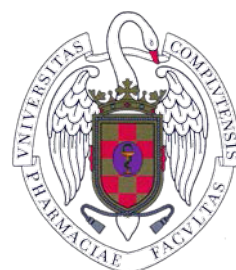


GRADO EN FARMACIA

Ficha Docente:

QUÍMICA FARMACÉUTICA II

CURSO 2022-23



FACULTAD DE FARMACIA
UNIVERSIDAD COMPLUTENSE DE MADRID



Ficha Docente:

QUÍMICA FARMACÉUTICA II

CURSO 2022-2023

FACULTAD DE FARMACIA
UNIVERSIDAD COMPLUTENSE DE MADRID

I.- IDENTIFICACIÓN

NOMBRE DE LA ASIGNATURA: Química Farmacéutica II

CARÁCTER: Obligatorio

MATERIA: Química Farmacéutica

MÓDULO: Química

CURSO: Cuarto

SEMESTRE: Primero

CRÉDITOS: 6 ECTS

DEPARTAMENTO/S: Química en Ciencias Farmacéuticas (Unidad Docente de Química Orgánica y Farmacéutica)

PROFESOR/ES RESPONSABLE/S:

Coordinadora: Prof^a Dra. Dña. María José Hernáiz Gómez-Dégano, Catedrática
e-mail: mjhernai@ucm.es

Profesores: Prof. Dr. D. José Carlos Menéndez Ramos, Catedrático
e-mail: josecm@ucm.es

Prof^a Dra. Dña. María José Hernáiz Gómez-Dégano, Catedrática
e-mail: mjhernai@ucm.es

Prof^a Dra. Dña. Mercedes Villacampa Sanz, Profesora Titular
e-mail: mvsanz@ucm.es

Prof. Dr. D. Luiz Apaza Ticona, Profesor Ayudante Doctor
e-mail: lnapaza@ucm.es

Prof^a Dra. Dña. Miriam Ruiz Serrano, Profesora Ayudante Doctor
e-mail: miriruiz@ucm.es

II.- OBJETIVOS

OBJETIVO GENERAL:

La asignatura de Química Farmacéutica II continúa el estudio sistemático de los fármacos, agrupados en función de sus dianas biológicas, con énfasis en los siguientes aspectos: diseño, mecanismo de acción molecular, relación estructura-actividad y síntesis. Además, trata algunos temas especiales relacionados con el estudio de la reactividad química de los fármacos y su aplicación a estudios de estabilidad y al desarrollo de reacciones de interés analítico.

OBJETIVOS ESPECÍFICOS

- Conocer y utilizar las reglas que permiten nombrar y formular un fármaco utilizando las reglas de nomenclatura sistemática y otros sistemas de nomenclatura.
- Comprender la interrelación entre la estructura, las propiedades físico-químicas, las características farmacocinéticas y la actividad de los fármacos.
- Conocer los métodos y estrategias empleados en el diseño de fármacos.
- Conocer los detalles químicos de las interacciones entre los fármacos y sus dianas biológicas.
- Conocer y plantear las modificaciones estructurales que afectan a las propiedades de los fármacos.
- Conocer las principales rutas que intervienen en la degradación metabólica de los fármacos, así como su influencia en la actividad y toxicidad de éstos.
- Conocer los procesos químicos que explican los mecanismos de acción molecular de las principales familias de fármacos.
- Conocer, plantear y llevar a cabo síntesis representativas de las principales familias de fármacos.
- Conocer y utilizar los métodos espectroscópicos para la determinación estructural y los fundamentos químicos de los métodos analíticos para la identificación y valoración de fármacos y compuestos relacionados.
- Conocer las principales reacciones químicas de los fármacos, especialmente las reacciones relevantes a efectos de estudios de estabilidad y analíticos.
- Conocer y utilizar las técnicas para adquirir y utilizar información referida a los aspectos químicos de los fármacos resumidos en las competencias anteriores.
- Conocer las normas de seguridad y las principales técnicas experimentales que se emplean en un laboratorio de Química Farmacéutica, estimando los riesgos asociados a la utilización de sustancias químicas y procesos de laboratorio.

III.- CONOCIMIENTOS PREVIOS Y RECOMENDACIONES

CONOCIMIENTOS PREVIOS:

No se establecen requisitos previos

RECOMENDACIONES:

Se recomienda tener conocimientos básicos de Química Orgánica y Bioquímica, así como tener cursada la asignatura Química Farmacéutica I.

