



Universidad Nacional Autónoma de México  
Facultad de Química  
Secretaría de Extensión Académica  
Coordinación de Actualización Docente, CAD



Curso

## **Los principios activos de los productos naturales como medicamentos**

20 horas, en 5 sesiones presenciales del 26 al 30 de junio; horario de 10:00 a 14:00 horas

A desarrollarse en el Colegio de Ciencias y Humanidades, plantel Sur, laboratorio C5

Ponentes:

**Dra. María Isabel Aguilar Laurents, Dr. José Luis Balderas López, C. a Dr. Viridiana Gisela Llera Rojas y Dr. Francisco Hernández Luis**

### **Introducción**

Históricamente, los productos naturales han sido considerados como materias primas valiosas para su uso en el tratamiento de numerosas enfermedades por las diferentes culturas del mundo. Gracias al progreso de la ciencia es que se han podido aislar en muchos casos los compuestos químicos responsables de las actividades biológicas conferidas a esos productos naturales, y por procedimientos experimentales adecuados, se ha logrado la elucidación estructural de esos principios. Así, también se ha logrado la comprobación de su eficacia terapéutica y su inocuidad mediante experimentos farmacológicos apropiados y de toxicidad. Con esta información se procede a realizar la caracterización de las propiedades fisicoquímicas de los compuestos activos para así determinar la mejor ruta de administración, la forma farmacéutica más adecuada y la formulación más estable por medio de la tecnología farmacéutica. Los estudios de estructura química-actividad biológica han derivado en la posibilidad de la obtención tanto de compuestos farmacológicamente activos como de fármacos con mejor actividad provenientes de síntesis orgánicas, de modificación estructural de los compuestos naturales o por síntesis de compuestos análogos. El propósito del curso, es proporcionar al profesor asistente una idea global de los medicamentos, de origen natural o sintético.

### **Objetivos**

#### **El profesor asistente:**

- ✓ Reconocerá que los medicamentos, en especial los que provienen de los productos naturales, están constituidos por una gran variedad de compuestos de carbono, cuya función y propiedades depende de la estructura que presentan.
- ✓ Construirá modelos de moléculas sencillas de algunos compuestos del carbono para reconocer diferencias estructurales entre ellas, a fin de comprender la variedad de propiedades y funciones de dichos compuestos.
- ✓ Reconocerá la importancia del uso adecuado de los medicamentos provenientes de los productos naturales.
- ✓ Reconocerá el papel de los procesos de análisis y síntesis químicos en el desarrollo de medicamentos de origen natural para valorar su impacto en la calidad de vida.

### Planeación de las sesiones presenciales

# Sesión/Fecha	Nombre de la sesión	Breve descripción	Productos/evidencias de aprendizaje a obtener en la sesión
1/26 de junio	Productos de la medicina tradicional y su aplicación como remedios o como medicamentos para la cura de padecimientos. Conocimiento de las propiedades curativas de las plantas con valor para la sociedad y como un primer referente para la investigación científica	Definición de términos relacionados con productos de la medicina tradicional y con productos naturales, criterios de clasificación de los mismos, clasificación química de los principios activos de los productos naturales, contribución de los fármacos de origen natural en la medicina y en farmacia, criterios de selección de productos naturales para la búsqueda de nuevos medicamentos. Plantas selectas empleadas en la fitoterapia: valeriana, hierba de San Juan, pasiflora, ginseng, ginkgo biloba, rhodiola, manzanilla, equinácea, aloe vera, aceites esenciales de menta y alcanfor, entre otros.	Conocimiento de la importancia de los fármacos naturales y sintéticos en el área terapéutica. Interrelación entre fármacos naturales, sintéticos y de semisíntesis
2/27 de junio	Descripción de la extracción de un principio activo de alguna planta como menta, eugenol, capsaicina, cafeína, etcétera, destacando su uso terapéutico. El papel del análisis químico para determinar la fórmula estructural del principio activo.	Operaciones preliminares a la preparación de extractos de productos naturales, métodos de extracción más empleados para su preparación y fraccionamiento. Separación, purificación e identificación de principios activos.	Conocimiento sobre procedimientos para obtener en forma pura principios activos a partir de fuentes naturales y los métodos para su caracterización.
3/28 de junio	Descripción del procedimiento para identificar el potencial de la molécula como principio activo (pruebas in vitro, en modelos animales, protocolos de investigación, extrapolación de resultados, etc.).	Proporcionar las bases para el entendimiento de la acción de los fármacos y su relación con los efectos farmacológicos globales y con sus aplicaciones clínicas.	Conocimiento acerca de los factores estructurales que influyen para una respuesta farmacológica específica por parte de uno o más fármacos.
4/29 de junio	El diseño del medicamento con base al principio activo identificado (dosis, presentación, vía de administración, fecha de caducidad y disposición final).	Consideraciones biofarmacéuticas para la selección de la vía más adecuada de administración. Estudios básicos de preformulación para el desarrollo de un medicamento estable. Función de los excipientes en un medicamento	Conocimientos acerca de los factores que influyen en el desarrollo de un medicamento estable, así como su disposición final.

