

# Guía Docente

## DATOS DE IDENTIFICACIÓN

|  |                         |                |      |
|--|-------------------------|----------------|------|
| Titulación:                              | Grado en Farmacia       |                |      |
| Rama de Conocimiento:                    | Ciencias de la Salud    |                |      |
| 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 |

## 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 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 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
- Liberación, absorción, distribución y excreción
- Transporte a través de las membranas biológicas
- Propiedades fisicoquímicas

- Concepto de "Drug-likeness". Reglas del 5 de Lipinski
- 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
- Diseño de nuevas moléculas

## ACTIVIDADES FORMATIVAS

Teniendo en cuenta la particular situación que se debe afrontar, es importante señalar que las actividades formativas que a continuación se detallan, así como la distribución de los tiempos de trabajo, pueden verse modificadas y adaptadas en función de los distintos escenarios establecidos, siguiendo las indicaciones de las autoridades sanitarias

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

#### 1.- CLASES DE TEORÍA:

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:

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:

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.

#### 4.-ASISTENCIA Y PARTICIPACIÓN EN LAS ACTIVIDADES PRESENCIALES EN EL AULA:

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:

El alumno preparará, de manera previa, las clases de teoría y realizará los problemas propuestos en los seminarios. En los casos dispuestos por el profesor, entregará los problemas que se le pidan y en su caso los resolverá en clase, para fomentar la participación y favorecer la discusión de resultados.

|  |
|--|
|  |
|--|

## DISTRIBUCIÓN DE LOS TIEMPOS DE TRABAJO

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

## COMPETENCIAS

### Competencias básicas

Que los estudiantes hayan demostrado poseer y comprender conocimientos en un área de estudio que parte de la base de la educación secundaria general, y se suele encontrar a un nivel que, si bien se apoya en libros de texto avanzados, incluye también algunos aspectos que implican conocimientos procedentes de la vanguardia de su campo de estudio

Que los estudiantes hayan desarrollado aquellas habilidades de aprendizaje necesarias para emprender estudios posteriores con un alto grado de autonomía

### Competencias generales

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.

Diseñar, aplicar y evaluar reactivos, métodos y técnicas analíticas clínicas, conociendo los fundamentos básicos de los análisis clínicos y las características y contenidos de los dictámenes de diagnóstico de laboratorio.

Reconocer las propias limitaciones y la necesidad de mantener y actualizar la competencia profesional, prestando especial importancia al autoaprendizaje de nuevos conocimientos basándose en la evidencia científica disponible.

### 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.

### Competencias específicas

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

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

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

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

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

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

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

## RESULTADOS DE APRENDIZAJE

Aplicar el contenido teórico incluido en los bloques temáticos (R1).

Realizar las operaciones necesarias en un laboratorio de síntesis orgánica y aislamiento de fármacos, y su análisis y determinación estructural (métodos espectroscópicos y químicos). (R2)

Desarrollar las habilidades necesarias para el diseño de fármacos, manejo de modelos moleculares y de estructuras de fármacos por ordenador. (R3)

Aplicar las operaciones básicas propias de un laboratorio de química orgánica como son las implicadas en la síntesis y aislamiento de sustancias orgánicas sencillas y su determinación estructural. (R4)

Aplicar el método científico, y las habilidades para la síntesis, aislamiento y caracterización de compuestos orgánicos. (R5)

Identificar los elementos químicos y sus compuestos con especial atención a los aspectos químicos que tienen importancia en la práctica farmacéutica. (R6)

Identificar los métodos y estrategias empleados en el diseño de fármacos (R7).

