

UNIVERSIDAD NACIONAL DEL SUR					1/5
BAHIA BLANCA		ARGENTINA			
DEPARTAMENTO DE QUÍMICA					
PROGRAMA DE: QUIMICA DE LOS HETEROCICLOS ORIENTADA A LA SÍNTESIS DE FÁRMACOS				CÓDIGO: 6317	
				ÁREA NRO: II	
H O R A S D E C L A S E				PROFESOR/A RESPONSABLE	
TEÓRICAS		PRÁCTICAS		Dr. Darío C. Gerbino	
Por semana	Por cuatrimestre	Por semana	Por cuatrimestre		
3	48	1.5	24		
A S I G N A T U R A S C O R R E L A T I V A S P R E C E D E N T E S					
A P R O B A D A S			C U R S A D A S		
QUÍMICA ORGÁNICA B (6387)					
DESCRIPCIÓN / OBJETIVOS					
<p>La Química de los heterociclos es una de las áreas más importantes y atractivas de la Química Orgánica, a partir de la cual es posible la generación de compuestos dotados de una diversidad estructural muy alta, desempeñando un papel central en una multitud de áreas altamente desarrolladas tales como la Química Fina, Química Medicinal, Agroquímica entre otras.</p> <p>Esta asignatura está dirigida y adaptada a las necesidades curriculares de los estudiantes de Licenciatura en Química. El propósito central de la misma es introducir al alumno en los conceptos básicos de la Química Orgánica Heterocíclica destacando la importancia de los sistemas heterocíclicos como fuente promisoría en la construcción de moléculas biológicamente activas. El primer bloque temático está destinado a comprender el comportamiento químico de los compuestos heterocíclicos elementales, en especial los heterociclos aromáticos, relacionándolos con su estructura-reactividad. El segundo módulo comprende la síntesis de fármacos heterocíclicos, a través de la aplicación de tácticas y estrategias actuales basadas en los criterios del método de la desconexión, el cual posibilita la generación de múltiples propuestas sintéticas para una molécula objetivo mediante la desconexión de enlaces. Los conceptos fundamentales de la Química Heterocíclica se presentan en forma gradual bajo la idea de emplear a los sistemas heterociclos como plataforma estructural en la generación de fármacos.</p>					
PROGRAMA SINTÉTICO					
<p>Tema 1: Sistemas heterocíclicos.</p> <p>Tema 2: Heterociclos aromáticos π-excedentes con un heteroátomo.</p> <p>Tema 3: Heterociclos aromáticos π-excedentes con más de un heteroátomo.</p> <p>Tema 4: Heterociclos aromáticos π-deficientes con un heteroátomo.</p> <p>Tema 5: Heterociclos aromáticos π-deficientes con más de un heteroátomo.</p> <p>Tema 6: Síntesis de fármacos heterocíclicos.</p> <p>Tema 7: Síntesis de fármacos que contienen sistemas heterocíclicos no aromáticos.</p> <p>Tema 8: Síntesis de fármacos que contienen sistemas heterocíclicos aromáticos no condensados.</p> <p>Tema 9: Síntesis de fármacos heteropolicíclicos condensados.</p> <p>Tema 10: Estado actual de la Química Heterocíclica.</p>					
VIGENCIA AÑOS	2022				

BAHIA BLANCA

ARGENTINA

DEPARTAMENTO DE QUÍMICA

PROGRAMA DE: QUÍMICA DE LOS HETEROCICLOS
ORIENTADA A LA SÍNTESIS DE FÁRMACOS

CÓDIGO: 6317

ÁREA NRO: II

PROGRAMA ANALÍTICO**TEMA 1**

Sistemas heterocíclicos. Importancia de los heterociclos en la naturaleza. Heterociclos y farmacología. Clasificación de los heterociclos. Estructura. Aromaticidad. Propiedades físicas. Reactividad. Síntesis: estrategias y procesos más relevantes. Nomenclaturas de reemplazamiento, IUPAC y Hantzsch-Widman: monociclos, policiclos condensados y compuestos puente.

