

QUÍMICA AVANZADA DEL FÁRMACO

Módulo	Materia	Curso	Semestre	Créditos	Tipo
Química	Química avanzada del fármaco	5º	1º	6	Optativa
Profesor			Dirección completa de contacto para tutorías		
José Antonio Gómez Vidal			Departamento de Química Farmacéutica y Orgánica Facultad de Farmacia Correo electrónico: jagvidal@ugr.es Teléfono: 958 240719		
			Horario de tutorías		
			Martes y Jueves (10:30 – 13:30)		
Grado en el que se imparte			Otros grados a los que se podría ofertar		
Grado en Farmacia			Grado en Químicas		
Prerrequisitos y/o recomendaciones					
Tener conocimientos adecuados sobre: <ul style="list-style-type: none"> Química Orgánica Química Farmacéutica 					
Breve descripción de contenidos (según Memoria de Verificación del Grado)					
Síntesis de entidades químicas avanzadas relacionadas con los fármacos					
Competencias generales y específicas					
A. Competencias genéricas: CG1 Identificar, diseñar, obtener, analizar, controlar y producir fármacos y medicamentos, así como otros productos y materias primas de interés sanitario de uso humano o veterinario.					
B. Competencias específicas: CEM1.3 Llevar a cabo procesos de laboratorio estándar incluyendo el uso de equipos científicos de síntesis y análisis, instrumentación apropiada incluida. CEM1.4 Estimar los riesgos asociados a la utilización de sustancias químicas y procesos de laboratorio. CEM1.5 Conocer las características físico-químicas de las sustancias utilizadas para la fabricación de los medicamentos. CEM1.9 Conocer el origen, naturaleza, diseño, obtención, análisis y control de medicamentos y productos sanitarios. CEM1.11 Conocer y aplicar las técnicas principales de investigación estructural incluyendo la espectroscopia					



Objetivos (expresados como resultados esperables de la enseñanza)

El alumno deberá obtener un conocimiento de la síntesis de entidades químicas avanzadas relacionadas con el fármaco, centrándose en los siguientes puntos:

- Estrategias para la obtención de estructuras útiles en la síntesis de fármacos.
- Utilización de enzimas en la obtención de compuestos relacionados con el fármaco.
- Separación de productos enantioméricamente puros.

Temario detallado de la asignatura

Temario teórico:

TEMA 1. Aspectos generales de la Química de los Fármacos.

Conceptos. Intereses de la industria farmacéutica. Síntesis lineales y convergentes. Importancia de la optimización del procedimiento sintético.

TEMA 2. Estrategias sintéticas I.

Diseño de la síntesis orgánica: Desconexiones y análisis retrosintético. Retrosíntesis de moléculas monofuncionales y difuncionales.

TEMA 3. Estrategias sintéticas II.

Introducción (conceptos fundamentales y términos estereoquímicos). Estrategias generales para la obtención de compuestos enantioméricamente puros. Resolución de racémicos. Síntesis asimétricas representativas.

TEMA 4. Estrategias sintéticas III.

Uso de organometálicos en síntesis orgánica: Formación de enlaces C-C y formación de enlaces C-heteroátomo. Síntesis representativa de fármacos.

TEMA 5. Síntesis de anillos frecuentes en fármacos.

Carbociclos. Heterociclos alifáticos y aromáticos. Síntesis representativas de fármacos.

TEMA 6. La quiralidad en la industria farmacéutica.

Introducción. Uso de enzimas en síntesis orgánica. Síntesis representativas de fármacos.

TEMA 7. Síntesis en fase sólida.

Síntesis de péptidos. Obtención de peptidomiméticos. Química combinatoria: principios y estrategias. Importancia de la química combinatoria en el desarrollo de nuevos fármacos.

TEMA 8. Estabilidad y cuantificación de Fármacos

Factores que influyen en la estabilidad. Métodos físicos y químicos de cuantificación de fármacos. Determinación de principios activos y metabolitos en medicamentos y fluidos biológicos.

Temario práctico:

1. Análisis del (*RS*)-ibuprofeno y del (*S*)-ibuprofeno mediante la formación de derivados diastereoisómeros.
2. Síntesis de la sulfasalazina.



