Guía Docente

DATOS DE IDENTIFICACIÓN

Titulación:	Grado en Farmacia
Ámbito	Farmacia.
Facultad/Escuela:	Ciencias Experimentales
Asignatura:	Química Farmacéutica I
Tipo:	Obligatoria
Créditos ECTS:	6
Curso:	3
Código:	2533
Periodo docente:	Sexto semestre
Materia:	Química
Módulo:	Química
Tipo de enseñanza:	Presencial
Idioma:	Castellano
Total de horas de dedicación del alumno:	150

Equipo Docente	Correo Electrónico
José María Bueno Calderón	jmaria.bueno@ufv.es
María Luisa León Díaz	marialuisa.leon@ufv.es

DESCRIPCIÓN DE LA ASIGNATURA

La asignatura de Química Farmacéutica I aborda aspectos generales del diseño, nomenclatura y síntesis de fármacos e inicia al alumno en el estudio sistemático de los fármacos, agrupados en función de sus dianas biológicas, haciendo especial hincapié en los siguientes aspectos: diseño, mecanismo de acción, relación estructura-actividad y síntesis.

En las prácticas de laboratorio se utilizan las principales técnicas experimentales que se emplean en un laboratorio de Química Farmacéutica, estimando las normas de seguridad y los riesgos asociados a la utilización de sustancias químicas y procesos asociados al trabajo de laboratorio y a la resolución de problemas prácticos."

OBJETIVO

El objetivo final de la asignatura de química farmacéutica es doble. Por un lado pretende presentar a los alumnos los factores determinantes de la acción de los fármacos, en relación con su estructura química y sus propiedades fisicoquímcias.
Por otro lado, introduce al alumno en el complejo proceso de diseño de nuevos fármacos, basándose en sus interacciones con la diana terapéutica y en sus propiedades farmacocinéticas.

Los fines especficos de la asignatura son:

El objetivo final de la asignatura de Química Farmacéutica I es estudiar las propiedades fisicoquímicas de los fármacos y cómo éstas se relacionan con su acción terapéutica. De esta manera, en esta asignatura se estudian, en primer lugar, los aspectos farmacodinámicos de la acción de los fármacos sobre la diana terapéutica, tales como las fuerzas intermoleculares responsables de su afinidad, su relación con la estructura química de las las dianas y los efectos que provocan sobre éstas. Posteriormente se estudian los aspectos farmacocinéticos (ADME), mucho más relacionados con las propiedades fisicoquímicas de las moléculas, en particular en lo relativo al paso a través de las membranas biológicas. De esta manera, el alumno adquiere un conocimiento global sobre cómo la estructura química de los fármacos determina las características de su acción terapéutica, en particular en lo relativo a aspectos tan fundamentales como absorción, distribución, metabolismo, excreción, acción farmacológica y toxicidad. El estudio de la Química Farmacéutica se convierte en una de las piezas clave para entender el mecanismo de acción y las relaciones estructura-actividad de los fármacos. Posteriormente este conocimiento se puede aplicar al diseño nuevas entidades farmacológicamente activas, mediante la realización de cambios estructurales con el fin de modular dichas propiedades. Las disciplinas científicas relacionadas con la Química Farmacéutica son, por orden de importancia: 1) Química Orgánica 2) Farmacología 3) Bioquímica 4) Química Física

CONOCIMIENTOS PREVIOS

Debido al enfoque de la asignatura en los aspectos químicos de la acción de los fármacos, para poder cursar con éxito la asignatura de Química Farmacéutica I, es imprescindible haber superado la asignatura de Química Orgánica, de manera que antes de iniciar el estudio de la Química Farmacéutica I, el alumno posea un nivel básico de conocimiento en los siguientes puntos:
- Representación de moléculas orgánicas
- Reconocimiento de los principales grupos funcionales en las moléculas orgánicas
- Reactividad química básica de las moléculas orgánicas
- Acidez y Basicidad de las moléculas orgánicas
- Estereoisomería.