IV.- CONTENIDOS

BREVE DESCRIPCIÓN DE LOS CONTENIDOS:

- Estudio sistemático de fármacos que actúan en receptores de membrana, en dianas intracelulares e interfiriendo con la formación de radicales: diseño, mecanismo de acción molecular, relación estructura-actividad y síntesis.
- Principales reacciones químicas de los fármacos, especialmente las relevantes a efectos de estudios de estabilidad y analíticos.

PROGRAMA DE TEORÍA:

- Continuación del estudio sistemático de los fármacos, agrupados en función de sus dianas biológicas, para cada uno de los grupos que se indican a continuación. Dicho estudio comprende los siguientes aspectos: diseño, mecanismo de acción molecular y relación estructura-actividad y síntesis:
- **TEMA 1.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN RECEPTORES DE MEMBRANA (I). ACETILCOLINA.**
Relaciones estructura-actividad en fármacos que actúan en receptores nicotínicos y muscarínicos.
- **TEMA 2.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN RECEPTORES DE MEMBRANA (II). NORADRENALINA.**
Fármacos que interfieren en procesos de transporte y almacenamiento de noradrenalina. Relaciones estructura-actividad en fármacos que actúan en receptores adrenérgicos.
- **TEMA 3.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN RECEPTORES DE MEMBRANA (III). DOPAMINA.**
Fármacos que interfieren en procesos de transporte y almacenamiento de dopamina. Relaciones estructura-actividad en fármacos que actúan en receptores dopaminérgicos.
- **TEMA 4.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN RECEPTORES DE MEMBRANA (IV). SEROTONINA Y MELATONINA.**
Relaciones estructura-actividad en fármacos que actúan en receptores de serotonina y melatonina.
- **TEMA 5.- SÍNTESIS DE FÁRMACOS (I).**
Estrategias de síntesis de fármacos relacionados con los temas 1-4. Derivados de ariletanolamina y ariletilamina. Derivados de imidazolina. Estructuras tricíclicas relacionadas con antidepresivos y neurolépticos.

- **TEMA 6.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN RECEPTORES DE MEMBRANA (V). AMINOÁCIDOS.**
Fármacos que interfieren en procesos de almacenamiento y metabolismo de GABA. Relaciones estructura-actividad en fármacos que actúan en receptores de GABA. Fármacos que interaccionan con receptores de aminoácidos excitatorios.
- **TEMA 7.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN RECEPTORES DE MEMBRANA (VI). PÉPTIDOS.**
Relaciones estructura-actividad de fármacos que actúan sobre receptores opioides. Antagonistas de receptores de angiotensina.
- **TEMA 8.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN RECEPTORES DE MEMBRANA (VII).**
Relaciones estructura-actividad de fármacos que actúan sobre receptores de histamina y ADP.
- **TEMA 9.- SÍNTESIS DE FÁRMACOS (II).**
Estrategias de síntesis de fármacos relacionados con los temas 5-9. Síntesis de arilpropilaminas relacionadas con metadona y antihistamínicos H₁. Síntesis de derivados de piperidina relacionados con la meperidina y el fentanilo. Síntesis de sistemas heterocíclicos relacionados con receptores de GABA: Barbitúricos, benzodiazepinas y compuestos relacionados. Síntesis de fármacos derivados de tetrazol.
- **TEMA 10.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN DIANAS INTRACELULARES (I). HORMONAS ESTEROIDEAS.**
Hormonas sexuales femeninas: relaciones estructura-actividad en estrógenos, antiestrógenos y gestágenos. Hormonas sexuales masculinas: relaciones estructura-actividad en andrógenos, antiandrógenos y anabolizantes. Corticoesteroides: relaciones estructura-actividad en antiinflamatorios esteroídicos. Calciferoles.
- **TEMA 11.- SÍNTESIS DE FÁRMACOS (III).**
Síntesis de derivados de estilbeno relacionados con antiestrógenos. Principales estrategias de síntesis de fármacos esteroideos.
- **TEMA 12.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN DIANAS INTRACELULARES (II). ADN Y ENZIMAS ASOCIADAS.**
Fármacos que interaccionan con el ADN. Agentes alquilantes: Procesos químicos relacionados con la alquilación del ADN. Principales tipos de antitumorales alquilantes. Agentes intercalantes. Agentes que interaccionan con los surcos del ADN. Fármacos que actúan en enzimas cuyo sustrato es el ADN. Terapia epigenética del cáncer.
- **TEMA 13.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE ACTÚAN EN DIANAS INTRACELULARES (III). ARN Y MICROTÚBULOS.**
Fármacos que interaccionan con el ARN: Antibióticos inhibidores de la biosíntesis proteica. Fármacos que interfieren la biosíntesis del ARN. Antitumorales que interaccionan con los microtúbulos.

