introducción

Farmacia y Química Terapéutica

FARMACIA

- **Ciencia aplicada**
- **Ciencia del MEDICAMENTO en sus vertientes de:** descubrimiento, preparación, manejo, evaluación, control, dispensación, empleo, vigilancia

FÁRMACO = principio activo del MEDICAMENTO
= compuesto químicamente puro, de estructura bien definida, con utilidad terapéutica o de diagnóstico

QUÍMICA TERAPÉUTICA: OBJETIVO = estudio químico de los fármacos

FIN ÚLTIMO = proporcionar los conocimientos necesarios para la *CREACIÓN DE NUEVOS FÁRMACOS*

LA QUÍMICA TERAPÉUTICA SE RELACIONA CON:

QUÍMICA ORGÁNICA = la mayoría de los fármacos son productos orgánicos

BIOQUÍMICA = entronque biológico

FARMACOGNOSIA = las DROGAS son materia prima natural que contiene uno o varios principios activos

FARMACOLOGÍA = evaluación de nuevos compuestos activos

FARMACOLOGÍA MOLECULAR = evalua los efectos biológicos a nivel molecular

MICROBIOLGÍA = relación entre fármacos y microorganismos

TOXICOLOGÍA = transformaciones metabólicas de los fármacos

La consecución de los objetivos propuestos en **Química Terapéutica** requiere tres etapas clave:

a) El **descubrimiento** identificación de nuevos principios activos, generalmente llamados *cabezas de serie*

1. La **optimización** modificación química del compuesto *cabeza de serie*.

c) El **desarrollo** optimización de los procesos que permitan la obtención del fármaco en grandes cantidades
optimización de sus propiedades farmacocinéticas o galénicas, de forma que resulten más adecuadas para su uso terapéutico.

Alcance de la Química Terapéutica

En sus orígenes, la Química Terapéutica se centró fundamentalmente en las modificaciones químicas simples de moléculas de origen natural

Las tendencias actuales en ***DISEÑO DE NUEVOS FÁRMACOS*** están orientadas hacia el estudio de las interacciones de los fármacos con sus estructuras diana a nivel molecular.

Ello ha sido debido, fundamentalmente, a la **mayor sofisticación estructural de los compuestos cabeza de serie**, que puede atribuirse, al menos en parte:

Al desarrollo experimentado por la Química Orgánica durante las últimas décadas.

nuevos métodos sintéticos estereoselectivos

procesos sintéticos automatizados

métodos cromatográficos de elevada resolución

y métodos de análisis estructural

Por otra parte, el desarrollo de la Biología Molecular y de la Ingeniería Genética ha permitido el estudio detallado de

moléculas diana en la acción de los fármacos

enzimas receptores de membrana ácidos nucleicos.

En muchos casos se han llegado a **determinación tridimensional del centro activo**

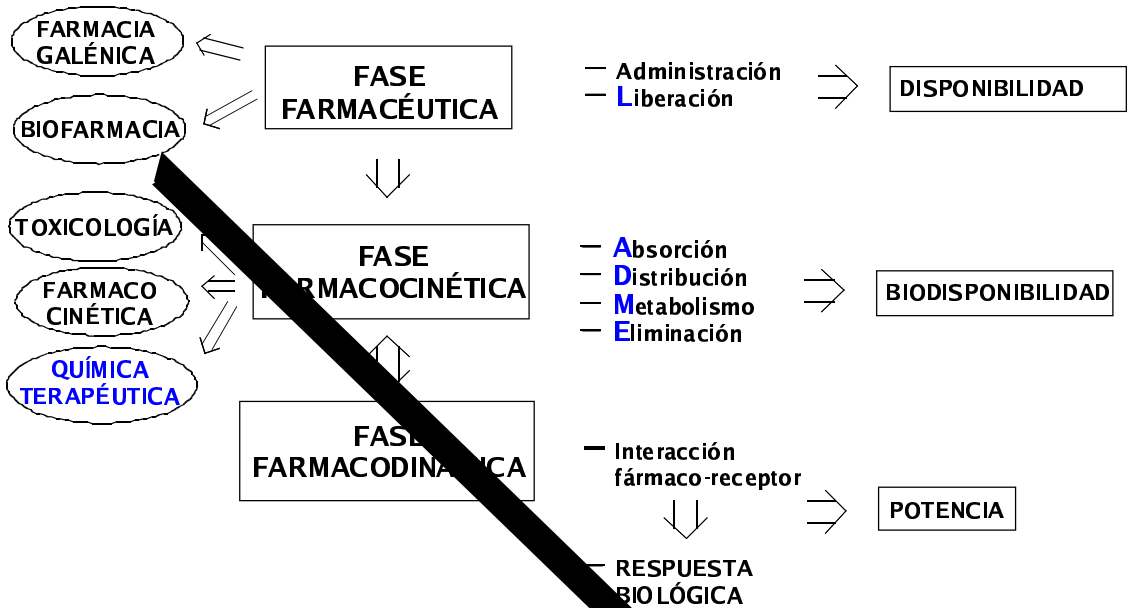
Por esta razón, en la actualidad, una parte del diseño de nuevos fármacos se basa en los resultados de modelización tridimensional derivados del estudio de la interacción fármaco-receptor.

