

Síntesis de Fármacos y Materias Primas I

UNIVERSIDAD NACIONAL AUTÓNOMA DE MÉXICO

FACULTAD DE ESTUDIOS SUPERIORES
"ZARAGOZA"Plan de estudios
Carrera Química Farmacéutico BiológicaPrograma del Módulo: **SÍNTESIS DE FÁRMACOS Y MATERIAS PRIMAS I**

Clave 1410	Semestre Cuarto	Créditos 18	Orientación:	N/A				
			Ciclo:	Intermedio				
			Área:	Química				
Modalidad	TEO (X) TA () LAB (X) CLIN () SEM ()			Tipo	T () P () T/P (X)			
Carácter	Obligatorio (X)			Horas				
							Semana	Semestre / Año
				Teóricas	5	Teóricas	80	
				Prácticas	8	Prácticas	128	
				Total	13	Total	208	

Seriación	
Ninguna ()	
Obligatoria (X)	
Módulo antecedente	Ninguno
Módulo subsecuente	Síntesis de Fármacos y Materias Primas II

Objetivo general:

Adquirir conocimientos de química orgánica para entender y complementar la información sobre los procesos biológicos, farmacológicos, bioquímicos e industriales, así como comprender el fundamento teórico de métodos y técnicas analíticas experimentales, lo que posibilita su aplicación racional en la generación de nuevos conocimientos.

Objetivos específicos:

- Reconocer el grupo carbonilo de aldehídos y cetonas como grupo funcional de gran importancia en la estructura de moléculas complejas. Estudiar las propiedades químicas y físicas fundamentales del grupo funcional, además de conocer su reactividad, por medio del mecanismo de adición nucleofílica sobre el carbonilo.
- Estudiar las propiedades físicas y químicas de los ácidos carboxílicos y sus derivados, los procesos de síntesis y reactividad del grupo funcional haciendo énfasis en la importancia de los ácidos carboxílicos como parte estructural de moléculas biológicas (aminoácidos, proteínas etc.), por otro lado describir la caracterización analítica y espectroscópica de estos compuestos.

- Explorar la reactividad del carbono alfa al grupo carbonilo, mediante el estudio de las propiedades físicas y químicas (acidez de los hidrógenos alfa), así como la metodología en síntesis orgánica de moléculas complejas, aprovechando la nucleofilicidad del carbono alfa al grupo carbonilo.
- Entender las reacciones de oxidación y reducción como herramientas de gran utilidad en procesos de transformación de grupos funcionales que permiten ser empleados en procesos sintéticos.
- Estudiar y clasificar diferentes procesos y rutas de síntesis usando la tecnología de desconexión y análisis retrosintético como herramienta en la síntesis de fármacos.
- Realizar una revisión bibliográfica para proponer y sintetizar fármacos, así como tener la capacidad de identificar y sintetizar materias primas utilizadas en el laboratorio para la obtención de dichos fármacos.

Índice temático			
	Tema	Horas semestre / año	
		Teóricas	Prácticas
1	Adición nucleofílica a compuestos carbonílicos	16	20
2	Sustitución nucleofílica sobre el grupo acilo (proceso de adición-eliminación)	20	36
3	Reacciones del carbono alfa al carbonilo. Enoles	20	20
4	Oxidaciones y reducciones	8	20
5	Síntesis y análisis retrosintético (enfoque farmoquímico)	16	32
Total		80	128

Contenido Temático Teoría	
	Tema y subtemas
I	Adición nucleofílica a compuestos carbonílicos. 1.1 Clasificación de los compuestos carbonílicos. 1.2 Nomenclatura de los aldehídos y cetonas. IUPAC y común. 1.3 Análisis estructural del grupo carbonilo. 1.3.1 Hibridación. Tipo y ángulo de enlace. 1.3.2 Resonancia. Polaridad del enlace carbono-oxígeno. 1.4 Propiedades físicas. 1.4.1 Punto de ebullición. 1.4.2 Punto de fusión. 1.4.3 Solubilidad. 1.5 Métodos de obtención de aldehídos y cetonas. 1.6 Reactividad de aldehídos y cetonas. 1.6.1 Mecanismo de reacción en la adición nucleofílica. 1.6.2 Estereoquímica de las reacciones de adición nucleofílica (caras rey si) 1.6.3 Adición de reactivos que contienen oxígeno. 1.6.4 Adición de reactivos que contienen azufre. 1.6.5 Adición de reactivos que contienen nitrógeno. 1.6.6 Adición de hidruros (hidrógeno negativo). 1.6.7 Adición de reactivos con carbono nucleofílico. 1.7 Reconocimiento espectroscópico de aldehídos y cetonas (IR, ¹ HRMN, ¹³ CRMN y EM ⁺).