- **TEMA 14.- DISEÑO DE FÁRMACOS QUE INTERFIEREN EN PROCESOS DE SEÑALIZACIÓN.**
Antitumorales que actúan en vías de señalización celular. Inhibidores de tirosina-quinasa. Inhibidores de farnesiltransferasa.
- **TEMA 15.- DISEÑO DE FÁRMACOS BASADO EN LA QUÍMICA DE RADICALES LIBRES (I).**
Radicales derivados de la molécula de oxígeno y su importancia biológica. Terapia antioxidante: antioxidantes terminadores de procesos radicalarios en cadena. Antioxidantes estabilizadores de biomembranas. Agentes quelantes como antioxidantes. Enzimas antioxidantes y fármacos relacionados.
- **TEMA 16.- DISEÑO DE FÁRMACOS BASADO EN LA QUÍMICA DE RADICALES LIBRES (II).**
Quimioterápicos que actúan a través de la formación de radicales libres. Quinonas antitumorales: Antraciclinas y compuestos relacionados. Enodios. Antibacterianos y antiparasitarios derivados de nitroheterociclos. Nitroderivados como radiosensibilizantes. Antimaláricos que rompen la membrana citoplasmática del plasmodio: Derivados de 4-aminoquinolina y 9-aminoacridina. Derivados de 8-aminoquinolina. Artemisinina.
- **TEMA 17.- SÍNTESIS DE FÁRMACOS (IV).**
Estrategias de síntesis de fármacos relacionados con los temas 12-17.

PROGRAMA DE PRÁCTICAS:

Las prácticas de laboratorio serán principalmente de tres tipos:

- Separación de mezclas de fármacos.
- Identificación y determinación de impurezas en fármacos mediante reacciones químicas de interés analítico.
- Ensayos de control de calidad en la industria farmacéutica.
- Realización de algunas síntesis de fármacos, acompañadas de las correspondientes purificaciones y del estudio estructural de los compuestos sintetizados por métodos espectroscópicos.

V.- BIBLIOGRAFÍA

- C. Avendaño (coord.). Introducción a la Química Farmacéutica (2ª ed.), Interamericana-McGraw-Hill, 2001.
- C. Avendaño, E.F. Llama, J.C. Menéndez, C. Pedregal, M.M. Söllhuber. Ejercicios de Química Farmacéutica, Interamericana-McGraw-Hill, 1997.
- G. L. Patrick. An Introduction to Medicinal Chemistry (6ª Ed.), Oxford University Press, 2017.
- R. B. Silverman. The Organic Chemistry of Drug Design and Drug Action (3ª Ed.), Elsevier, 2014.

- A. Delgado, C. Minguillón, J. Joglar. Introducción a la Química Terapéutica (2ª Ed.), Díaz de Santos 2003.
- A. Delgado, C. Minguillón, J. Joglar. Introducción a la Síntesis de Fármacos, Ed. Síntesis, 2002.
- T.L. Lemke, S.W. Zito, V.F. Roche y D.A. Williams. Essentials of Foye's Principles of Medicinal Chemistry Ed. LWW, 2016.
- N. Dunlap, D. M. Huryn. Medicinal Chemistry. CRC Press, 2018.
- P. Camps García, S. Vázquez Cruz, C. Escolano Mirón. Química Farmacéutica I (Tomo 1 y 2). Textos Docents. Universitat de Barcelona. 2009.
- G. L. Patrick. An Introduction to Drug Synthesis, Oxford University Press, 2015.

VI.- COMPETENCIAS

BÁSICAS, GENERALES Y TRANSVERSALES

Todas las de la Titulación Grado en Farmacia.

COMPETENCIAS ESPECÍFICAS.

