El curso «**Los Fármacos son moléculas: diseño, estructura y función**» pretende poner al alcance, para personas con una base moderada de química orgánica, la importancia en los fármacos de su estructura y propiedades físico-químicas, y como una y otras determinan su actividad farmacológica y su función como herramientas terapéuticas. Con este objetivo central, se van a revisar en el curso las fases de diseño y desarrollo de un fármaco, y se prestara atención principal a tópicos como profármacos y fármacos blandos, prestando atención destacada a productos presentes en el mercado español. Aunque no sea ese el objetivo principal, se revisarán ejemplos de biofármacos.

www.uimp.es

GOBIERNO DE ESPAÑA
MINISTERIO DE EDUCACIÓN, CULTURA Y DEPORTE

INFORMACIÓN GENERAL

→ Hasta el 12 de junio de 2015

Santander
Campus de Las Llamas
Avda. de los Castros, 42
39005 Santander
Tel. 942 29 87 00 / 942 29 87 10
Fax 942 29 87 27
informacion@sa.uimp.es

Madrid
C/ Isaac Peral, 23
28040 Madrid
Tel. 91 592 06 31 / 91 592 06 33
Fax 91 592 06 40 / 91 543 08 97
alumnos@uimp.es

Horario
de 9:00 a 14:00 h
de 16:00 a 18:00 h (excepto viernes)

→ A partir del 15 de junio de 2015

Santander
Palacio de la Magdalena
39005 Santander
Tel. 942 29 88 00 / 942 29 88 10
Fax 942 29 88 20

Horario
de 9:00 a 14:00 h
de 15:30 a 18:00 h (excepto viernes)

PLAZOS

→ Plazo de solicitud de becas

Hasta el día 18 de mayo, para los cursos que comiencen antes del 17 de julio de 2015

Hasta el día 15 de junio, para los cursos que comiencen a partir del día 20 de julio de 2015

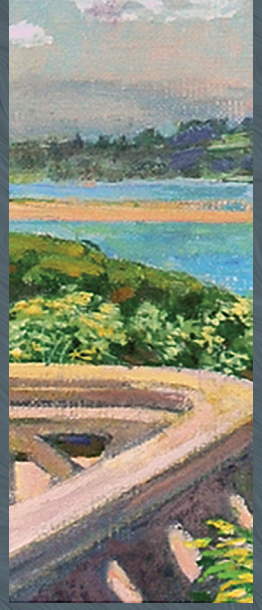
→ Apertura de matrícula

Desde el 8 de abril de 2015
(Plazas limitadas)

@cursosUIMP
fb.com/uimp20

Transporte oficial
IBERIA

→ Código 62Q1 | Tarifa: A | ECTS: 1



UIMP

Universidad Internacional Menéndez Pelayo

Santander 2015

Curso Magistral

Los fármacos son moléculas: diseño estructura y función

Julio Álvarez-Builla Gómez

Santander
Del 7 al 11 de septiembre de 2015

www.uimp.es

Colaboración
fundación Lilly

Patrocinio
Santander UNIVERSIDADES

Los fármacos son moléculas: diseño estructura y función

Dirección
Julio Álvarez-Builla Gómez
Catedrático de Química Orgánica
Universidad de Alcalá de Henares

Del 7 al 11 de septiembre de 2015

Lunes 7

10:00 h | El fármaco. Concepto. Proceso de desarrollo. Origen y procedencia de los fármacos que llegan al mercado. Cribado de moléculas a lo largo del proceso

12:00 h | Diseño de fármacos I: La búsqueda de un cabeza de serie 01. Elección de enfermedad, diana, bioensayo. Especificidad y selectividad. Búsqueda de prototipos cabeza de serie: Cribado de productos naturales. Cribado de muestrotecas. Mejora de fármacos existentes

15:30 h | SEMINARIO 1. Fármacos recientes. Origen, comparación estructuras, metabolismo y metabolitos más abundantes. Cálculos de pKa, Log P de especies neutras e ionizadas. Dimensiones. Otros parámetros

Martes 8

09:30 h | Diseño de fármacos I: La búsqueda de un cabeza de serie 02. Variaciones sobre el ligando natural. Síntesis combinatoria. Diseño por computador. Serendipia. Otras vías de generación de prototipos. Productos Drug-like. Procesos hit-to-lead