<p>II</p>	<p>Sustitución nucleofílica sobre el grupo acilo (proceso de adición-eliminación)</p> <p>2.1 Introducción.</p> <p>2.1.1 Aspectos generales.</p> <p>2.2 Nomenclatura de los ácidos carboxílicos. IUPAC y común.</p> <p>2.3 Estructura y enlace del grupo carboxilo.</p> <p>2.4 Propiedades físicas y químicas. Acidez.</p> <p>2.4.1 Punto de ebullición.</p> <p>2.4.2 Punto de fusión.</p> <p>2.4.3 Solubilidad.</p> <p>2.5 Métodos de obtención de ácidos carboxílicos.</p> <p>2.6 Reactividad del ácido carboxílico.</p> <p>2.6.1 Mecanismo de reacción en la sustitución nucleofílica. (Proceso de adición-eliminación).</p> <p>2.6.2 Adición de reactivos que contienen oxígeno.</p> <p>2.6.3 Adición de reactivos que contienen azufre.</p> <p>2.6.4 Adición de reactivos que contienen nitrógeno.</p> <p>2.6.5 Adición de hidruros (hidrógeno negativo).</p> <p>2.6.6 Adición de reactivos que contienen carbono nucleofílico.</p> <p>2.7 Formación de los derivados de ácidos carboxílicos.</p> <p>2.8 Reacciones de los derivados de ácidos carboxílicos.</p> <p>2.8.1 Inter-conversión entre los derivados de ácidos mediante sustitución nucleofílica en el grupo acilo.</p> <p>2.8.2 Hidrólisis de los derivados de ácidos carboxílicos.</p> <p>2.9 Carbonilos α, β-insaturados.</p> <p>2.9.1 Reactividad de carbonilos α, β-insaturados. (adición nucleofílica).</p> <p>2.9.2 Mecanismo de adición nucleofílica a sistemas α, β-insaturados (adición 1,4- y 1,2-)</p> <p>2.9.3 Adición de reactivos que contienen oxígeno.</p> <p>2.9.4 Adición de reactivos que contienen azufre.</p> <p>2.9.5 Adición de reactivos que contienen nitrógeno.</p> <p>2.9.6 Adición de hidruros (Hidrógeno negativo).</p> <p>2.9.7 Adición de reactivos que contienen carbono nucleofílico.</p> <p>2.10 Espectroscopia de los ácidos carboxílicos y sus derivados.</p>
<p>III</p>	<p>Reacciones del carbono alfa al carbonilo. Enoles</p> <p>3.1 Acidez de hidrógenos alfa</p> <p>3.2 Formación de enoles y enolatos</p> <p>3.2.1 Formación de enolatos, regio- y estereo-selectiva.</p> <p>3.3 Tautomería ceto-enol</p> <p>3.4 Halogenación del carbono alfa al carbonilo.</p> <p>3.5 Alquilación de enolatos.</p> <p>3.6 Reacciones de adición de enoles y enolatos al grupo carbonilo.</p> <p>3.7 Condensaciones.</p> <p>3.8 aplicaciones de las reacciones de condensación.</p>
<p>IV</p>	<p>Oxidaciones y reducciones</p> <p>4.1 Estados de oxidación de las moléculas orgánicas.</p> <p>4.2 Oxidación de alcoholes, aldehídos y cetonas.</p> <p>4.3 Oxidaciones de dobles enlaces C-C.</p> <p>4.4 Oxidaciones alílicas y bencílicas.</p> <p>4.5 Hidrogenación catalítica.</p> <p>4.6 Reacción con hidruros y otros reductores.</p>