Bibliografía

Bibliografía fundamental:

- A. Delgado, C. Minguillón, J. Joglar. *Introducción a la Síntesis de Fármacos*. Editorial Síntesis, 2003
- Wyatt, P.; Warren, S. *Organic synthesis: strategy and control*. John Wiley & Sons, 2007
- Lednicer, D. *The organic chemistry of drug synthesis (Vol. 7)*. Editorial John Wiley & Sons, 2008.
- S. Warren, P. Wyatt. *Organic Synthesis. The disconnection Approach*. 2ª Ed. Editorial Wiley, 2008.
- Li, J. J.; Johnson, D. S. *Modern drug synthesis*. Editorial Wiley, 2010
- Johnson, D. S.; Li, J. J. *The art of drug synthesis*. Editorial Wiley, 2007.
- Steven A. Kates, Fernando Albericio. *Solid-Phase Synthesis: A practical guide*. Dekker, 2000.
- Lin, G.; You, Q.; Cheng, J. *Chiral drugs: Chemistry and Biological action*. Editorial Wiley, 2011.
- Kurt Faber. *Biotransformations in Organic Chemistry: A Textbook* Springer
- Agranat, H. Caner, J. Caldwell. Putting chirality to work: the strategy of chiral switches. *Nature Reviews/Drug Discovery* **2002**, 1, 753-768.
- Ahuja, S.; Rasmussen, H. *HPLC Method Development for Pharmaceuticals*. Academic Press, 2007.

Bibliografía complementaria:

- Vardanyan, R. S.; Hruby, V. J. *Synthesis of essential drugs*. Editorial Elsevier, 2006
- Ganapathy Subramanian. *Chiral separation techniques*. Wiley-VCH 2007.
- R. Mannhold, H. Kubinyi, Timmerman, H. *Combinatorial Chemistry*. Wiley-VCH 2000.
- Paul Lloyd-Williams, Fernando Albericio, Ernest Giralt. *Chemical Approaches to the Synthesis of Peptides and Proteins*. CRC Press 1997.

Enlaces recomendados

Departamento de Química Farmacéutica y Orgánica (<http://www.ugr.es/~qfo/inicio.html>)
IUPAC Nomenclature of Organic Chemistry (<http://www.acdlabs.com/iupac/nomenclature/>)
Chemistry Guide (<http://www.chemistryguide.org/index.php>)
Journal of Medicinal Chemistry (<http://pubs.acs.org/journal/jmcmr>)
European Journal of Medicinal Chemistry (<http://www.journals.elsevier.com/european-journal-of-medicinal-chemistry/>)
Nature Reviews Drug Discovery (<http://www.nature.com/nrd/index.html>)
Medicinal Research Reviews (<http://onlinelibrary.wiley.com/journal/10.1002/%28ISSN%291098-1128>)

Metodología docente

- Lecciones expositivas de los contenidos apoyadas en esquemas, encaminadas a orientar a los alumnos en el aprendizaje de las teorías y conceptos fundamentales que constituyen el cuerpo de la disciplina (36 horas)
- Lecciones prácticas (15 horas)
- Seminarios y/o exposición de trabajos (6 horas)
- Realización de exámenes (3 horas)
- Tutorías individuales



Programa de actividades

Primer cuatrimestre	Actividades presenciales				Actividades no presenciales		
	Sesiones teóricas (horas)	Sesiones prácticas (horas)	Exposiciones (horas)	Exámenes (horas)	Trabajo individual del alumno (horas)	Estudio de las prácticas (horas)	Trabajo en grupo (horas)
Semana 1	2				4		
Semana 2	3				4		
Semana 3	3				4		
Semana 4	2				4		2
Semana 5	3				4		1
Semana 6	3				4		2
Semana 7	3				4		1
Semana 8	2				4		2
Semana 9	2		1		4		1
Semana 10	1	15	1	1	4	7	2
Semana 11	2		1		4	8	1
Semana 12	1		1		4		2
Semana 13	2		1		4		1
Semana 14	1		1		4		
Semana 15	3				4		
Semana 16	3						
Total horas	36	15	6	3	60	15	15

Evaluación

1. Los sistemas de evaluación que se utilizarán durante el curso serán establecidos por el profesor de la asignatura de entre los indicados en la guía docente (exámenes teóricos, realización de prácticas, exposición de trabajo, asistencia a clases). El primer parcial se realizará en hora de clase el día 25 de Noviembre de 2016. El examen final se realizará el día 26 de Enero de 2017 (11:30). Hay un examen, en caso de no haber superado la asignatura, el 12 de Julio de 2017 (anterior convocatoria de Septiembre).
2. La evaluación se realizará a partir de los exámenes propuestos en los que el alumno/a tendrá que demostrar las competencias adquiridas. Además se podrá tener en cuenta en la calificación final las calificaciones obtenidas en el examen parcial de la asignatura, las prácticas realizadas y los trabajos realizados por el alumno/a.
3. Los alumnos podrán acogerse a una evaluación única final, tal y como recoge el Artículo 6 de la Normativa de evaluación y de calificación de los estudiantes de la Universidad de Granada.
4. Las calificaciones parciales obtenidas en un curso académico no se guardarán para posteriores cursos.



Información adicional

