

Teoría		Práctica	
Presencial	No-presen	Presencial	No-presen
15 h	5 h	20 h	10 h

Modalidad de evaluación y requisitos de aprobación.

Por Asistencia: asistencia al 85 % de las clases presenciales y aprobación de las actividades prácticas.

Por Aprobación: asistencia al 85 % de las clases presenciales, aprobación de las actividades prácticas y exposición de un caso de descubrimiento y/o desarrollo de un fármaco.

Número de vacantes mínimo: 5 inscriptos.

Requisitos de cursado

Dirigido a Farmacéuticos, Lic. en Química, Bioquímicos y otros profesionales del área de la Salud y alumnos de Doctorado en Farmacia.

Modalidad de dictado

El curso es de modalidad presencial y teórico-práctico. Se dictará desde el lunes 22 de octubre al viernes 02 de noviembre, de 13,30 a 17 horas. Se desarrollarán los aspectos más relevantes en el descubrimiento, diseño y desarrollo de fármacos mediante la explicación teórica de cada tema.

Las clases teórico-prácticas consistirán en el análisis, resolución y discusión de casos prácticos y problemas.

Construcción y visualización de estructuras moleculares utilizando de softwares de acceso libre. Cálculo de propiedades fisicoquímicas.

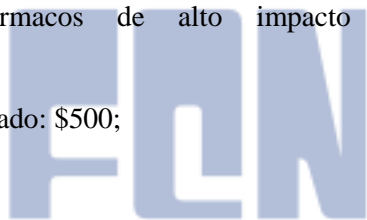
Análisis de casos modelo en el descubrimiento y desarrollo de fármacos de alto impacto terapéutico.

Aranceles

Alumnos de Doctorado: \$500;

Docentes: \$ 1000;

Externos \$ 1500.



Sitio Web: www.fcn.unp.edu.ar

Email de contacto: seip@unpata.edu.ar



Informes e inscripciones

Facultad de Ciencias Naturales Y
Ciencias de la Salud
Universidad Nacional de la
Patagonia San Juan Bosco

Email: seip@unpata.edu.ar

Web: www.fcn.unp.edu.ar

Teléfono: (0297) 4550339
Ciudad Universitaria – Km 4
Ruta Provincial Nro. 1
Segundo Piso

Comodoro Rivadavia
Provincia del Chubut
República Argentina

Consultas:

gpinto@unpata.edu.ar



Curso de posgrado

**“DESCUBRIMIENTO, DISEÑO Y DESARROLLO DE
FARMACOS.”**

22 de octubre al 02 de noviembre de 2018

Universidad Nacional
de la Patagonia
San Juan Bosco

Curso de Posgrado Estructurado

“DESCUBRIMIENTO, DISEÑO Y DESARROLLO DE FARMACOS.”

22 de octubre al 02 de noviembre de 2018

Horario: 13,30 a 17,00 h.

Directora y Coordinadora: Dra. Graciela Pinto Vitorino.

Profesor Colaborador: Dr. Alfio Zambon.

Objetivo

Lograr que el alumno comprenda de las bases racionales, criterios y métodos empleados en la búsqueda, descubrimiento y diseño de nuevos fármacos, e interprete de las relaciones entre las propiedades fisicoquímicas y estructurales con la actividad biológica.

Contenidos mínimos

Aspectos generales de la Química Medicinal. Nomenclatura y clasificación de los fármacos. Acción de los fármacos. Interacciones entre fármacos y sus dianas biológicas. Estrategias en la búsqueda de nuevos fármacos. Modificación molecular como método para la búsqueda de fármacos. Diseño de fármacos biorreversibles. Relaciones cuali y cuantitativas entre la estructura química y la actividad biológica. Nuevas tecnologías en el diseño de fármacos.

Programa analítico

1. Aspectos generales de la Química Medicinal. Definición y objetivos. Desarrollo histórico. Conceptos básicos. Relación con otras disciplinas. Etapas en el desarrollo de un fármaco y de un medicamento.
2. Nomenclatura de fármacos. Denominación Común Internacional (DCI). Nombres comunes seleccionados por la ISO (International Standards Organization). Comités Nacionales de Nomenclatura. Marcas registradas.
3. Acción de los fármacos. Propiedades fisicoquímicas y actividad farmacológica. Naturaleza de la membrana biológica. Modelos fisicoquímicos que explican el transporte a través de membranas. Solubilidad en agua. Grado de ionización. Solubilidad en lípidos: coeficiente de reparto. Predicción de la absorción oral a partir de las propiedades fisicoquímicas. Reglas de Lipinski. Fijación a proteínas plasmáticas. Procesos metabólicos de Fase I y II. Consecuencias de los procesos metabólicos de los fármacos. Selectividad esteroquímica de los procesos metabólicos.