OPTIMIZACIÓN DE LOS FÁRMACOS CONOCIDOS, es necesario tener en cuenta los aspectos fundamentales relacionados con la

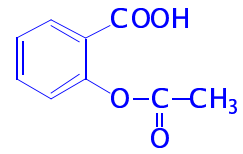
forma farmacéutica empleada en su administración

curso que éste pueda seguir en su paso por el organismo

FASES EN LA ACCIÓN DE UN MEDICAMENTO



UN EJEMPLO ILUSTRATIVO



ácido acetilsalicílico

Recursos galénicos para mejorar la **biodisponibilidad**

Para las formas de absorción oral se requerirá la

micronización de su forma cristalina hasta un polvo ultrafino de elevada velocidad de disolución

o bien una *combinación galénica con antiácidos o sustancias tampón*, a fin de formar localmente salicilatos solubles.

Si se administra por vía no oral, se requiere la combinación del ácido acetilsalicílico con un compuesto débilmente básico y soluble, como el aminoácido lisina

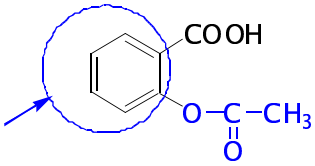
. En todos los casos, se incluye el principio activo en una forma galénica apta para su administración (medicamento), cuyas características galénicas determinan

la concentración plasmática,

el tiempo requerido para alcanzarla y,

por tanto, su eficacia terapéutica.

Recursos químicos para mejorar la **biodisponibilidad**



ácido acetilsalicílico

cambio del resto acilo en el ácido acetilsalicílico

incorporación de sustituyentes en el anillo aromático

pueden modificar considerablemente sus propiedades físico-químicas

alterando la velocidad de disolución

velocidad de paso a través de las membranas lipídicas

o velocidad de eliminación.

Conclusión: un cambio químico en la molécula de un fármaco afecta simultánemente a todas las fases de su acción.

1.3. Nomenclatura de los fármacos

Necesidad de establecer criterios de carácter general que permitan la identificación de los fármacos de una manera racional.

Dada la naturaleza química de los mismos, su **nomenclatura sistemática** se basa en las mismas reglas que las de cualquier otro compuesto químico, las reglas de la IUPAC.

Los nombres resultantes de la aplicación de tales reglas pueden resultar extremadamente largos, difíciles de memorizar, prácticamente desprovistos de sentido para los no especialistas en la materia y, desde un punto de vista terapéutico, carentes de información acerca de la utilidad del compuesto así nombrado.

1.3.1. La Denominación Común Internacional (DCI)

Con objeto de paliar algunos de los inconvenientes anteriores, suelen emplearse los denominados

nombres genéricos o **Denominaciones Comunes Internacionales** (**DCI**)
En líneas generales, las DCI

no deben ser excesivamente largas
deben resultar fáciles de pronunciar y de deletrear
han de mostrar su relación con otras sustancias con el mismo tipo de actividad farmacológica (grupo farmacoterapéutico)
no han de dar lugar a connotaciones anatómicas, fisiológicas o patológicas (por ejemplo, un nombre que empiece por *cáncer*)

1.3.2. Marcas registradas

Los medicamentos, al igual que los restantes productos de consumo, se presentan en forma de marca registrada durante el periodo de explotación de la patente por parte de una determinada empresa farmacéutica.

Especialidades farmacéuticas que contienen paracetamol (DCI)
(fuente: Catálogo de Especialidades Farmacéuticas, Consejo General de Colegios Oficiales de Farmacéuticos, 1999):

Actron®, Analter®, Antidol®, Apiretal®, Dafalgan®, Dolgesic®, Dolostop®, Duorol®, Efferalgan®, Febrectal®, Gelocatil®, Melabon Infantil®, Nofedol®, Panadol®, Pediapirin®, Pirinasol®, Sinmol®, Stopain®, Temperal®, Termalgin®

Tabla 1. Partículas indicativas del grupo farmacológico

Partícula	Grupo farmacológico
-actida	Polipéptidos sintéticos de acción semejante a la corticotrofina
-acetamol	Analgésicos relacionados con el paracetamol
andr	Esteroides andrógenos
-arol	Anticoagulantes del grupo del dicumarol
-azepam	Fármacos del grupo del diazepam
bol	Esteroides anabolizantes
-buzona	Analgésicos antiinflamatorios del grupo de la fenilbutazona
-caína	Anestésicos locales
cef-	Antibióticos derivados del ácido cefalosporánico
-cilina	Antibióticos derivados del ácido penicilánico
cort	Corticosteroides, excepto los del grupo de la prednisolona
-ciclina	Antibióticos del grupo de la tetraciclina
-dipina	Bloqueadores de los canales del calcio derivados de la nifedipina
estr	Fármacos estrogénicos
-fibrato	Fármacos del grupo del clofibrato
-formina	Hipoglucemiantes del grupo de la fenformina
gest	Esteroides progestágenos
gli-	Sulfonamidas hipoglucemiantes
-io	Compuestos de amonio cuaternario
-metacina	Fármacos antiinflamatorios del grupo de la indometacina
-micina	Antibióticos producidos por *Streptomyces*
-nidazol	Antiprotozoarios del grupo del metronidazol
-olol	Bloqueadores adrenérgicos beta, del grupo del propranolol
-ónido	Esteroides para uso tópico que contienen un grupo acetónido
-pramina	Fármacos del grupo de la imipramina
-pril(ato)	Inhibidores del enzima convertidor de angiotensina (ECA)
-profeno	Antiinflamatorios del grupo del ibuprofeno
prost	Prostaglandinas
-relina	Péptidos estimulantes de la liberación de hormonas hipofisarias
sulfa-	Sulfonamidas antibacterianas
-terol	Broncodilatadores derivados de la feniletilamina
-tiazida	Diuréticos del grupo de la clorotiazida
-trexato	Antagonistas del ácido fólico
-verina	Espasmolíticos relacionados con la papaverina