TEMA 2

Heterociclos aromáticos π -excedentes con un heteroátomo. Introducción. Pirrol. Métodos sintéticos del sistema anular. Reactividad. Pirroles sustituidos. Porphirinas y productos naturales relacionados. Furano: Síntesis y reactividad. Furanos sustituidos. Tiofeno: Síntesis y reactividad. Propiedades de algunos tiofenos sustituidos. Síntesis de algunos compuestos de importancia natural y farmacológica.

TEMA 3

Heterociclos aromáticos π -excedentes con más de un heteroátomo. Introducción. Imidazoles, Oxazoles, Tiazoles: Síntesis y reactividad. Pirazoles, Isoxazoles, Isotiazoles: Síntesis y reactividad. Benzoderivados.

TEMA 4

Heterociclos aromáticos π -deficientes con un heteroátomo. Introducción. Piridina. Métodos sintéticos del anillo. Carácter básico y nucleófilo. Reactividad del sistema anular y de las cadenas laterales. N-óxidos de piridina. Derivados de interés. Sales de pirilio. Síntesis del anillo. Reactividad. Aplicaciones sintéticas. Derivados.

TEMA 5

Heterociclos aromáticos π -deficientes con más de un heteroátomo. Introducción. Aspectos generales de la química de las diazinas, triazinas y tetrazinas. Piridazina. Síntesis. Propiedades químicas. Pirimidina. Síntesis. Propiedades químicas. Purinas. Derivados de interés. Nucleósidos, nucleótidos y ácidos nucleicos. Oxazinas y Tiazinas. Síntesis. Reactividad. Derivados.

TEMA 6

Síntesis de fármacos heterocíclicos. Introducción. Formación de enlaces carbono-halógeno. Formación de enlaces carbono-oxígeno y carbono azufre. Formación de enlaces carbono-nitrógeno. Construcción de sistemas heterocíclicos: ciclación intramolecular y ciclación intermolecular.

TEMA 7

Síntesis de fármacos que contienen sistemas heterocíclicos no aromáticos. Métodos sintéticos y diseño de síntesis. Fármacos antihistamínicos con estructura de 1,2-diamina y de piperazina. Analgésicos opiodes. Derivados cíclicos de la urea y compuestos relacionados: fármacos derivados del ácido barbitúrico. Dihidropiridinas antihipertensivas.

VIGENCIA AÑOS 2022

BAHIA BLANCA

ARGENTINA

DEPARTAMENTO DE QUÍMICA

PROGRAMA DE: QUÍMICA DE LOS HETEROCICLOS
ORIENTADA A LA SÍNTESIS DE FÁRMACOS

CÓDIGO: 6317

ÁREA NRO: II

TEMA 8

Síntesis de fármacos que contienen sistemas heterocíclicos aromáticos no condensados. Familias representativas de fármacos utilizados en quimioterapia. Síntesis de nitrofuranos, sulfonamidas y compuestos relacionados

TEMA 9

Síntesis de fármacos heteropolicíclicos condensados. Fármacos antihistamínicos y antipsicóticos derivados de la fenotiazina. Antisicóticos derivados de tioxanteno. Antidepresivos tricíclicos. Benzodiazepinas y compuestos relacionados. Quinolonas antisépticas y antimaláricas. Semisíntesis de antibióticos β -lactámicos.

TEMA 10

Estado actual de la Química Heterocíclica. Bioprocesos. Heterociclos en la industria y en el desarrollo de tecnologías innovadoras. Ecología y Química Verde. Descubrimiento de medicamentos de amplia acción terapéutica. Heterociclos como sensores moleculares.

PROGRAMA DE TRABAJOS PRÁCTICOS

1. Guías de Problemas relacionados con los temas del programa teórico de la asignatura.
2. Seminarios: Presentación y discusión de casos prácticos.
3. Elaboración y exposición de un trabajo monográfico relacionado con el estado actual de los sistemas heterocíclicos en la fabricación de medicamentos y desarrollo de tecnologías.