CEQ1.- Identificar, diseñar, obtener, analizar y producir principios activos, fármacos y otros productos y materiales de interés sanitario.

CEQ3.- Llevar a cabo procesos de laboratorio estándar incluyendo el uso de equipos científicos de síntesis y análisis, instrumentación apropiada incluida.

CEQ4.- Estimar los riesgos asociados a la utilización de sustancias químicas y procesos de laboratorio.

CEQ20.- Conocer los detalles químicos de las interacciones entre los fármacos y sus dianas, así como los procesos químicos que explican los mecanismos de acción molecular de las principales familias de fármacos.

CEQ21.- Comprender la interrelación entre la estructura, las características farmacocinéticas y la actividad de los fármacos y plantear las modificaciones estructurales que afectan a las propiedades de los fármacos.

CEQ22.- Conocer, plantear y llevar a cabo síntesis representativas de las principales familias de fármacos.

CEQ23.- Conocer y utilizar las reglas de nomenclatura sistemática y otros sistemas de nomenclatura que permiten nombrar y formular los fármacos.

CEQ24.- Conocer y utilizar los fundamentos químicos de los métodos para la identificación y valoración de fármacos y compuestos relacionados.

CEB9.- Conocer las principales rutas metabólicas que intervienen en la degradación de fármacos.

CEM12.- Conocer las propiedades y mecanismos de acción de los fármacos.

VII.- RESULTADOS DEL APRENDIZAJE

1. Capacidad de nombrar los fármacos y representar su estructura a partir del nombre sistemático.
2. Capacidad de asociar la estructura de los fármacos con su mecanismo de acción molecular y su actividad terapéutica.
3. Capacidad de definir el grupo farmacóforo de un conjunto de moléculas activas.
4. Capacidad de predecir las transformaciones metabólicas de los fármacos en el organismo.
5. Capacidad de plantear transformaciones químicas de fármacos encaminadas a optimizar sus propiedades farmacocinéticas y su actividad biológica.
6. Capacidad de diseñar rutas de síntesis de fármacos.
7. Capacidad de predecir la reactividad química de los fármacos, especialmente en lo que se refiere a reacciones importantes a efectos de estabilidad o de interés analítico.
8. Adquisición de habilidades prácticas básicas en síntesis y caracterización analítica de fármacos.
9. Capacidad para encontrar y analizar información referente a los aspectos químicos de los fármacos.

VIII.- HORAS DE TRABAJO POR ACTIVIDAD FORMATIVA

Actividades formativas	Metodología	Horas	ECTS	Relación con las competencias
Clase magistral	Explicación de fundamentos teóricos, haciendo uso de herramientas informáticas.	28	1,12	Competencias: CEQ1, CEQ25-CEQ27, CEB9, CEM12 Resultados de aprendizaje: 2-6
Clases prácticas en laboratorio	Aplicación a nivel experimental de los conocimientos adquiridos.	15	0,6	Competencias: CEQ3, CEQ4, CEQ20, CEQ22 Resultados de aprendizaje: 7
Seminarios	Presentación y discusión de casos prácticos. Exposiciones.	12	0,56	Competencias: CEQ1, CEQ22-CEQ24, CEB9 Resultados de aprendizaje: 1 a 6 y 8
Aprendizaje virtual	Aprendizaje no presencial interactivo a través del campus virtual	2,5	0,1	Competencias: CEQ1, CEQ3, CEQ4, CEQ20-CEQ24, CEB9, CEM12 Resultados de aprendizaje: 1 a 8
Tutorías individuales y colectivas	Orientación y resolución de dudas.	5	0,2	Competencias: CEQ1, CEQ3, CEQ4, CEQ20-CEQ24, CEB9, CEM12 Resultados de aprendizaje: 1 a 8
Trabajo personal	Estudio. Búsqueda bibliográfica.	82,5	3,3	Competencias: CEQ1, CEQ3, CEQ4, CEQ20-CEQ24, CEB9, CEM12 Resultados de aprendizaje: 1 a 8
Examen	Pruebas orales y escritas.	5	0,12	Competencias: CEQ1, CEQ3, CEQ4, CEQ20-CEQ24, CEB9, CEM12 Resultados de aprendizaje: 1 a 8
TOTAL		150	6	