Reconocimiento de las fuerzas intermoleculares que dan lugar a las interacciones con las dianas (R8)

Identificación de grupos funcionales en las moléculas capaces de establecer las fuerzas intermoleculares con las dianas (R9)

## SISTEMA DE EVALUACIÓN DEL APRENDIZAJE

El sistema de evaluación tendrá en consideración las siguientes aportaciones:

### 1) 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.

El examen escrito se llevará a cabo en modalidad presencial, salvo que, debido a la situación sanitaria, las autoridades obliguen a seguir un confinamiento. En caso de confinamiento, el examen se llevará a cabo en modo remoto, utilizando los métodos de control disponibles para garantizar la probidad por parte del alumno en la realización del mismo y sin variación en el sistema de evaluación respecto al presencial

### 2) PRACTICAS DE LABORATORIO (20%).

El alumno es responsable de la preparación de la práctica del día siguiente siguiendo la guía de prácticas suministrada.

Durante la realización de las prácticas, los experimentos, las observaciones y las conclusiones obtenidas se registrarán diariamente en un cuaderno de laboratorio, que será entregado al profesor para su evaluación al final de cada período de prácticas. Al finalizar todas las sesiones de prácticas se realizará un examen donde se evaluará el conocimiento y las capacidades adquiridas por los alumnos. La asistencia a todas las sesiones prácticas, independientemente del lugar donde se desarrollen (laboratorio, salas de informática, etc) es obligatoria. La inasistencia injustificada a cualquiera de estas 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 (70%), como la del examen realizado (30%). Para poder aprobar las prácticas, se necesita obtener un mínimo de 5,0 puntos (sobre 10) en el examen de prácticas.

### 3) ACTIVIDADES DIARIAS Y EJERCICIOS. REALIZACIÓN Y PRESENTACIÓN DE EJERCICIOS

#### PROPUESTOS (10%).

Se calificará, fundamentalmente, la destreza del alumno en la resolución de los problemas que plantee el profesor, dentro del plazo establecido para su entrega.

#### 4) TRABAJOS INDIVIDUALES Y GRUPALES (15%)

Resolución de casos prácticos relativos al diseño de fármacos

#### 5) ASISTENCIA Y PARTICIPACIÓN EN LAS ACTIVIDADES PRESENCIALES EN EL AULA (5%).

#### - NOTA MEDIA FINAL

Para poder sumar los distintos apartados que contribuyen a la nota final, 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 el caso de que el alumno no apruebe la asignatura en la convocatoria ordinaria, se le guardará la nota correspondiente a los ejercicios y prácticas hasta la convocatoria extraordinaria.

#### SISTEMAS DE EVALUACIÓN ALTERNATIVOS

##### 1) 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 regular.

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.

##### 2) SISTEMA ALTERNATIVO EN CASOS DE COVID

En caso de llevar a cabo una docencia exclusivamente en remoto debido a razones sanitarias, se realizarán las pruebas correspondientes utilizando las técnicas adecuadas para garantizar la probidad en la prueba por parte de los alumnos

En ambos sistemas alternativos se mantendrán las mismas contribuciones y criterios de evaluación indicados anteriormente.

##### 1) EXAMEN ESCRITO (50%).

##### 2) PRACTICAS DE LABORATORIO (20%).

##### 3) ACTIVIDADES DIARIAS Y EJERCICIOS. REALIZACIÓN Y PRESENTACIÓN DE EJERCICIOS

##### PROPUESTOS (15%).

##### 4) TRABAJOS INDIVIDUALES Y GRUPALES (15%)

#### 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, así como el uso de medios ilegítimos en las pruebas de evaluación, serán sancionados conforme a lo establecido en la Normativa de Evaluación y la Normativa de Convivencia de la universidad.

## BIBLIOGRAFÍA Y OTROS RECURSOS

### Básica

- Material suplementario escrito y grabado suministrado por el profesor
- W. O., FOYE. (2003). "Principios de Química Farmacéutica Tomos 1 y 2", Reverté.

- G. L., PATRICK. (2012). "An Introduction to Medicinal Chemistry". Oxford University Press.

- DELGADO, A.; MINGUILLÓN, C.; JOGLAR, J. (2013) Introducción a la Química Terapéutica, 2ª Ed., Díaz de Santos, Madrid.