaprobar 3 ó 4 exámenes el alumno será considerado libre. En caso de desaprobar 2 regulatorios el alumno podrá recuperarlos en la instancia de recuperatorios.

- Se evaluará la participación activa del estudiante durante toda la cursada. La participación en las actividades a través del campus es obligatoria.
- Los exámenes consistirán en preguntas teóricas, problemas y/o ejercicios prácticos que permitan valorar la adquisición de los conocimientos adquiridos.
- En el caso de que en cada uno de los 4 regulatorios la nota sea 8 o superior el alumno aprueba por **promoción directa**. En caso contrario deberá rendir examen final que aprobará con al menos 6 puntos.
- **No es posible rendir la asignatura en calidad de alumno libre.**

10. Bibliografía:

- Cirilo Delgado, Antonio; Minguillón Llombart, Cristina; Joglar Tamargo, Jesús. “Introducción a la Química Terapéutica”. 2003, ed. Díaz de Santos.
- Artículos científicos de revistas de alto índice de impacto en las temáticas a desarrollar.