4. Interacciones entre fármacos y sus dianas biológicas. Concepto de diana biológica. Naturaleza química. Enlaces de fármacos con sus dianas biológicas. Topología molecular y actividad biológica: configuración y conformación.

5. Estrategias en la búsqueda de nuevos fármacos. Principales procedimientos para el descubrimiento de nuevos fármacos. Búsqueda de líderes y prototipos. Estudio u observación fortuita de los efectos biológicos de productos de origen natural o sintético. Cribado sistemático. Mejora de los fármacos ya existentes. Diseño racional. Contribución de la biotecnología y de la genómica al diseño de fármacos.

6. La modificación molecular como método para la búsqueda de fármacos. Finalidad de la modificación molecular. Modalidades de modificación molecular de la molécula líder. Criterios clásicos en la modificación de estructuras modelo. La relación estructura-actividad. Preparación de derivados hidrosolubles. Incorporación de fragmentos hidrófilos. Solubilización por formación de sales: importancia del contraión. Polimorfismo y solubilidad.

7. Diseño de fármacos biorreversibles. Métodos para el diseño de profármacos. Aproximaciones al diseño de profármacos en relación con el transporte, la absorción, la distribución, la excreción y el metabolismo.

8. Relaciones cuali y cuantitativas entre la estructura química y la actividad biológica. Descriptores de las propiedades fisicoquímicas: parámetros electrónicos, estéricos e hidrofóbicos. Modelo QSAR. Ecuación de Hansch. Modelos subestructurales y secuenciales en la optimización de series.

9. Nuevas tecnologías en el diseño de fármacos. Modelización molecular: Generación de estructuras tridimensionales. Optimización geométrica. Análisis conformacional. Propiedades electrónicas. Métodos de comparación. Modelado de las interacciones fármaco-receptor. Búsqueda por farmacóforos. Difracción de rayos X y resonancia magnética nuclear. Relaciones cuantitativas estructura-actividad tridimensionales (3D-QSAR).

Bibliografía

- Patrick, G.L. “An Introduction to Medicinal Chemistry”, 6° Ed. Oxford University Press. New York. 2017.
- Wermuth, C.G. “The Practice of Medicinal Chemistry”, 4° Ed. Academic Press. USA. 2015.
- Hill, R.G.; Rang, H.P. “Drug Discovery & Development. Technology in transition”, 2° Ed. Elsevier: China. 2012.
- Lemke T., Williams D.A. “Foye’s Principles of Medicinal Chemistry”. 7ª edición. USA: Editorial Lippincott Williams & Wilkins; 2013.
- Raviña Rubira, E. “Medicamentos. Un viaje a lo largo de la evolución histórica del descubrimiento de Fármacos”. Vol: I y II. Universidad de Santiago de Compostela, Servicio de Publicaciones e Intercambio Científico: España. 2008.
- Delgado Cirilo, C.; Minguillón Llombart, J.; Joglar Tamargo. “Introducción a la Química Terapéutica”, 2° Ed. Díaz de Santos. España. 2003.
- Avendaño, C. (Coord.). “Introducción a la Química Farmacéutica”, 2° Ed. Interamericana. Mc. Graw-Hill. Madrid. 2001.
- Wilson y Gisvold. “Textbook of Organic, Medicinal and Pharmaceutical Chemistry”, 12° Ed. Lippincott-Raven. USA. 2011.
- David, A.; Ward, S. *The Handbook of Medicinal Chemistry: Principles and Practice*. The Royal Society of Chemistry: UK. 2015.
- Barreiro E.J.; Manssour Fraga, C.A. “Química Medicinal as Bases Moleculares da Ação dos Fármacos”, 2° edición. ARTMED: Porto Alegre, 2008.
- Material bibliográfico elaborado por los docentes del curso.

Publicaciones periódicas:

Journal of Medicinal Chemistry,
European Journal of Medicinal Chemistry.
Bioorganic & Medicinal Chemistry, entre otras.