VIGENCIA AÑOS 2022

METODOLOGÍA DE LA ENSEÑANZA

Las actividades formativas del curso Química de los heterociclos orientada a la síntesis de fármacos que se han planificado para cada tema se han dividido en clases expositivas y seminarios o clases de problemas. Las exposiciones o clases magistrales de los contenidos tienen por objetivo proporcionar la información nueva de cada tema. Los seminarios se utilizan para resolver preguntas y problemas que complementan la información aportada en cada tema. Además, sirve al profesor de control sobre el nivel de recepción y de trabajo personal del alumno. A su vez, se abordan ejemplos representativos y diversas estrategias relevantes sobre la síntesis de fármacos heterocíclicos. Como actividad adicional, se propone la búsqueda bibliográfica y elaboración de un trabajo sobre los contenidos de la asignatura. De esta manera, se pretende desarrollar en el alumno el análisis crítico de los resultados y el aprendizaje de habilidades relacionadas con el uso de herramientas de búsqueda dirigidas (Pubmed, ScienceDirect, etc.). La ejercitación planificada en las guías de problemas tiende a fomentar el pensamiento lógico y el razonamiento deductivo del alumno.

El proceso de enseñanza-aprendizaje se completa con tutorías grupales donde será posible una comunicación personal y directa profesor-alumno que sirva para guiar el estudio del alumno en la materia, así como para conocer y desarrollar sus motivaciones y actitudes.

FORMA DE EVALUACIÓN

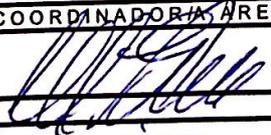
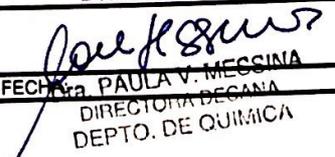
Se tendrá en cuenta la participación activa de los estudiantes en las clases y en el desarrollo de las actividades propuestas. La asistencia a las prácticas de laboratorio es de carácter obligatorio. Los conocimientos de la asignatura se evaluarán mediante dos exámenes parciales de promoción. Los alumnos que no promocionen rendirán por la modalidad de examen final, y aquellos que no alcancen el mínimo de aprobación rendirán un examen recuperatorio general.

BIBLIGRAFIA BÁSICA

- A.F. Pozharskii, A. T. Soldatenkov y A. R. Katritzky, "Heterocycles in Life and Society", Wiley, 2011.
- J. J. Li, "Heterocyclic Chemistry in Drug Discovery", Wiley, 2013.
- J. J. Li, "Name Reactions in Heterocyclic Chemistry (I y II)", Wiley, 2004 y 2011.
- D. S. Johnson, J. J. Li, (a) "The Art of Drug Synthesis", Wiley, 2007. (b) "Modern Drug Synthesis", Wiley, 2010.
- J. A. Joule y K. Mills, "Heterocyclic Chemistry", Blackwell Science, 2010.
- R.S. Vardanyan, V.J. Hruby, "Synthesis of Essential Drugs". Elsevier, 2006.
- T.L. Gilchrist, "Química Heterocíclica", Addison-Wesley Iberoamericana, 1995.
- R. Montalvo González, M. Salinas Mardueño, E. M. Becerra Verdín, A. Barrón Jaime, "Química Orgánica: Introducción a la Química Heterocíclica", Universidad Autónoma De Nayarit, 2013.
- L. D. Quin, J. A. Tyrell, "Fundamentals of Heterocyclic Chemistry", Wiley, 2010.
- P. A. Jacobi, "Introduction to Heterocyclic Chemistry", Wiley, 2018.
- J. Alvarez-Builla, J. J. Vaquero y J. Barluenga, "Modern Heterocyclic Chemistry", Wiley, 2011.
- J. I. Borrell, J. Teixidó, J. L. Falcó, "Síntesis Orgánica", Síntesis, 2003.
- G. Brahmachari (Editor), "Green Synthetic Approaches for Biologically Relevant Heterocycles", Elsevier, 2015.

AÑO	PROFESORA RESPONSABLE (firma aclarada)	AÑO	PROFESORA RESPONSABLE (firma aclarada)
2022	Dr. Darío C. Gerbino		
			Darío Gerbino

VISADO

COORDINADORA/A ÁREA	SECRETARÍA/A ACADÉMICA/A	DIRECTORA/ DECANO/A
	Dr. PABLO G. DEL ROSSO SECRETARÍA ACADÉMICA DEPTO. DE QUIMICA	
FECHA:	FECHA:	FECHA:

CRISTIAN
VITORE

PAULA V. MESSINA
DIRECTORA/ DECANA
DEPTO. DE QUIMICA