CONTENIDOS

PROGRAMA TEÓRICO
TEMA 0.- INTRODUCCIÓN A LA QUÍMICA FARMACÉUTICA.
- Fármaco, Medicamento, Droga.
- Aspectos Farmacodinámicos (Potencia, Toxicidad, Índice terapéutico)
- Aspectos Farmacocinéticos (LADME).
- El proceso del descubrimiento y desarrollo de un Fármaco ("Drug Discovery")

TEMA 1.- ASPECTOS FARMACODINÁMICOS DE LA ACCIÓN DE LOS FÁRMACOS

- Concepto de Diana terapéutica.
- Tipos de dianas terapéuticas
- Interacciones fármaco-diana terapéutica. Reconocimiento molecular
- Inhibidores enzimáticos
- Fármacos que interaccionan con receptores
- Fármacos que interaccionan con los ácidos nucleicos
- Fármacos que interaccionan con las membranas biológicas.

TEMA 2.- ASPECTOS FARMACOCINÉTICOS DE LA ACCIÓN DE LOS FÁRMACOS

- Rutas de administración
- LADME. Liberación, Absorción, Distribución, Metabolismo y Excreción de fármacos
- Fenómenos de transporte a través de las membranas biológicas
- Propiedades fisicoquímicas de los fármacos y su influencia en la farmacocinética
- Solubilidad, Lipofilia, Superficie polar Unión a proteínas plasmáticas
- Distribución. El paso a través de la Barrera Hematoencefálica y la barrera placentaria
- Absorción por vía oral. Concepto de "Drug-likeness". Reglas del 5 de Lipinski
- Solubilidad y permeabilidad. El Sistema de Clasificación Biofarmacéutica (BCS)

TEMA 3.- METABOLISMO DE FÁRMACOS

- Localización de los procesos metabólicos
- El primer paso hepático. Biodisponibilidad.
- Clasificación de los fármacos según su metabolismo
- Tipos de reacciones metabólicas Metabolismo de Fase I Metabolismo de Fase II TEMA

4.- DISEÑO Y OPTIMIZACIÓN DE FÁRMACOS.

- Optimización de los aspectos Farmacodinámicos de la acción de los fármacos Objetivos Estrategias de Farmacomodulación
- Relaciones Estructura-Actividad Cuantitativas (QSAR)
- Optimización de los aspectos Farmacocinéticos de la acción de los fármacos
- Optimización de las propiedades fisicoquímicas Fármacos duros y Fármacos blandos.
- Bio-precursores y Pro-fármacos

PRÁCTICAS DE LABORATORIO

- Síntesis de una colección de moléculas con potencial actividad biológica en receptores de membrana
- Estudio de Relaciones Estructura-Actividad Cuantitativas (QSAR) de los compuestos obtenidos
- Estudio de interacciones fármaco-diana mediante técnicas de realidad virtual. Diseño de nuevos fármacos.

ACTIVIDADES FORMATIVAS

Los contenidos de la asignatura se presentan a los alumnos en clases presenciales divididas en:

1.- CLASES DE TEORÍA (AFP1)

En ellas se dará a conocer el contenido de la asignatura. Al comienzo de cada tema se expondrán los objetivos principales del mismo y al final, se hará un breve resumen de los contenidos más relevantes impartidos. Para facilitar el trabajo de seguimiento de las clases por parte del alumno, se le proporcionará el material docente utilizado por el profesor a través del aula virtual, así como cualquier otro material docente que el profesor estime oportuno.

2.-CLASES DE RESOLUCIÓN DE PROBLEMAS (AFP3)

Se plantean como complemento de las clases teóricas y pretenden llevar a cabo un entrenamiento por parte del alumno en la resolución de problemas relacionados con el el Temario teórico impartido. Se suministrará al alumno, de forma periódica, una relación de los problemas/ejercicios para que intente resolverlos previamente a la clase. Se propondrá que el alumno resuelva en clase alguno de los problemas propuestos, favoreciendo de esta manera la participación activa, la discusión sobre el procedimiento seguido y los resultados obtenidos, y consiguiendo que el alumno se familiarice con el hecho de hablar en público. Asimismo, se recogerá periódicamente algún ejercicio propuesto con antelación

3.- PRACTICAS DE LABORATORIO (AFP2)