		Disposición final de un medicamento	
5/30 de junio	La importancia de la modificación de un principio activo, enfatizando en la estructura química de los reactivos, la reactividad de sus grupos funcionales, en la transformación de grupos funcionales de reactivos a productos, en la formación de una nueva sustancia y su beneficio para la sociedad y el papel de la síntesis y el análisis químico en el desarrollo de los remedios y de los medicamentos.	En la sesión se presentarán los principios básicos que se aplican para modificar la estructura química de un compuesto que ha presentado alguna actividad biológica. La intención de estas modificaciones es encontrar nuevos compuestos con mayor potencia en su actividad.	<ul style="list-style-type: none"> <li>a) Los valores de los parámetros de la regla de Lipinsky para una serie de cinco moléculas proporcionada al alumno.</li> <li>b) La propuesta de una serie de compuestos, por parte del estudiante, donde se manifieste la importancia de la influencia de sustituyentes electroattractores, electrodonadores y estéricos sobre la estructura base de una molécula activa.</li> <li>c) Un cuestionario con reactivos elaborados para evaluar la comprensión de conceptos en el diseño de moléculas bioactivas utilizando para su evaluación la elección de la respuesta correcta entre cuatro alternativas.</li> </ul>

### **Metodología de trabajo**

Si les parece, pueden describir cómo se desarrollarán o llevarán a cabo las sesiones (dinámica de trabajo).

#### **1 y 2/26 y 27 de junio.**

- a) Clase magistral por parte de la Prof. María Isabel Aguilar Laurents.
- b) Se pretende paralelamente la discusión de los diferentes temas con los profesores asistentes.
- c) Exposición de dos experimentos para la obtención de fármacos a partir de sus fuentes naturales.

**3/28 de junio.** Se llevarán a cabo las siguientes actividades:

- a) Clase magistral por parte del Prof. José Luis Balderas López.
- b) Realización de un ejercicio (por simulación) sobre una evaluación farmacológica.

**4/29 de junio.** Se desarrollaran las siguientes actividades:

- a) Clase expuesta por la Prof. Viridiana Gisela Llera Rojas
- b) Actividad experimental: Evaluación reológica (densidad aparente y compactada, ángulo de reposo, índice de Hausner) de lactosa monohidratada y avicel PH 102.
- c) Actividad experimental: Fabricación de un jarabe.

**5/30 de junio.** Las actividades a desarrollar en esta sesión serán:

- a) Clase presencial expuesta por el Prof. Francisco Hernández Luis
- b) Realización de un ejercicio de aplicación de la regla de Lipinsky para el diseño de nuevas moléculas participando los alumnos en la resolución de un problema en el pizarrón
- c) Dada una lista de estructuras químicas, el alumno participante calculará el valor del coeficiente de partición
- d) Elaboración de una lista de estructuras químicas para demostrar

### **Materiales de trabajo para el desarrollo del curso**

(Indicar los materiales a usar en el caso de presentar o desarrollar algún experimento sencillo).

