

REACCIONES DOMINÓ EN LA SÍNTESIS DE DERIVADOS DE 1,2,4-TRIAZOLES CON ACTIVIDAD FARMACOLÓGICA

Beatriz Fernández Jaime
Facultad de Farmacia UCM. Trabajo Fin de Grado Junio de 2018



INTRODUCCIÓN

La aplicación de las reacciones dominó en el mundo de la química farmacéutica ha permitido el desarrollo de reacciones complejas utilizando los recursos mínimos. Es en esta búsqueda de ahorro cuando surgen técnicas como la reacción tándem aza-Wittig/ciclación intramolecular. Esta es la reacción por la que se sintetiza el esqueleto de los 1,2,4-triazoles, componente común de todos los principios activos de los que trata este estudio.

OBJETIVOS

- ✓ Desarrollo de las rutas sintéticas por reacciones dominó.
- ✓ Reacciones dominó en el panorama actual.
- ✓ Reacciones dominó en la obtención de 1,2,4-triazoles.
- ✓ Principales fármacos incluidos en derivados de 1,2,4-triazoles.
- ✓ Características farmacológicas de los derivados de 1,2,4-triazoles.

CONCLUSIONES

- Reacciones dominó como herramientas de ahorro de recursos.
- Proporcionan síntesis de elevados rendimientos.
- Síntesis del anillo común 1,2,4-triazol.
- Otras aplicaciones de la técnica.
- Utilidad terapéutica de todos los derivados.

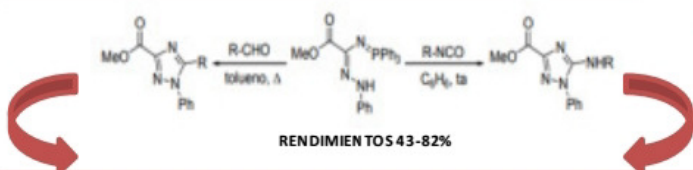
RESULTADOS Y DISCUSIÓN

REACCIONES DOMINÓ



PREPARACIÓN DE LOS SISTEMAS POLIAZADENTADOS A PARTIR DE FOSFACENOS

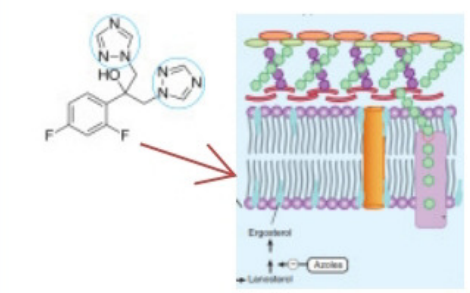
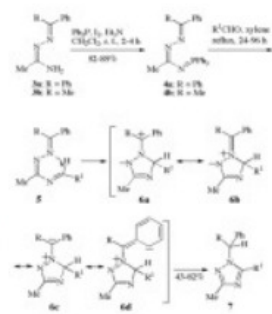
REACCIÓN AZA-WITTIG/CICLACIÓN INTRAMOLECULAR



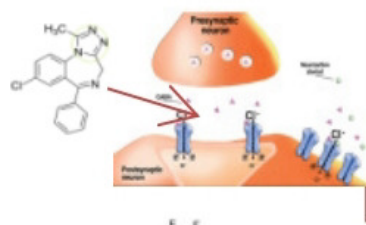
METODOLOGÍA

- Revisión bibliográfica. Se ha analizado información de revistas de divulgación científica, artículos científicos y tesis de diferentes fuentes:
 - Pubmed, Scifinder, Google Académico y AEMPS.
- Palabras clave en la búsqueda. "Reacciones dominó", "tándem aza-Wittig/intramolecular cyclization", "síntesis", "tándem", "cascada", "1,2,4-triazoles", empleando diferentes operadores técnicos para relacionar las palabras entre sí.

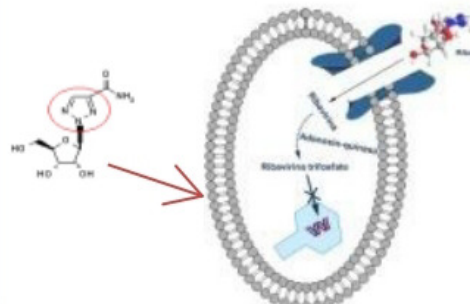
- Reacciones tándem aza-Wittig/electrociclación
- Procesos dominó aza-Wittig/adición nucleofílica intermolecular
- Reacciones aza-Wittig/ciclación intramolecular



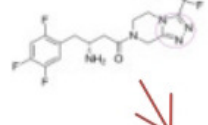
FLUCONAZOL: Tratamiento de infecciones fúngicas por candidiasis sistémica sin neutropenia asociada y por meningitis criptocócica. Mediante la inhibición de enzima lanosterol 14- α -desmetilasa, responsable de convertir el lanosterol en ergosterol, principal esteroide de la membrana micótica.



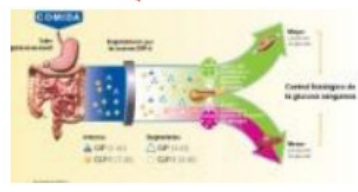
ALPRAZOLAM: Tratamiento de trastornos por ansiedad generalizada y por angustia con o sin agorafobia. Unión irreversible a receptores GABA, aumenta la frecuencia de la apertura del canal de ion cloruro produciendo una depresión de su actividad.



RIBAVIRINA: Tratamiento en combinación de la hepatitis C crónica. Inhibidor nucleosídico irreversible de la inosina monofosfato deshidrogenasa, provocando la inhibición del ARN viral.



SITAGLIPTINA: Inhibidor no peptidomimético, competitivo y reversible de la enzima DPP-4 por unión no covalente e hidrólisis, para el tratamiento de DM tipo II.



BIBLIOGRAFÍA

Ver PDF