Se realizarán cuatro sesiones de prácticas en laboratorios, en las cuales los alumnos, dirigidos por el profesor, formarán un equipo de trabajo de investigación dirigido a la síntesis química y purificación de una colección de compuestos con potencial actividad farmacológica. Una vez sintetizados los compuestos, los alumnos recibirán la información biológica relevante sobre los compuestos obtenidos, de manera que llevarán a cabo el análisis posterior de las relaciones estructura-actividad cuantitativas (QSAR), utilizando técnicas computacionales adecuadas. En base al análisis QSAR realizado, los alumnos propondrán nuevas moléculas con potencialmente mejores propiedades biológicas y fisicoquímicas que las sintetizadas previamente. Adicionalmente, se llevarán a cabo sesiones en las cuales los alumnos estudiarán las interacciones fármacodiana utilizando técnicas inmersivas basadas en la realidad virtual. Para ello, los alumnos contarán con equipos de gafas de realidad virtual que les permitirán interaccionar con las macromoléculas en el espacio biológico de forma tridimensional, de forma natural e

inmersiva
4.-ASISTENCIA Y PARTICIPACIÓN EN LAS ACTIVIDADES PRESENCIALES EN EL AULA (AFP3)
5.- TUTORÍAS (AFP5)
Se realizarán controles diarios de asistencia. Para acogerse a la valoración por evaluación continua será necesario asistir mínimo al 80% de las clases y actividades realizadas en el aula.
5.- TRABAJO AUTÓNOMO:
Preparación de las clases de teoría y ejercicios propuestos (AFNP1)
Preparación y estudio de las prácticas de laboratorio (AFNP2)
Preparación de tutorías (AFNP4)

DISTRIBUCIÓN DE LOS TIEMPOS DE TRABAJO

ACTIVIDAD PRESENCIAL	TRABAJO AUTÓNOMO/ACTIVIDAD NO PRESENCIAL
66 horas	84 horas

Competencias transversales

Cultivar una actitud de inquietud intelectual y de búsqueda de la verdad en todos los ámbitos de la vida.

Desarrollar hábitos de pensamiento riguroso.

Saber aplicar los conocimientos teóricos aprendidos a la resolución de problemas y casos prácticos relacionados con las distintas materias.

RESULTADOS DE APRENDIZAJE

Identificar, diseñar, obtener, analizar y producir principios activos, fármacos y otro productos y materiales de interes sanitario.

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

Conocer y aplicar las técnicas principales de investigación estructural incluyendo la espectroscopía

Conocer las característica físico-químicas de las sustancias utilizadas para la fabricación de los medicamentos.

Conocer y comprender las características de las reacciones en disolución, los diferentes estados de la materia y los principios de la termodinámica y su aplicación a las ciencias farmacéuticas.

Conocer y comprender las principales características de los elementos y sus compuestos, asi como su aplicación en el ámbito farmacéutico.

Conocer y comprender la naturaleza y comportamiento de los grupos funcionales en moléculas orgánicas.

Conocer el origen, naturaleza, diseño, obtención, análisis y control de medicamentos y productos sanitarios.

RESULTADOS DE APRENDIZAJE ESPECIFICOS

Aplicar el contenido teórico incluido en los bloques temáticos

Realizar las operaciones necesarias en un laboratorio de síntesis orgánica y aislamiento de fármacos, y su análisis y determinación estructural (métodos espectroscópicos y químicos).

Desarrollar las habilidades necesarias para el diseño de fármacos, manejo de modelos moleculares y de estructuras de fármacos, utilizando técnicas informáticas convencionales (ordenador) y de realidad virtual inmersiva (gafas de RV)

Aplicar las operaciones básicas propias de un laboratorio de química orgánica como son las implicadas en la síntesis y aislamiento de sustancias orgánicas sencillas, su determinación estructural mediante técnicas espectroscópicas y análisis de relaciones estructura-actividad de fármacos.

Aplicar el método científico, y las habilidades para la síntesis, aislamiento y caracterización de compuestos orgánicos

Identificar los elementos químicos y sus compuestos con especial atención a los aspectos fisicoquímicos que tienen importancia en la práctica farmacéutica

Identificar los objetivos perseguidos y estrategias empleadas en el diseño de fármacos

Reconocimiento de los grupos funionales orgánicos presentes en los fármacos y las fuerzas intermoleculares moleculares que dan lugar a las interacciones con las dianas