12:00 h | Diseño de fármacos II: Mejora de la interacción con la diana. Relaciones estructura-actividad. Identificación de un farmacóforo. Estrategias en diseño de fármacos. Variación de sustituyentes. Extensión de la estructura. Extensión/contracción de cadena y anillo. Variación de anillo. Fusión de anillo. Bioisostería. Simplificación de la estructura. Rigidificación y bloqueo conformacional. Otros recursos. Fármacos siameses

15:30 h | SEMINARIO 2. Desarrollo de prototipos. Análogos vía diversas estrategias, similitudes estructurales y físico-químicas, cambios esperados en el comportamiento

Miércoles 9

09:30 h | Diseño de fármacos III: Mejora del acceso a la diana. Mejora de la absorción. Mejora de la resistencia a la degradación. Disminución de la resistencia a la degradación. Vectorización de fármacos. Reducción de toxicidad. Alianzas de fármacos. Productos endógenos como fármacos

12:00 h | Diseño de fármacos basado en procesos metabólicos. Profármacos y fármacos blandos conceptos y tipos. Profármacos (Prodrugs) ejemplos y objetivos. Fármacos blandos (Soft drugs), ejemplos y objetivos. Fármacos duros

15:30 h | SEMINARIO 3. Profármacos: Ejemplos. Cambios físico-químicos que explican el comportamiento

Jueves 10

09:30 h | Diseño de fármacos basado en procesos metabólicos. Profármacos y fármacos blandos conceptos y tipos. Profármacos (Prodrugs) accidentales y profármacos de diseño. Fármacos blandos (Soft drugs), ejemplos y objetivos. Fármacos duros

12:00 h | Profármacos unidos a transportador. Aplicaciones prácticas. Mejora de la biodisponibilidad, solubilidad y estabilidad. Liberación en zonas específicas. Duración prolongada. Profármacos en cascada. Ejemplos de profármacos en cascada. Profármacos ligados a polímeros

15:30 h | SEMINARIO 4. Fármacos blandos (Soft drugs) Ejemplos. Efectos buscados. Cambios físico-químicos que explican el comportamiento

Viernes 11

09:30 h | Profármacos bioprecursores. Concepto. Vías de generación. Por oxidación, por reducción y mixtos. Ejemplos

12:00 h | Patentes de fármacos. Costes del desarrollo de un fármaco: costes de las fases, costes totales. Megalaboratorios como respuesta. Blockbusters. Control post marketing. El final de la patente (patent cliff). Fármacos genéricos. Control post marketing. La industria farmacéutica. Compañías «innovadoras» y compañías de genéricos. Conclusiones

BIBLIOGRAFÍA BÁSICA

1. P. Krogsgaard-Larsen, T. Liljefors, U. Madsen «Textbook of Drug Design and Discovery» Taylor & Francis, 3ª Ed. London (2002).
2. A. Delgado, C. Minguillón y J. Joglar «Introducción a la Química Terapéutica» 2ª Ed. PPU, Barcelona (2004).
3. T. L. Lemke y D. A. Williams, V. F. Roche, S. W. Zito Eds «Foye's Principles of Medicinal Chemistry» 7th Ed. Walters Kluwer/Lippincott Co. New York (2013).
4. C. G. Wermuth Ed.«The Practice of Medicinal Chemistry» 3rd. Ed. Academic Press, London (2008).
5. G. L. Patrick «An Introduction to Medicinal Chemistry» 5th Ed. Oxford U. Press. Oxford (2013).
6. M. W. Harrold, R. M. Zavod «Basic concepts in Medicinal Chemistry» American Society of Health System Pharmacists. Bethesda (2013).

BIBLIOGRAFÍA ADICIONAL

7. F. Gualtieri «New Trends in Synthetic Medicinal Chemistry» Wiley-VCH. Weinheim (2000).
8. A. Kleemann, J. Engel, B. Kutscher, D Reichert «Pharmaceutical Substances» 5th Ed. Thieme, Berlin (2009).
9. J. Fischer, C. R. Ganellin «Analogue-based Drug Discovery» Wiley VCH. Weinheim (2006).
10. T. Lemke »Review of Organic Functional Groups. Introduction to Medicinal Organic Chemistry» 5th Ed. Walters Kluwer/Lippincott Co. New York (2012).
11. M. C. Desai Ed. «Annual Reports in Medicinal. Chemistry» Vol. 48 Academic Press (2013).