**1 y 2/26 y 27 de junio.**

Se proporcionará un guión que será utilizado como material de apoyo en la clase, así como el protocolo de un experimento para la obtención del principio activo de un producto natural. El experimento será explicado, analizado y discutido en la clase.

**3/28 de junio.**

Se proporcionará un guión que será utilizado como material de apoyo. Se proyectará un pequeño video sobre un experimento farmacológico.

**4/29 de junio.**

- a) Se proporcionará a los participantes el material que será utilizado durante la sesión.
- b) Es importante que los participantes cuenten con calculadora y una hoja de papel milimétrico.
- c) El aula deberá contar con servicio de WiFi para proyectar videos a los asistentes.
- d) Para el experimento de reología los participantes se agruparan en equipos de 4, es indispensable que cada equipo cuente con dos probetas de 100mL.
- e) Para la fabricación del jarabe los equipos deben contar con dos vasos de precipitados de 250mL, un vaso de precipitados de 100mL, una probeta de 100mL y dos varillas de vidrio.  
\*Los excipientes serán proporcionadas por la profesora.

### **5/30 de junio.**

- a) A los estudiantes se les proporcionará el material que será utilizado en la presentación de la clase presencial
- b) Será necesario contar con servicio de WiFi para acceder a los programas de cómputo, en los teléfonos celulares o tabletas de los estudiantes.
- c) Los alumnos deben traer en sus celulares la aplicación de la calculadora básica.
- d) Hojas de papel y lápiz para dibujar estructuras y hacer operaciones aritméticas.

### **Evaluación (retroalimentación y nota)**

Indicar cómo, cuándo y con qué se va a evaluar, por sesión, si es el caso, y por curso. En cada producto que se solicitará al profesor/alumno (o a los equipos) se deben indicar las características que debe tener el producto.

Si se pretende solicitar un trabajo integrador al final del curso, indicar las características y fecha de entrega.

### **1 y 2/26 y 27 de junio.**

Se llevará a cabo mediante la aplicación de un cuestionario al finalizar la segunda sesión.

### **3/28 de junio.**

Se llevará a cabo mediante la aplicación de un cuestionario al finalizar la sesión.

### **4/29 de junio.** La evaluación consistirá en:

- a) La aplicación de un cuestionario al finalizar la sesión. (40%)
- b) La discusión de los resultados obtenidos en el experimento de reología. Deberán indicar el tipo de flujo que presenta el producto evaluado. (30%)
- c) La presentación del jarabe obtenido. Deberán identificar la función de cada componente y la importancia del orden de adición de los mismos. (30%)

### **5/30 de junio.** Esta sesión será evaluada mediante:

- a) La aplicación de un cuestionario al finalizar la misma (50%)
- b) Presentación del cálculo de coeficiente de partición y regla de Lipinsky de las estructuras químicas que le serán proporcionadas (25%)
- c) La presentación de la propuesta que el estudiante realice sobre el diseño de derivados de una estructura prototipo (25%).

### **Bibliografía, (libros, artículos y páginas web)**

- Presentar las fuentes a usar durante el curso, bajo reglas APA.
- Enviar las lecturas a usar en cada una de las 5 sesiones.

**1 y 2/26 y 27 de junio.** Kuklinski, C. Farmacognosia. Estudio de las Drogas y Sustancias Medicamentosas. Ediciones Omega, Barcelona (2000)

**1. 3/28 de junio.** Florez J. 2013. Farmacología Humana. 6a ed. Elsevier Masson, España.

**4/29 de junio.** Se proporcionará el material bibliográfico a los asistentes.

**5/30 de junio.** Se proporciona el material bibliográfico a los alumnos.