SISTEMA DE EVALUACIÓN DEL APRENDIZAJE

El sistema de evaluación tendrá en consideración las siguientes aportaciones:
1) SE1.-EXAMEN ESCRITO (50%)
Se evaluará el grado de comprensión y asimilación de los contenidos de las clases teóricas y de los seminarios realizados. Para ello, se llevará a cabo un examen final que tendrá un valor máximo de 10 puntos
2) SE8.-PRACTICAS DE LABORATORIO (25%)
Durante el período de prácticas, el alumno es responsable de la preparación del trabajo a realizar en el laboratorio día siguiente. Para ello contará con material docente, consistente en la guía de prácticas y en material audiovisual grabado por el profesor en el que se detalla el procedimiento que los alumnos deberán seguir durante la práctica. Con el fin de determinar el grado de comprensión de la práctica, el alumno deberá contestar al final de la sesión de prácticas a una serie de preguntas sobre aspectos relacionados con las prácticas realizadas. Durante la realización de las prácticas, los experimentos, las observaciones y las conclusiones obtenidas se registrarán diariamente en el cuaderno de laboratorio, que será entregado al profesor para su evaluación al final del período de prácticas. La asistencia a todas las sesiones prácticas es obligatoria y se exige puntualidad. La inasistencia o retraso injustificados a cualquiera de las sesiones conlleva la pérdida del derecho a la evaluación de prácticas en la convocatoria ordinaria y, como consecuencia, un suspenso global en la asignatura. Los alumnos en esta situación deberán contactar inmediatamente con el profesor.
En la nota final de prácticas se tendrán en cuenta tanto la contribución correspondiente al cuaderno de prácticas (50%), como las respuestas a las preguntas previas propuestas por el profesor (50%). Para poder aprobar las prácticas, se necesita obtener un mínimo de 5,0 puntos (sobre 10) tanto en las preguntas como en el cuaderno de laboratorio
3) SE2, SE4.-REALIZACIÓN Y PRESENTACIÓN DE EJERCICIOS PROPUESTOS (25%)
Se calificará, fundamentalmente, la destreza del alumno en la resolución de los problemas que plantee el profesor, que se realizarán en clase de forma presencial.
- NOTA MEDIA FINAL
Para poder sumar las contribuciones de los distintos apartados, es necesario obtener un mínimo de 5,0 puntos, tanto en el examen escrito como en las prácticas de laboratorio. La asignatura se aprobará con una nota igual o superior a 5 puntos teniendo en cuenta la media ponderada de todas las contribuciones anteriores. Este criterio

será el mismo tanto en la convocatoria ordinaria como en la extraordinaria. En caso de que el alumno no tenga la asignatura aprobada en la convocatoria ordinaria, pero tenga una nota superior a 5.0 alguno de los apartados 1 o 2 podrá mantener dicha nota del para la convocatoria extraordinaria
SISTEMA DE EVALUACIÓN ALTERNATIVO PARA ALUMNOS DE SEGUNDA MATRÍCULA Y SUCESIVAS
Este sistema está destinado a alumnos repetidores que no se acojan al sistema ordinario de evaluación por no poder asistir a las clases de forma presencial. Los alumnos en 2º o sucesivas matrículas deben contactar con el profesor a lo largo de los 5 primeros días del curso para solicitar acogerse a este sistema e informarse de los criterios de evaluación específicos de su caso. En este sistema alternativo se mantendrán las mismas contribuciones y criterios de evaluación indicados anteriormente.
1) SE1.-EXAMEN ESCRITO (50%)
2) SE8.-PRACTICAS DE LABORATORIO (25%)
3) SE2, SE4.-REALIZACIÓN Y PRESENTACIÓN DE EJERCICIOS PROPUESTOS (25%)
NOTAS:
* En caso de que el alumno en la convocatoria ordinaria no tenga la asignatura aprobada pero tenga una nota superior a 5.0 en los apartados 1 o 2 podrá mantener la nota del correspondiente apartado para la convocatoria extraordinaria
* Las conductas de plagio, el uso de medios ilegítimos en las pruebas de evaluación, y los comportamientos no apropiados dentro del laboratorio serán sancionados conforme a los establecido en la Normativa de Evaluación y la Normativa de Convivencia de la universidad.

BIBLIOGRAFÍA Y OTROS RECURSOS

Básica

Patrick, G.L. An Introduction to Medicinal chemistry 6th

Rostron Ch. Drug design and development

Silverman, R.B. The Organic Chemistry of Drug Design and Drug Action

Profesor Dr. José María Bueno Calderón Material Audiovisual proporcionado 24-25