V	<p>Síntesis y análisis retrosintético (enfoque farmoquímico)</p> <p>5.1 Análisis retrosintético.</p> <p> 5.1.1 Definiciones y ejemplos de Sintón.</p> <p>5.2 Definición y ejemplos de algunos tipos de síntesis.</p> <p>5.3 Síntesis lineal y convergente.</p> <p>5.4 Síntesis parcial.</p> <p>5.5 Síntesis formal.</p> <p>5.6 Síntesis total.</p> <p>5.7 Síntesis regioselectiva.</p> <p>5.8 Síntesis por relevo.</p> <p>5.9 Síntesis degradativa.</p> <p>5.10 Síntesis biomiméticas.</p> <p>5.11 Síntesis asimétrica.</p> <p>5.12 Síntesis diastereoselectiva</p> <p>5.13 Síntesis diastereoespecífica.</p> <p>5.14 Síntesis enantioselectiva</p> <p>5.15 Síntesis enantioespecífica</p>
----------	---

Actividades didácticas		Evaluación del aprendizaje	
Exposición	(X)	Exámenes parciales	(X)
Trabajo en equipo	(X)	Examen final	(X)
Investigación documental	(X)	Trabajos y tareas	(X)
Trabajo de investigación	(X)	Presentación de tema	(X)
Prácticas y/o Proyecto (taller o laboratorio)	(X)	Participación en clase	(X)
Prácticas clínicas	()	Asistencia	(X)
		Proyecto	(X)
Otras (especificar)		Práctica clínica	()
		Otras (especificar) Resolución de problemas	(X)

Perfil profesiográfico del docente	
Título o grado	Licenciatura en Química o Química Farmacéutico Biológica o posgrado en Química o áreas afines, preferentemente con formación en síntesis orgánica.
Experiencia docente	Experiencia docente mínimo de un año en el área de Química Orgánica.
Otra característica	Contar con experiencia en el área de síntesis química. Con conocimientos y habilidades didácticas obtenidas en cursos de docencia.

Bibliografía básica:

- Allinger D. Química orgánica. 2a ed. México: Reverté; 1984.
- Borell, B, Teixido C, Falcó J. Síntesis orgánica. Madrid: Síntesis; 1999.
- Carey F. Química orgánica. 6a ed. México: McGraw Hill; 2003.
- Corey EJ. The logic of chemical synthesis. New York: John Wiley & Sons; 1995.
- Fox MA, Whitesell J. Química orgánica. 2a ed. México: Pearson Education; 2000.
- Juaristi E. Quiralidad en la química, la física y la biología. México: Colegio Nacional; 2008.
- Juaristi E. Introducción a la estereoquímica y el análisis conformacional. México: Colegio Nacional; 2007.
- Loundon M. Organic chemistry. Study Guide and solutions manual. 5th ed. New York: Roberts & Co.; 2009.
- McMurry J. Química orgánica. 7a ed. México: Cengage Learning; 2008.
- Morrison R. Química orgánica. 5a ed. México: Addison-Wesley; 1990.
- Mundy BP, Ellerd MG. Name reactions and reagents in organic synthesis. New York: John Wiley & Sons; 1988.
- Pine SH, Hendricson JB. Química orgánica. México: McGraw-Hill; 1988.

- Solomons T. Organic chemistry. 9a ed. New York: John Wiley & Sons; 2006.
- Wade LG. Organic chemistry. 6a ed. New Jersey: Prentice Hall; 2006.
- Wingrove AS, Caret RL. Organic chemistry. New York: Harper and Row Publishers; 1988.

Bibliografía complementaria:

- Dyer JR. Aplicaciones de espectroscopia de absorción en compuestos orgánicos. Bogotá: Prentice Hall; 1973.
- Fessendel RJ. Química orgánica. México: Iberoamericana; 1990.
- Gutshe CD. The chemistry of carbonyl compounds. New Jersey: Prentice Hall; 1967.
- Henderson RB. Problemas en química orgánica. México: Manual Moderno; 1980.
- Hendrickson JB. Organic chemistry. México: Manual Moderno; 1987.
- Leonard J, Lygo B, Procter G. Advanced practical organic chemistry. Boca Ratón: CRC Press; 2013.
- Lide DR. Handbook of data on organic compounds. 3a ed. Boca Ratón: CRC Press; 1994.
- Pasto D J, Johnson CR. Organic structure determination. USA: Prentice Hall, 1969.
- Roberts JD, Caserio JC. Basic principles of organic chemistry. New York: W.A. Benjamin; 1965.
- Stowell JC. Carbanions in organic synthesis. New York: John Wiley; 1979.
- Trahanovsky W. Functional groups in organic compounds. New Jersey: Prentice Hall; 1971.