IX.- METODOLOGÍA

Las clases magistrales se impartirán al grupo completo de 75 alumnos, y en ellas se darán a conocer al alumno los contenidos fundamentales de la asignatura. Al comienzo de cada tema se expondrán claramente el programa y los objetivos principales del mismo. Al final del tema se hará un breve resumen de los conceptos más relevantes y se plantearán nuevos objetivos que permitirán interrelacionar contenidos ya estudiados con los del resto de la asignatura y otras asignaturas afines. Durante la exposición de contenidos se propondrán problemas que ejemplifiquen los conceptos desarrollados o que sirvan de introducción a nuevos contenidos. Para facilitar la labor de seguimiento por parte del alumno de las clases magistrales, se le podrá proporcionar material docente, en forma de fotocopias o a través del Campus Virtual.

En *los seminarios*, se resolverán ejercicios y cuestiones que ejemplifiquen los contenidos desarrollados en las clases magistrales. Periódicamente se suministrará al alumno una relación de dichos problemas/ejercicios con el objetivo de que intente su resolución previa a las clases. El proceso de resolución de estos problemas se llevará a cabo mediante diferentes métodos: en algunos casos se propondrá al alumno la exposición en clase de la resolución de algunos de estos problemas, debatiéndose sobre el procedimiento seguido, el resultado obtenido y su significado. En otros casos se discutirán los resultados de los alumnos en grupos reducidos y, posteriormente, se llevará a cabo su puesta en común.

Las clases prácticas en el laboratorio, impartidas a grupos de 12 alumnos, están orientadas a la aplicación de los conocimientos y prioriza la realización por parte del estudiante de las actividades prácticas que supongan la aplicación de los conocimientos teóricos adquiridos.

El profesor programará *tutorías con grupos reducidos de alumnos* sobre cuestiones planteadas por el profesor o por los mismos alumnos. También estarán disponibles tutorías para alumnos que de manera individual deseen resolver las dudas que surjan durante el estudio. Estas tutorías se realizarán de forma presencial en los horarios indicados por cada profesor y, excepcionalmente, de modo virtual.

Se utilizará el *Campus Virtual* para permitir una comunicación fluida entre profesores y alumnos y como instrumento para poner a disposición de los alumnos el material que se utilizará en las clases tanto teóricas como de problemas. También podrá utilizarse para presentar algunos temas complementarios cuyo contenido, aunque importante en el conjunto de la materia, no se considere oportuno presentarlo en las clases presenciales.

X.- EVALUACIÓN

La asistencia a las actividades presenciales es obligatoria y la participación activa del alumno en todas las actividades docentes se valorará en la calificación final. Para superar la asignatura será necesario:

- Haber realizado y superado las prácticas de laboratorio (condición necesaria para aprobar la asignatura).
- Obtener una calificación global igual o superior a un 50% de la máxima puntuación, aplicando los criterios que se indican a continuación:
 - 1. Prácticas de laboratorio, 10%.
 - 2. Resolución de cuestiones y problemas en pruebas escritas, 90%.
- La superación del curso requiere que en cada una de las calificaciones numéricas de las actividades realizadas en dichos apartados supere el 50% de la puntuación máxima. Esta condición deberá cumplirse para que se sume a la nota final la calificación del apartado 1.
- En caso de realizarse exámenes parciales liberatorios deberá superarse cada uno de ellos.
- Con el objetivo de potenciar la adquisición de las competencias y capacidades del alumnado, los profesores, en los casos que lo estimen oportuno, podrán optar por una **evaluación continua**, en la que el porcentaje correspondiente a los contenidos teóricos, puedan ser alcanzados a través de pruebas objetivas y/o otras actividades dirigidas cuyo máximo será un 15% de la nota final.

El Consejo del Departamento de Química en Ciencias Farmacéuticas en su reunión del 15 de febrero de 2019, adoptó el siguiente acuerdo en relación a las posibles actividades fraudulentas:

"Tanto la suplantación de la identidad, como la copia, acción o actividad fraudulenta durante cualquier actividad docente, conllevará el suspenso de la asignatura correspondiente en la presente convocatoria. La utilización o presencia de apuntes, libros de texto, calculadoras, teléfonos móviles u otros medios que no hayan sido expresamente autorizados por el profesor en el enunciado del examen se considerará como una actividad fraudulenta. En cualquiera de estas circunstancias, la infracción podrá ser objeto del correspondiente expediente informativo y en su caso sancionador a la inspección de servicios de la UCM."